



República Federativa do Brasil  
Ministério da Economia  
Instituto Nacional da Propriedade Industrial

**(11) PI 0910768-1 B1**



**(22) Data do Depósito: 15/04/2009**

**(45) Data de Concessão: 09/04/2019**

**(54) Título:** DERIVADOS DE 2-[(1H-PIRAZOL-4-ILMETIL)-SULFONIL]-OXAZOL, DERIVADOS DE 2-[(1H-PIRAZOL-4-ILMETIL)-SULFANIL]-OXAZOL E DERIVADOS DE 2-[(1H-PIRAZOL-4-ILMETIL)-SULFINIL]-OXAZOL QUIRAIS, SEU USO E SEU PROCESSO DE PRODUÇÃO, COMPOSIÇÕES E SEU USO

**(51) Int.Cl.:** C07D 413/12; C07D 413/14; A01N 43/76.

**(52) CPC:** C07D 413/12; C07D 413/14; A01N 43/76.

**(30) Prioridade Unionista:** 22/04/2008 EP 08007742.3.

**(73) Titular(es):** BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH.

**(72) Inventor(es):** HEINZ KEHNE; HANSJÖRG DIETRICH; DIETER FEUCHT; DIRK SCHMUTZLER; ISOLDE HAEUSER-HAHN; CHRISTIAN PAULITZ; JAN DITTGEN; ARIANNA MARTELLETTI; CHRISTOPHER HUGH ROSINGER.

**(86) Pedido PCT:** PCT EP2009002742 de 15/04/2009

**(87) Publicação PCT:** WO 2009/129954 de 29/10/2009

**(85) Data do Início da Fase Nacional:** 21/10/2010

**(57) Resumo:** DERIVADOS DE 2-[(1H-PIRAZOL-4-ILMETIL)-SULFONIL]-OXAZOL, DERIVADOS DE 2-[(1H-PIRAZOL-4-ILMETIL)-SULFANIL]-OXAZOL E DERIVADOS DE 2-[(1H-PIRAZOL-4-ILMETIL)-SULFINIL]-OXAZOL QUIRAIS, SEU USO E SEU PROCESSO DE PRODUÇÃO, COMPOSIÇÕES E SEU USO A presente invenção se refere a derivados de 2-[(1H-pirazol-4-ilmetil)-sulfonil]-oxazol, derivados de 2-[(1H-pirazol-4-ilmetil)-sulfonil]-oxazol quirais e derivados de 2-[(1H-pirazol-4-ilmetil)-sulfanil]-oxazol da Fórmula Geral (I) e seus sais, processos para a sua produção, bem como seu usos como herbicidas e reguladores do crescimento de plantas, especialmente como herbicidas para o combate seletivo de plantas daninhas em culturas de plantas úteis.

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "DERIVADOS DE 2-[(1H-PIRAZOL-4-ILMETIL)-SULFONIL]-OXAZOL, DERIVADOS DE 2-[(1H-PIRAZOL-4-ILMETIL)-SULFANIL]-OXAZOL E DERIVADOS DE 2-[(1H-PIRAZOL-4-ILMETIL)-SULFINIL]-OXAZOL QUIRAIS, SEU USO E SEU PROCESSO DE PRODUÇÃO, COMPOSIÇÕES E SEU USO".

#### Descrição

[001] A presente invenção se refere a derivados de 2-[(1H-pirazol-4-il-metil)-sulfonil]-oxazol, derivados de 2-[(1H-pirazol-4-il-metil)-sulfinil]-oxazol quirais e derivados de 2-[(1H-pirazol-4-il-metil)-sulfanil]-oxazol, bem como a processos para a sua produção. Outro objeto da presente invenção é seu uso como herbicida, especialmente como herbicida para o combate seletivo de plantas daninhas em culturas de plantas úteis e como regulador do crescimento de plantas individual ou em combinação com protetores e/ou em mistura com outros herbicidas.

[002] Já se sabe de vários relatórios, que certos derivados de oxazol possuem propriedades herbicidas ou que combatem parasitas.

[003] Dessa maneira, a WO 2004/013112 A descreve derivados de oxazol eficazes, que na posição 2 do anel oxazol portam um grupo de tioéter que, por seu lado, compreende uma unidade de fluoralqueno.

[004] A US 4.022.607 descreve derivados de 2-(alquilsulfinil)-oxazol, sua produção, bem como seu uso como herbicida.

[005] A DE 10 254 876 A descreve 2-(fluoralqueniltio)-oxazóis e seu uso como herbicidas.

[006] A EP 0.435.794 A descreve 1-heterociclilsulfonil-2-fenil-2-propeno e seu uso como herbicidas.

[007] Propriedades combatentes de parasitas de derivados de 2-trifluorbutenotio-oxazol são descritas, por exemplo, na WO

2001/066529 A, WO 99/52874 A e WO 95/24403 A.

[008] Sulfetos de 1-alkuil-5-nitro-imidazolil-2-alkuil-heteroarila, nos quais a heteroarila é um oxazol substituído, são descritos na DE 23 59 922 A.

[009] Além disso, também são descritos derivados de 2-[(1H-pirazol-4-ilmetil)-sulfinila] e derivados de 2-[(1H-pirazol-4-ilmetil)-sulfonila], que possuem propriedades herbicidas. Dessa maneira, na WO 2007/071900 A, WO 02/62770 A e WO 2006/123088 A são descritos alguns derivados de derivados de 2-[(1H-pirazol-4-ilmetil)-sulfinila] e derivados de 2-[(1H-pirazol-4-ilmetil)-sulfonila], que portam um grupo (1H-pirazol-4-ilmetila) substituído adequado como substituinte do grupo 2-sulfonila ou 2-sulfinila. Um processo para sua produção também é descrito nos relatórios mencionados acima.

[0010] Além disso, são descritos também derivados substituídos por 2-(arilmetil-sulfonila), que possuem propriedades herbicidas. Dessa maneira, na JP 2003/096059, WO 2001/112613 A e US 3.960.542 são descritos alguns derivados de 2-(arilmetil-sulfonila), que portam um grupo fenilmetila substituído adequado como substituinte no grupo 2-sulfonila. Um processo para sua preparação também é descrito nos relatórios mencionados acima.

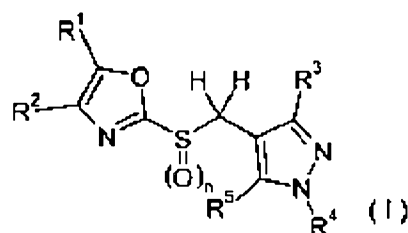
[0011] As substâncias ativas já conhecidas dos relatórios mencionados acima apresentam, contudo, desvantagens em sua aplicação, seja (a) que elas não possuem efeito herbicida ou, então, somente um efeito herbicida insuficiente contra plantas daninhas, (b) que elas possuem um espectro muito baixo das plantas daninhas, o qual pode ser combatido com uma substância ativa ou (c) que elas possuem uma baixa seletividade em culturas de plantas úteis.

[0012] Por isso, é desejável pôr substâncias ativas químicas alternativas à disposição, que podem ser eventualmente empregadas com vantagens como herbicidas ou reguladores do crescimento de

plantas.

[0013] De acordo com a invenção, foram encontrados, agora, derivados de 2-[(1-pirazol-4-il-metil)-sulfonil]-oxazol, derivados de 2-[(1-pirazol-4-il-metil)-sulfinil]-oxazol quirais e derivados de 2-[(1-pirazol-4-il-metil)-sulfanil]-oxazol, os quais apresentam vantagens comparados com os compostos descritos acima.

[0014] O objeto da presente invenção são compostos da Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção e seus sais agroquimicamente aceitáveis



[0015] na qual os radicais e índices apresentam o seguinte significado:

- n é igual a 0, 1 ou 2;
- os substituintes R<sup>1</sup> e R<sup>2</sup> são, em cada caso independentes uns dos outros, selecionados do grupo, consistindo em
  - hidrogênio, halogênio, nitro, ciano, formila, C(O)OH, hidróxi, amino,
  - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonilóxi,
  - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxycarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxycarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxycarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi,
  - (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquenilóxi, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquinila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquinilóxi,
  - (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonilóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-

alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi,

- mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil)amino, di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil)amino, N-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcanoil)amino, aminocarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil)aminocarbonila, di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil)aminocarbonila, mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil)aminossulfonila, di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil)aminossulfonila,

- (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalcóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilcarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalcoxycarbonila,

- (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquiltio, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilsulfinila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilsulfonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilsulfonilóxi,

- ciano-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, ciano-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila,

- -CONH-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, -NHCHO, -NHCO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, -NHCO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, -NHCONH-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, -NHSO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, -OCONH-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilaminossulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilaminossulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila,

- -C(O)NHR<sup>9</sup>, -C(O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>,

- em que R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup> independentes uns dos outros, são hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila,

ou

- em que R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup> juntos, formam um grupo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquileno, que pode conter um átomo de oxigênio ou enxofre ou um ou dois grupos amino ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilamino,

[0016] em que os radicais R<sup>1</sup> e R<sup>2</sup> mencionados acima podem ser substituídos uma ou mais vezes e independentes uns dos outros;

- os substituintes R<sup>3</sup> até R<sup>5</sup> são, em cada caso independentes uns dos outros, selecionados do grupo, consistindo em

- hidrogênio, halogênio, hidróxi, ciano, nitro, amino, C(O)OH, formila,

- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-

alquilcarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquilcarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonilóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquilcarbonilóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquilcarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquilcarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila,

- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxicarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcoxicarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxicarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcoxicarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxicarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalcoxicarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquila,

- (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquenilcarbonila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquenilcarbonila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquenilóxi, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquenilóxi, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alqueniloxicarbonila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalqueniloxicarbonila,

- (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquinila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquinila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquinilcarbonila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquinilcarbonila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquinilóxi, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquinilóxi, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiniloxicarbonila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquiniloxicarbonila,

- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltiocarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquiltiocarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltiocarbonilóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquiltiocarbonilóxi,

- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonilóxi,

- (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-arila, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-arilóxi, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-arilcarbonila, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-ariloxicarbonila,

- (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-aril-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-aril-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-ariloxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-aril-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonila, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-aril-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonilóxi, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-aril-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxicarbonila, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-aril-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxicarbonilóxi,

- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquilsulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquiltio, (C<sub>1</sub>-

C<sub>6</sub>)-halogenoalquilsulfinila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquilsulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquilsulfinil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfinil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquilsulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquilsulfinil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilsulfonilóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquilsulfonilóxi,

- (C<sub>4</sub>-C<sub>14</sub>)-arilsulfonila, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-ariltio, (C<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>)-arilsulfinila,

- mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil)amino, mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquil)-amino, di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil)-amino, di-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquil)-amino, ((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquil)-amino, N-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcanoil)-amino, N-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcanoil)-amino, aminocarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, mono-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilaminocarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilaminocarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil)-aminocarbonila,

- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxycarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi,

- (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalcóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilcarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalcoxycarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquilcarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxycarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcoxycarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquilcarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalcoxycarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquilcarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxycarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcoxycarbonilóxi,

- (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-

cicloalquenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalcóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenilcarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalqueniloxicarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquilcarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxicarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcoxicarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenilcarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalqueniloxicarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-halogenoalquilcarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxicarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcoxicarbonilóxi,

- (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalquiltio, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-alqueniltio, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cicloalqueniltio, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiniltio,
- hidróxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, hidróxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, ciano-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, ciano-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila,
- 3-oxetanilóxi,
- -C(O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>,
- em que R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup> independentes uns dos outros, representam hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila ou
- em que R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup> juntos, formam um grupo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquileno, que pode conter um átomo de oxigênio ou enxofre ou um ou dois grupos amino ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilamino,

[0017] em que os radicais R<sup>3</sup> até R<sup>5</sup> mencionados acima podem ser substituídos uma ou mais vezes e independentes uns dos outros e/ou

[0018] radicais R<sup>4</sup> e R<sup>5</sup> adjacentes uns aos outros podem estar ciclicamente ligados entre si e/ou formam um grupo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquileno, que pode conter um ou mais átomos de oxigênio e/ou enxofre, sendo que o grupo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquileno pode ser substituído uma ou mais vezes

por halogênio e os respectivos substituintes de halogênio podem ser iguais ou diferentes.

[0019] Caso os radicais, especialmente radicais, compreendendo um grupo arila, um grupo cicloalquila, um grupo alquila, um grupo alquênica, um grupo alquinila e um grupo cicloalquênica, compreendam um ou mais substituintes, tais como, por exemplo, cicloalquila ou arila, então os substituintes serão preferivelmente selecionados do grupo, consistindo em (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, nitro, ciano, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxicarbonila ou halogênio, sendo que os radicais mencionados podem estar eventualmente ciclicamente ligados entre si, com a condição, de que estejam na posição orto.

[0020] Em uma primeira forma de concretização da presente invenção, são compreendidos compostos da Fórmula Geral (I), nos quais

[0021] R<sup>1</sup> é preferivelmente selecionado do grupo, consistindo em H, halogênio, nitro, ciano, carboxila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilcarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxicarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalcoxicarbonila, mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquil)-aminocarbonila, di-((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquil)-aminocarbonila, mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquil)-aminossulfonila, di-((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquil)-aminossulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquiltio, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilsulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilsulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilsulfonilóxi, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-alquênica, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-alquinila, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-alquênilóxi, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-alquinilóxi, -NHCO-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, -NHCO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, -NHCONH-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, -NHCO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, -OCONH-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, -CONHR<sup>9</sup>, -CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, em que R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup> independentes uns dos outros, é hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila,

[0022] em que o radical  $R^1$  mencionado acima pode ser substituído uma ou mais vezes e independente um do outro, por radicais, os quais são selecionados do grupo, consistindo em halogênio e (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila;

[0023]  $R^1$  é selecionado, de modo muito particularmente preferido, do grupo, consistindo em H, F, Cl, Br, I, Me, Et, NO<sub>2</sub>, CHF<sub>2</sub> e CF<sub>3</sub>, e

[0024]  $R^1$  é selecionado, de modo muito particularmente preferido, do grupo, consistindo em H, F, Cl, Br, I e Me.

[0025] Em uma segunda forma de concretização da presente invenção, são compreendidos compostos da Fórmula Geral (I), nos quais

[0026]  $R^2$  é selecionado do grupo consistindo em H, halogênio, nitro, ciano, carboxila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquil, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilcarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilcarbonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxycarbonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalcoxycarbonila, mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquil)aminocarbonila, di-((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquil)aminocarbonila, mono-((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquil)aminossulfonila, di-((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquil)aminossulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquiltio, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilsulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilsulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquilsulfonilóxi, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-alquinila, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-alquenilóxi, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-alquinilóxi, -NHCO-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, -NHCO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, -NHCONH-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, -NHSO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, -OCONH-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, -CONHR<sup>9</sup>, -CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, em que R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup> independentes um do outro, são hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila,

[0027] em que os radicais  $R^2$  mencionados acima podem ser substituídos uma ou mais vezes e independentes uns dos outros, por radicais, os quais são selecionados do grupo, consistindo em halogê-

nio e (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila;

[0028] R<sup>2</sup> é selecionado de modo particularmente preferido do grupo consistindo em H, F, Cl, Br, I, Me, Et, NO<sub>2</sub>, CHF<sub>2</sub> e CF<sub>3</sub>; e

[0029] R<sup>2</sup> é selecionado de modo muito particularmente preferido do grupo consistindo em H, F, Cl e Br.

[0030] Uma terceira forma de concretização da presente invenção, compreende compostos da Fórmula Geral (I), nos quais

[0031] R<sup>3</sup> é preferivelmente selecionado do grupo, consistindo em hidrogênio, halogênio, hidróxi, ciano, nitro, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfinila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfinil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-alquinila, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-alquenilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-alquinilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, hidroxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, hidroxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, ciano-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, ciano-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila; fenila, que é eventualmente substituída por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio, nitro, ciano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio; fenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, que é eventualmente substituída por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio, nitro, ciano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio; fenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, que é eventualmente substituída por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio, nitro, ciano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilcarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilcarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi-carbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, aminocarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila e 3-oxetanilóxi, -C(O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, em que R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup>, independentes um do

outro, são selecionados do grupo, consistindo em hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila ou em que R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup> juntos formam um grupo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilenos, que pode conter um átomo de oxigênio ou enxofre ou um ou dois grupos amino ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilamino; e

[0032] R<sup>3</sup> é selecionado de modo particularmente preferido do grupo, consistindo em H, F, Cl, Br, I, CN, Me, Et, Pr, iPr, tBu, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OMe, OEt, OCHF<sub>2</sub> e OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>; e

[0033] R<sup>3</sup> é selecionado de modo muito particularmente preferido do grupo, consistindo em F, Cl, Br, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Me, OMe, Pr, iPr e Et.

[0034] Uma quarta forma de concretização da presente invenção, compreende compostos da Fórmula Geral (I), nos quais

[0035] R<sup>4</sup> é preferivelmente selecionado do grupo, consistindo em hidrogênio; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila; fenila, que é eventualmente substituída por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio, nitro, ciano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio; fenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, que é eventualmente substituída por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio, nitro, ciano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio; (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila; (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, sendo que o radical cicloalquila é eventualmente substituído com (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila; (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-alquinila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfinil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, ciano-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxicarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, aminocarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, mono-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilaminocarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilamino-carbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, hidroxil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilcarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-

alcoxicarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonil; fenilsulfonila, que é eventualmente substituída por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio, nitro, ciano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilcarbonila; fenilcarbonila, que é eventualmente substituída por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio, nitro, ciano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio; e (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxicarbonila;

[0036] R<sup>4</sup> é selecionado de modo particularmente preferido do grupo, consistindo em H, Me, Et, Pr, cPr, iPr, Bu, iBu, sBu, tBu, cPen, cHex, CHF<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Ph, Ph(4-Cl), CH<sub>2</sub>cPr, CH<sub>2</sub>cPr(2-Me), CHMecPr, CH<sub>2</sub>cBu, CH<sub>2</sub>cPen, CH<sub>2</sub>cHex, CH<sub>2</sub>Ph, CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>C≡CH, CHMeC≡CH, CH<sub>2</sub>C≡CMe, CH<sub>2</sub>OMe, CH<sub>2</sub>OEt, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)Me, CH<sub>2</sub>SMe, CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Me, CH<sub>2</sub>CN, CH<sub>2</sub>C(O)OMe, CH<sub>2</sub>C(O)OEt, CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>C(O)NMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>C(O)Me, SO<sub>2</sub>Me, SO<sub>2</sub>Ph, C(O)Me, C(O)Ph e C(O)OMe; e

[0037] R<sup>4</sup> é selecionado de modo muito particularmente preferido do grupo consistindo em Me, Et e CHF<sub>2</sub>.

[0038] Uma quinta forma de concretização da presente invenção compreende compostos da Fórmula Geral (I), nos quais

[0039] R<sup>5</sup> é preferivelmente selecionado do grupo consistindo em hidrogênio, halogênio, hidróxi, ciano, nitro, amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquiltio-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfinila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfinil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilsulfonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquenila, ciano-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-alquinila, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-alquenilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-alquinilóxi, (C<sub>3</sub>-

C<sub>6</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, hidroxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, hidroxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, ciano-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, ciano-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila; fenila, que é eventualmente substituída por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio, nitro, ciano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio; fenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, que é eventualmente substituída por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio, nitro, ciano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio; fenil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, fenóxi, que é eventualmente substituído por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio, nitro, ciano, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilcarbonilóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilcarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxycarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, aminocarbonil-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila e 3-oxetanilóxi -C(O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, em que R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup>, independentes um do outro, são selecionados do grupo consistindo em hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila ou em que R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup> juntos formam um grupo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilenos, que pode conter um átomo de oxigênio ou enxofre ou um ou dois grupos amino ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilamino; e

[0040] R<sup>5</sup> é selecionado de modo particularmente preferido do grupo, consistindo em H, F, Cl, Br, I, CN, Me, Et, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OMe, OEt, OPr, OiPr, OtBu, SO<sub>2</sub>Me, SO<sub>2</sub>iPr, 3-oxetanyloxy, OPh, OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>C≡CH, OCH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, SEt, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, SMe, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, OCH(CH<sub>2</sub>F)<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CF=CH<sub>2</sub>, OCH(CH<sub>3</sub>)CF<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>CN, OCH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>F, OCH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub> e OCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; e

[0041] R<sup>5</sup> é selecionado de modo muito particularmente preferido do grupo consistindo em H, F, Cl, CHF<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub> e OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>.

[0042] No contexto da presente invenção, é possível combinar os significados individuais preferidos, particularmente preferidos e muito

particularmente preferidos dos substituintes  $R^1$  até  $R^5$ , tal como definido nas cinco formas de concretização acima uns com os outros como desejado. Isto é, que compostos da Fórmula Geral (I) são compreendidos pela presente invenção, nos quais, por exemplo, o substituinte  $R^3$  apresenta um significado preferido e os substituintes  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$  e  $R^5$  apresentam o significado geral ou, então, o substituinte  $R^4$  apresenta um significado preferido, o substituinte  $R^5$  apresenta um significado particularmente preferido e os substituintes  $R^1$  até  $R^3$  apresentam um significado muito particularmente preferido.

[0043] No contexto da presente invenção, o composto da Fórmula Geral (I) também compreende compostos, que são quaternizados através de a) protonização, b) alquilação ou c) oxidação em um átomo de nitrogênio. Os compostos da Fórmula Geral (I) podem formar sais eventualmente através da adição de um ácido inorgânico ou orgânico adequado, tal como, por exemplo, HCl, HBr,  $H_2SO_4$  ou  $HNO_3$ , mas também ácido oxálico ou ácidos sulfônicos a um grupo básico, tal como, por exemplo, amino ou alquilamino. Substituintes adequados, que estão presentes em forma desprotonizada, tais como, por exemplo, ácidos sulfônicos ou ácidos carboxílicos, podem formar sais internos com grupos, por seu lado, protonizáveis, tais como grupos amino. Os sais podem ser igualmente formados pelo fato de que no caso de substituintes adequados, tais como, por exemplo, ácidos sulfônicos ou ácidos carboxílicos, o hidrogênio é substituído por um cátion adequado no setor agroquímico. Esses sais são, por exemplo, sais de metais, especialmente sais de metais alcalinos ou sais de metais alcalinoterrosos, especialmente sais de sódio e potássio ou também sais de amônio, sais com aminas orgânicas ou sais de amônio quartérios (quaternários) com cátions da Fórmula  $[NRR'R''R''']^+$ , na qual R até  $R'''$  em cada caso independentes uns dos outros, representam um radical orgânico, especialmente alquila, arila, arilalquila ou alquilarila.

[0044] Na Fórmula Geral (I) e em todas as outras fórmulas da presente invenção, os radicais alquila, alcóxi, haloalquila, haloalcóxi, alquilamino, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfinila, alquilsulfonila, haloalquilsulfinila e haloalquilsulfonila, bem como os radicais insaturados e/ou substituídos correspondentes podem ser em cada caso em cadeia linear ou ramificada na estrutura do carbono. A não ser que seja especialmente indicado, nesses radicais são preferidas as estruturas inferiores do carbono, por exemplo, com 1 a 6 átomos de carbono, especialmente 1 a 4 átomos de carbono ou no caso dos grupos insaturados com 2 a 6 átomos de carbono, especialmente 2 a 4 átomos de carbono. Radicais alquila, também nos significados compostos, tais como alcóxi, haloalquila e assim por diante representam, por exemplo, metila, etila, n- ou i-propila, n-, i-, t- ou 2-butila, pentilas, hexilas, tais como n-hexila, i-hexila e 1,3-dimetilbutila, heptilas, tais como n-heptila, 1-metil-hexila e 1,4-dimetilpentila; radicais alquenila e alquinila apresentam o significado dos possíveis radicais insaturados correspondentes aos radicais alquila; sendo que, pelo menos, está contida uma ligação dupla ou ligação tripla, preferivelmente uma ligação dupla ou ligação tripla. Alquenila representa, por exemplo, vinila, alila; 1-metilprop-2-en-1-ila, 2-metil-prop-2-en-1-ila, but-2-en-1-ila, but-3-en-1-ila, 1-metil-but-3-en-1-ila e 1-metil-but-2-en-1-ila; alquinila representa, por exemplo, etinila, propargila, but-2-in-1-ila, but-3-in-1-ila e 1-metil-but-3-in-1-ila.

[0045] Halogênio representa flúor, cloro, bromo ou iodo; haloalquila, -alquenila e -alquinila representam alquila, alquenila ou alquinila parcial ou completamente substituída por halogênio, preferivelmente por flúor, cloro ou bromo, especialmente por flúor e/ou cloro, por exemplo, mono-haloalquila (= mono-halogenoalquila), perhaloalquila, CF<sub>3</sub>, CHF<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>F, CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>FCHCl, CCl<sub>3</sub>, CHCl<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl; haloalcóxi é, por exemplo, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>F, CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, e

OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl; o correspondente se aplica à haloalquenila e a outros radicais substituídos por halogênio.

[0046] Arila eventualmente substituída é preferivelmente fenila, que não é substituída ou é substituída uma ou mais vezes, preferivelmente até três vezes por radicais iguais ou diferentes selecionados do grupo, consistindo em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-halogenoalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-halogenoalcóxi, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-cicloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquiltio, ciano e nitro, por exemplo, o-, m- e p-tolila, dimetilfenilas, 2-, 3- e 4-clorofenila, 2-, 3- e 4-trifluormetila e 2-, 3- e 4-triclorometilfenila, 2,4-, 3,5-, 2,5- e 2,3-diclorofenila, o-, m- e p-metoxifenila.

[0047] Com a definição "é substituído(a) com um ou mais radicais", quando não definido de outro modo, entende-se um ou mais radicais iguais ou diferentes.

[0048] Os substituintes exemplares mencionados ("primeiro nível de substituintes") podem, desde que contenham frações de hidrocarbonetos, podem ser eventualmente ulteriormente substituídos ali ("segundo nível de substituintes"), por exemplo, por um dos substituintes, tal como este é definido para o primeiro nível de substituintes. Outros níveis de substituintes correspondentes são possíveis. Preferivelmente o termo "radical substituído" compreende somente um ou dois níveis de substituintes.

[0049] No caso de radicais com átomos de carbono preferem-se aqueles com 1 a 6 átomos de carbono, preferivelmente 1 a 4 átomos de carbono, especialmente 1 ou 2 átomos de carbono. Via de regra, preferem-se substituintes do grupo halogênio, por exemplo, flúor e cloro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, preferivelmente metila ou etila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila, preferivelmente trifluormetila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi, preferivelmente metóxi ou etóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalcóxi, nitro e ciano.

[0050] O objeto da invenção são também todos os estereoisôme-

ros, que são compreendidos pela Fórmula (I) e suas misturas. Tais compostos da Fórmula (I) contêm um ou mais átomos de carbono assimétricos (= átomos de carbono assimetricamente substituídos) e/ou átomos de enxofre assimétricos em forma de sulfóxidos ( $n = 1$ ), que podem existir em duas formas enantioméricas ou também ligações duplas, que não são especificamente indicadas nas fórmulas gerais (I). Os possíveis estereoisômeros definidos por sua forma espacial específica, tais como enantiômeros, diastereômeros, isômeros Z e E são todos compreendidos pela Fórmula (I) e podem ser obtidos por métodos convencionais a partir de misturas dos estereoisômeros ou também podem ser preparados por reações estereosseletivas em combinação com o emprego de substâncias de partida estereoquimicamente puras.

[0051] As definições de radicais gerais mencionadas acima ou mencionadas em âmbitos preferidos valem tanto para os produtos finais da Fórmula (I), como também de forma correspondente para os produtos de partida e intermediários em cada caso necessários para a preparação. Essas definições de radicais podem ser combinadas entre si, como também entre os âmbitos preferidos indicados como desejado.

[0052] As possibilidades de combinação dos vários substituintes da Fórmula Geral (I) devem ser entendidas de maneira tal, que os princípios gerais da construção de compostos químicos sejam observados, isto é, a Fórmula (I) não compreenda compostos, dos quais o técnico sabe, que eles são quimicamente impossíveis.

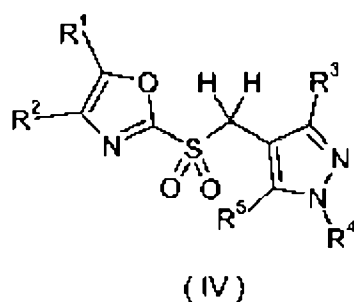
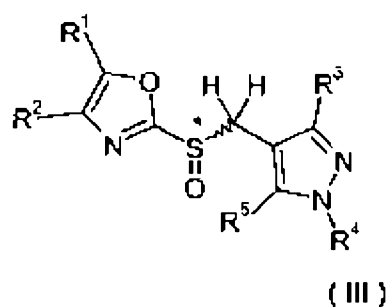
[0053] O objeto da presente invenção são também processos para a preparação dos compostos da Fórmula Geral (I) e/ou seus sais.

[0054] Os compostos da Fórmula (I), de acordo com a invenção, podem ser alternativamente preparados por vários processos.

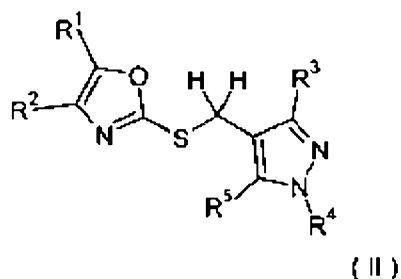
[0055] Nos processos seguintes, utilizam-se parcialmente solven-

tes. Nesse contexto, "solventes inertes" designam, em cada caso, solventes, que são inertes nas respectivas condições de reação, contudo, não precisam ser inertes nas condições de reação desejadas.

a.) Para preparar sulfóxidos opticamente ativos da Fórmula (III) ( $n = 1$ ) ou sulfonas da Fórmula (IV) ( $n = 2$ ), nas quais  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados mencionados acima de acordo com a Fórmula (I),



[0056] por exemplo, um tioéter da Fórmula Geral (II),



[0057] na qual  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados mencionados acima de acordo com a Fórmula (I), é oxidado com um equivalente de um agente de oxidação para os sulfóxidos opticamente ativos (III) ( $n = 1$ ) ou com dois equivalentes de um agente de oxidação para as sulfonas (IV) ( $n = 2$ ).

[0058] As sulfonas da Fórmula Geral (IV) também podem ser ob-

tidas dos sulfóxidos opticamente ativos da Fórmula Geral (III), em que os sulfóxidos da Fórmula Geral (III) são oxidados com um equivalente de um agente de oxidação para as sulfonas da Fórmula Geral (IV).

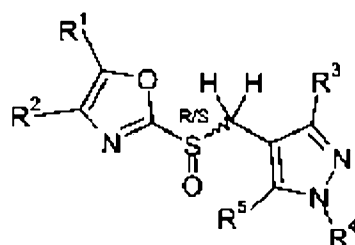
[0059] Os agentes de oxidação, os quais podem ser usados para essa reação, não estão sujeitos a quaisquer determinações particulares e em geral, podem ser usados todos os agentes de oxidação, os quais são capazes de oxidar compostos de enxofre correspondentes para compostos de sulfóxido ou compostos de sulfona.

[0060] Como agentes de oxidação para preparar os sulfóxidos opticamente ativos ( $n = 1$ ) são adequados peróxidos inorgânicos, tais como, por exemplo, peróxido de hidrogênio, metaperiodato de sódio, eventualmente na presença de um catalisador, tal como, por exemplo, cloreto de rutênio (III), peróxidos orgânicos, tal como, por exemplo, hidroperóxido de terc.-butila ou perácidos orgânicos, tal como ácido peracético ou preferivelmente ácido 3-cloro-perbenzoico. A reação pode ser efetuada em hidrocarbonetos halogenados, por exemplo, diclorometano, 1,2-dicloreto, um álcool, tal como, por exemplo, metanol ou em dimetilformamida, acetonitrila, água ou ácido acético ou em uma mistura dos solventes mencionados acima. A reação é efetuada em uma faixa de temperatura entre  $-80$  e  $120^{\circ}\text{C}$ , preferivelmente entre  $-20$  até  $50^{\circ}\text{C}$ . Tais processos são conhecidos na literatura e descritos, por exemplo, em J. Org. Chem., 58 (1993) 2791, J. Org. Chem., 68 (2003) 3849 e J. Heterocyclic Chem., 15 (1978) 1361.

[0061] Como agentes de oxidação para a preparação das sulfonas ( $n = 2$ ) são adequados, por exemplo, peróxido de hidrogênio, peróxidos orgânicos, tal como, por exemplo, hidroperóxido de terc.-butila ou perácidos orgânicos, tal como ácido peracético ou preferivelmente ácido 3-cloro-perbenzoico.

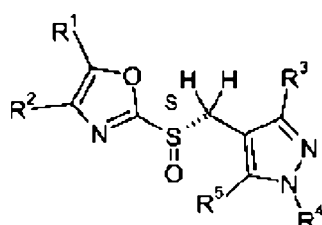
[0062] A síntese enantiosseletiva de sulfóxidos quirais da Fórmula (III) em forma opticamente enriquecida ou pura pode, partindo de

compostos tio da Fórmula (II), ser efetuada por métodos, tais como são descritos, por exemplo, em Chem. Rev.. 103 (2003) 3651-3705 ou na literatura ali citada e Adv. Synth. Catal., 347 (2005) 19-31 ou na literatura ali citada. Em cada caso individual, a configuração absoluta do produto depende da estrutura do catalisador opticamente ativo.

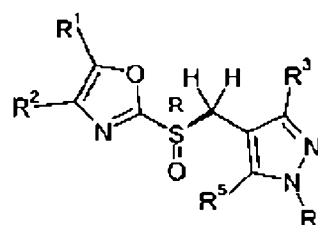


( III )

[0063] Compostos da Fórmula Geral (III) consistem em uma mistura dos respectivos enantiômeros quirais na função sulfóxido (III-S) e (III-R)



( III-S )



( III-R )

[0064] nas quais os radicais  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam o significado mencionado acima.

[0065] Para a preparação de enantiômeros da Fórmula Geral (III) incluem-se, além das sínteses enantiosseletivas, também métodos para a separação de racematos convencionais (compare manuais de estereoquímica).

[0066] Misturas racêmicas, por exemplo, de sulfóxidos opticamente ativos da Fórmula Geral (III), podem ser separadas por processos conhecidos. Tais métodos para a separação de racematos são descritos em manuais da estereoquímica, por exemplo, em "Basic Organic Stereochemistry" (Eds.: Eliel, Ernest L.; Wilen, Samuel H.; Doyle, Michael P.; 2001; John Wiley & Sons) e "Stereochemistry of Organic

Compounds" (Eds.: Eliel, Ernest L.; Wilen, Samuel H.; Mander, Lewis N.; 1994; John Wiley & Sons). Nesse caso, incluem-se, por exemplo, a formação do produto de adição com um reagente auxiliar opticamente ativo, separação dos produtos de adição diastereoméricos nos diastereômeros correspondentes, por exemplo, por cristalização, processos de cromatografia, principalmente cromatografia de coluna e cromatografia líquida de alta pressão, destilação, eventualmente sob baixa pressão, extração e outros processos e subsequente retroreação dos diastereômeros para os enantiômeros. Para quantidades preparatórias ou em escala industrial, são incluídos processos, tais como a cristalização de sais diastereoméricos, que podem ser obtidos a partir dos compostos (III) com ácidos opticamente ativos e eventualmente com grupos ácidos presentes com bases opticamente ativas.

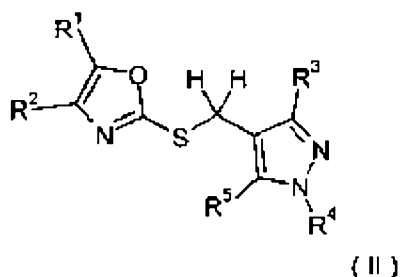
[0067] Ácidos opticamente ativos para a separação do racemato através da cristalização de sais diastereoméricos incluem-se, por exemplo, ácido canferossulfônico, ácido canférico, ácido bromocanférico, ácido da China, ácido tartárico, ácido dibenzoiltartárico e outros ácidos análogos; como bases opticamente ativas incluem-se, por exemplo, quinina, cinchonina, quinidina, brucina, 1-feniletilamina e outras bases análogas.

[0068] As cristalizações são efetuadas, então, na maioria dos casos em solventes aquosos ou aquoso-orgânicos, em que o diastereômero precipita inicialmente com a menor solubilidade eventualmente após inoculação. Um enantiômero do composto da Fórmula (III) é liberado, depois, do sal precipitado ou o outro é liberado do cristalizado mediante acidificação ou com base.

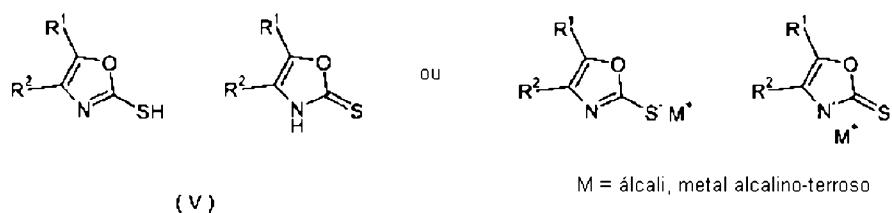
[0069] Além disso, os racematos podem ser separados cromatograficamente com fases estacionárias quirais. Tais separações de enantiômeros podem ser efetuadas na faixa de mg até 100 kg com instalações de HPLC preparatórias em operação individual ou contínua.

[0070] A preparação dos tioéteres da Fórmula Geral (II), os quais servem como produto de partida para a preparação dos sulfóxidos da Fórmula Geral (III) ou das sulfonas da Fórmula Geral (IV), é descrita abaixo sob os processos b.), c.), d.), e.), f.), g.) e h.).

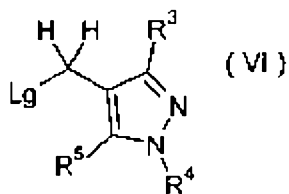
b.) Para preparar um tioéter da Fórmula Geral (II),



[0071] na qual  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula (I), por exemplo, 2-mercapto-oxazol ou uma oxazol-2(3H)-tiona ou um sal deste, preferivelmente um sal de metal alcalino ou sal de metal alcalinoterroso da Fórmula Geral (V)



[0072] na qual  $R^1$ ,  $R^2$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula Geral (I), é reagido com um derivado de (1H-pirazol-4-ilmetila) da Fórmula Geral (VI)



[0073] na qual  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula Geral (I) e Lg representa um grupo de partida, na presença de uma base de metal alcalino ou de metal alcalinoterroso adequada, por exemplo, carbonato de potássio ou hidreto de

sódio ou de uma base orgânica, tal como, por exemplo, 1,8-diazabicyclo(5.4.0)undec-7-eno (DBU), em um solvente adequado, por exemplo, dimetilformamida, tetraidrofurano, etanol ou preferivelmente acetonitrila, em uma faixa de temperatura entre 0 e 100°C e eventualmente sob uma atmosfera de gás inerte, por exemplo, nitrogênio.

[0074] Reações análogas para a reação de 2-mercapto-oxazóis ou oxazol-2(3H)-tionas ou seus sais são descritas na literatura, por exemplo, na DE 26 25 229 A, WO 99/52874 A, WO 01/66529 A, WO 95/24403 A, Bradsher, C. K.; Jones, W. J. Jr; J. Org. Chem. 32, 2079 (1967).

[0075] Ao invés dos compostos mercapto mencionados ou do sal deste, também podem ser usados formadores de mercaptano, tais como, por exemplo, sais de isotiurônio.

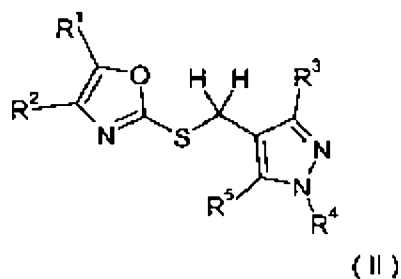
[0076] Como grupos de partida Lg são preferidos cloro, bromo, iodo ou grupos de sulfonato, tais como metano-, trifluormetano-, etano-, benzeno- ou toluenossulfonato.

[0077] Os derivados de 2-mercapto-oxazol empregados no processo b.) ou oxazol-2(3H)-tionas ou sais correspondentes dos derivados de 2-mercapto-oxazol ou oxazol-2(3H)-tionas da Fórmula Geral (V), são conhecidos pelo técnico e parcialmente são comercialmente disponíveis ou preparáveis por processos conhecidos pelo técnico, por exemplo, tal como descrito em a) Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, Volume 11, Ed. E. Schaumann; b) Houben-Weyl (Methoden der organischen Chemie), volume E8a, Heterene III-parte 1, Ed. E. Schaumann; c) Can. J. Chem., vol. 50, 3082-3084 (1972); d) WO 2003/006442 A.

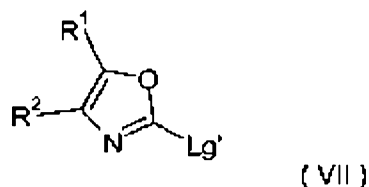
[0078] Os derivados de (1H-pirazol-4-il-metila) da Fórmula Geral (VI) empregados no processo b.) são conhecidos pelo técnico ou são comercialmente disponíveis ou preparáveis por processos conhecidos pelo técnico (vide por exemplo: a) Communications de la Faculte des

Sciences de l'Universite d'Ankara, Series B: Chemistry and Chemical Engineering (1996), 41(1-2), 87-94; b) WO 2004/013106 A; c) WO 2006/024820 A).

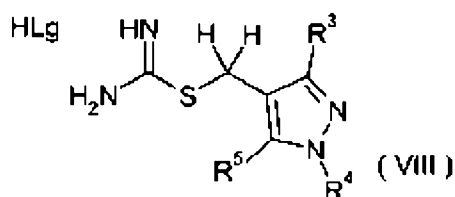
c.) Alternativamente, a preparação de um tioéter da Fórmula Geral (II)



[0079] na qual  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula Geral (I), pode ser efetuada através da reação de um derivado de oxazol da Fórmula Geral (VII)

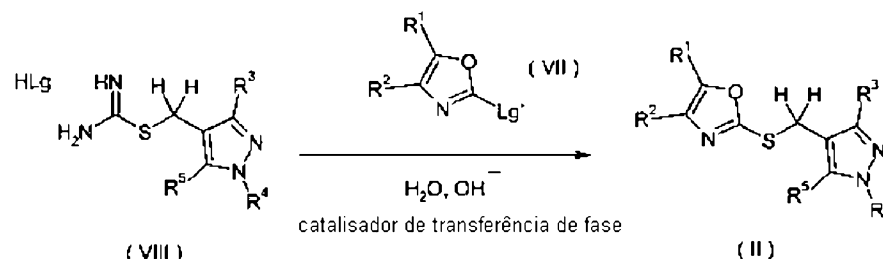


[0080] na qual  $R^1$ ,  $R^2$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula Geral (I) e  $Lg'$  representa um grupo de partida, sendo que como grupos de partida podem agir, entre outros, o flúor, cloro, bromo, iodo, grupos de sulfeto, sulfóxidos ou sulfonato, com um sal de [(1H-pirazol-4-il-metil)]-imidotiocarbamato da Fórmula Geral (VIII)



[0081] na qual  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula Geral (I),  $Lg$  representa um grupo de partida, em um processo de etapa única na presença de uma base de metal alcalino ou metal alcalinoterroso aquosa.

[0082] De modo geral, a reação é representada pelo esquema de Fórmula abaixo:



[0083] Os derivados de oxazol da Fórmula Geral (VII) empregados no processo c.) são conhecidos pelo técnico ou comercialmente disponíveis ou preparáveis por processos conhecidos pelo técnico (por exemplo, tal como descrito em Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, volume 11, Ed. E. Schaumann; DE 26 25 229 A).

[0084] O uso de sais de imidotiocarbamato (sais de isotiurônio) no sentido de uma reação de etapa única para a saponificação do sal de imidotiocarbamato (sal de isotiurônio) e reação do mercaptano intermediariamente formado em uma reação de permuta, é descrito em um outro esquema de reação, por exemplo, na DE 39 42 946, WO 2006/024820 e WO 2006/037945 A e com o uso de catálise de transferência de fases, descrito na WO 2007/003294 A e WO 2007/003295 A.

[0085] Compostos da Fórmula Geral (VIII) podem ser obtidos através de reação de um agente de alquilação da Fórmula Geral (VI), na qual R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula Geral (I) e Lg é um grupo de partida, com tioureia.

[0086] A preparação dos sais de imidotiocarbamato (VIII) através da reação de um agente de metilação (1H-pirazol-4-ila) da Fórmula Geral (VI) com tioureia é efetuada por processos conhecidos (tal como, por exemplo, pelo processo descrito na DE 152557), vantajosamente através da reação com uma quantidade equimolar de tioureia e

eventualmente na presença de iodeto de metal alcalino, por exemplo, iodeto de sódio ou iodeto de potássio, em um solvente inerte, tal como alcoóis inferiores, tais como, por exemplo, metanol, etanol ou isopropanol; hidrocarbonetos, tais como, por exemplo, benzeno ou tolueno; hidrocarbonetos halogenados, tais como, por exemplo, diclorometano ou clorofórmio; ou derivados de éteres, tais como, por exemplo, éter metil-terc-butílico, tetraidrofurano ou dioxano a temperaturas entre 0 a 150°C, preferivelmente entre 20 a 100°C.

[0087] No processo de acordo com a invenção, os compostos dos sais de imidotiocarbamato da Fórmula Geral (VIII) obtidos em muitos casos por cristalização, são geralmente reagidos sem outros estágios de purificação sob forte agitação com quantidades equimolares dos derivados de oxazol da Fórmula Geral (VII) em condições de transferência de fase.

[0088] De maneira vantajosa, trabalha-se aqui em um sistema bifásico, em que, além de uma solução aquosa fortemente básica de hidróxido de metal alcalino ou de metal alcalinoterroso, preferivelmente hidróxido de sódio ou potássio, com pelo menos dois equivalentes da base, a fase orgânica é um solvente inerte, tal como tetraidrofurano, éter dietílico, acetonitrila, pentano, hexano, benzeno, tolueno, xileno, clorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, nitrobenzeno ou misturas desses solventes.

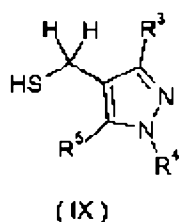
[0089] Também é possível, empregar o produto de partida respectivamente mais valioso da Fórmula (VIII) ou da Fórmula (VII) em uma quantidade ligeiramente escassa.

[0090] Como catalisadores de transferência de fase são adequados sais de amônio quaternários ou de fosfônio, bem como éteres de coroa, criptandos ou polietilenoglicóis. Exemplos de tais catalisadores são encontrados, por exemplo, em W. P. Weber, G. W. Gokel; Phase Transfer Catalysis in Organic Synthesis, Springer-Verlag, Berlim 1977

ou E. V. Dehmlow, S. S. Dehmlow, Phase Transfer Catalysis, Segunda Ed. Verlag Chemie, Weinheim 1983.

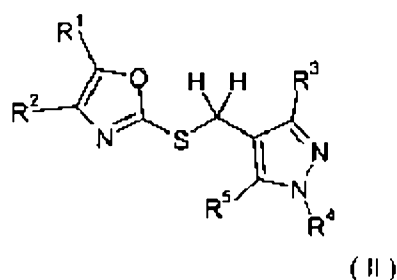
[0091] Preferivelmente, os participantes da reação e o catalisador são fortemente agitados a temperaturas de 20 a 100°C sob atmosfera de gás protetor.

[0092] O mercaptano da Fórmula Geral (IX) formado intermediariamente nas condições de reação, na qual  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam o significado indicado acima de acordo com a Fórmula Geral (I),

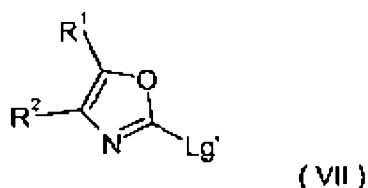


[0093] é imediatamente capturado *in situ* pelo derivado de oxazol da Fórmula Geral (VII).

d.) Alternativamente, a preparação de tioéteres da Fórmula (II), na qual  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula (I),

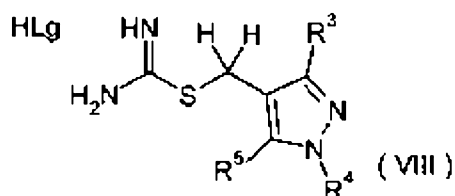


[0094] pode ser efetuada através da reação de um derivado de oxazol da Fórmula Geral (VII)



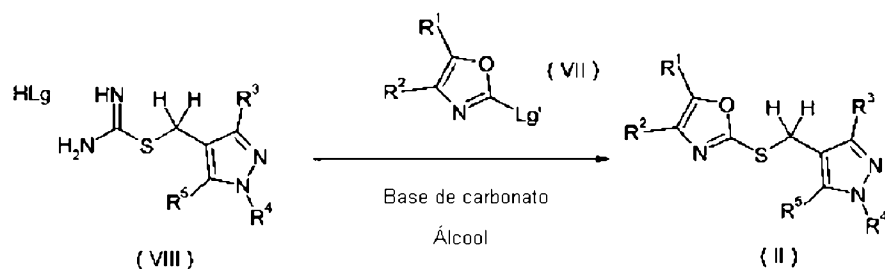
[0095] na qual  $R^1$ ,  $R^2$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula (I) e  $Lg'$  representa um grupo de partida,

sendo que como grupos de partida são adequados, entre outros, cloro, bromo ou grupos de metilsulfonila, com um sal imidotiocarbamato de de (1H-pirazol-4-ilmetila)- (sal de isotiurônio) da Fórmula Geral (VIII)



[0096] na qual R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula (I), Lg representa um grupo de partida, em um processo de etapa única na presença de uma base de metal alcalino ou de metal alcalinoterroso e de um solvente, como um álcool.

[0097] De modo geral, a reação é representada pelo seguinte esquema de fórmula:



[0098] Compostos da Fórmula Geral (VIII) podem ser obtidos através da reação de um agente de alquilação da Fórmula Geral (VI), na qual R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula (I) e Lg é um grupo de partida, com tioureia, tal como descrito de acordo com o processo .c) acima.

[0099] Os sais de imidotiocarbamato (sais de isotiurônio) da Fórmula Geral (VIII) no processo de acordo com a invenção, são geralmente reagidos sem outros estágios de purificação sob forte agitação com leve excesso dos derivados de oxazol da Fórmula Geral (VII) e com leve excesso de uma base de carbonato, por exemplo, carbonato de potássio, carbonato de sódio ou bicarbonato de potássio ou de um

hidróxido, por exemplo, hidróxido de potássio ou de um alcóxido, por exemplo, alcóxido de sódio em álcool, por exemplo, etanol, éter, por exemplo, 1,4-dioxano, tetraidrofurano, um solvente polar, tal como, por exemplo, água, dimetilformamida ou de uma mistura desses solventes em uma faixa de temperatura entre 20 até 200°C, preferivelmente entre 50 e 150°C, opcionalmente sob uma atmosfera de gás inerte, por exemplo, nitrogênio ou com um aparelho de micro-onda.

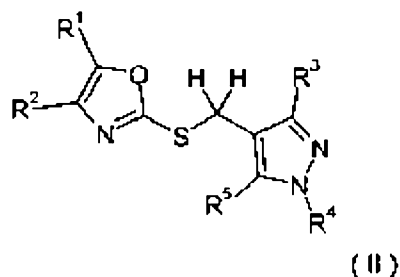
[00100] Os sais de imidotiocarbamato (sais de isotiurônio) da Fórmula Geral (VIII) podem ser ulteriormente reagidos também *in situ*, sem isolamento.

[00101] De maneira vantajosa, trabalha-se aqui em um álcool, preferivelmente etanol, com pelo menos 1,1 equivalente da base, preferivelmente carbonato de potássio (K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>).

[00102] Tais processos são conhecidos na literatura e são descritos, por exemplo, na WO 2006/024820 A, WO 2001/012613 A e WO 2006/123088 A.

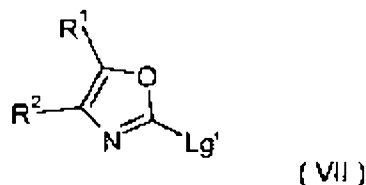
[00103] Os derivados de oxazol da Fórmula Geral (VII) empregados no processo d.) são conhecidos pelo técnico ou são comercialmente disponíveis ou preparáveis pelos processos conhecidos pelo técnico [vide, por exemplo, Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, volume 11, Ed. E. Schaumann].

e.) Alternativamente, a preparação de um tioéter da Fórmula Geral (II)



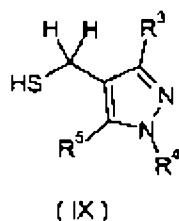
[00104] na qual R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> apresentam os significados indi-

cados acima de acordo com a Fórmula Geral (I), pode ser efetuada através da reação de um derivado de oxazol da Fórmula Geral (VII)



[00105] na qual R¹, R² apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula Geral (I) e Lg' representa um grupo de partida, sendo que como grupos de partida são adequados LG' e outros, flúor, cloro, bromo ou grupos sulfonato,

[00106] com um (1H-pirazol-4-ilmetil)-mercaptano da Fórmula Geral (IX)



[00107] na qual R³, R⁴, R⁵ apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula Geral (I), na presença de uma base de metal alcalino ou de metal alcalinoterroso, por exemplo, carbonato de potássio ou hidreto de sódio ou de bases orgânicas, por exemplo, preferivelmente 1,8-diazabicyclo(5.4.0)undec-7-eno (DBU), opcionalmente em um solvente, por exemplo, dimetilformamida, tetraidrofurano, etanol ou preferivelmente acetonitrila, em uma faixa de temperatura entre 0 e 100°C e opcionalmente sob uma atmosfera de gás inerte, por exemplo, nitrogênio.

[00108] Alguns dos processos são conhecidos na literatura e descritos, por exemplo, na WO 2006/024820 A, WO 2001/012613 A e WO 2006/123088 A.

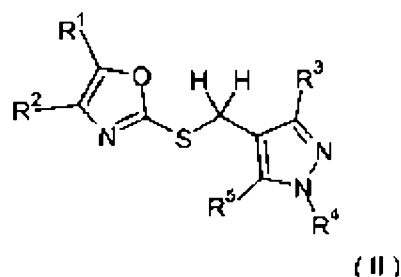
[00109] Substituições nucleofílicas em derivados de oxazol são descritas na literatura, por exemplo, em Yamanaka, H.; Ohba, S.; Sa-

kamoto, T.; Heterocycles (1990), 31(6), 1115-27.

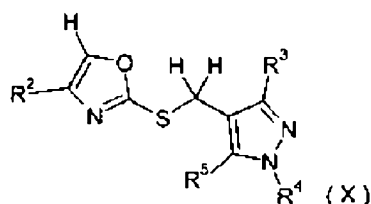
[00110] Os derivados de oxazol da Fórmula Geral (VII) empregados no processo e.) são conhecidos pelo técnico ou são comercialmente disponíveis ou preparáveis por processos conhecidos pelo técnico [vide, por exemplo, Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, volume 11, Ed. E. Schumann].

[00111] Os mercaptanos da Fórmula Geral (IX) empregados no processo e.) são conhecidos pelo técnico (vide, por exemplo, a WO 2004/013106 A) ou podem ser preparados de maneira análoga aos processos conhecidos pelo técnico para a produção de mercaptano.

f.) A preparação de tioéteres da Fórmula (II), na qual  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula (I) e  $R^1$  representa halogênio ou nitro



[00112] pode ser efetuada, por exemplo, através da reação de um derivado de oxazol da Fórmula Geral (X)



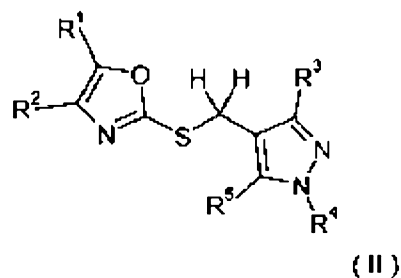
[00113] na qual  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula (I). De modo geral, a reação é representada pelo seguinte esquema de fórmula:



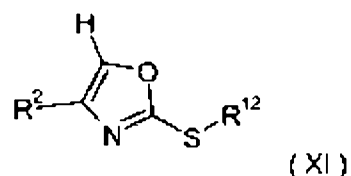
[00114] Os compostos da Fórmula Geral (X) são tratados com um agente halogenante, tal como, por exemplo, halogênio, tal como cloro, bromo, iodo ou halossuccinimida, tal como N-clorossuccinimida (NCS), N-bromossuccinimida (NBS), N-iodossuccinimida (NIS) ou para nitro com um agente de nitração, tal como, por exemplo, ácido sulfonítrico, preparado a partir de ácido sulfúrico e ácido nítrico e reagidos em solventes adequados, tais como hidrocarbonetos clorados, por exemplo, tetraclorometano, diclorometano, 1,2-dicloroetano ou dimetilformamida, para compostos da Fórmula (II).

[00115] Os derivados de tioéteres da Fórmula Geral (X) empregados no processo f.) são preparáveis por processos conhecidos pelo técnico (vide, por exemplo: DE 26 25 229 A, WO 99/52874 A, WO 01/66529 A, WO 95/24403 A; ou pelos processos mencionados acima em b.), c.), d.), e.).

g.) A preparação de tioéteres da Fórmula (II), na qual R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula Geral (I),



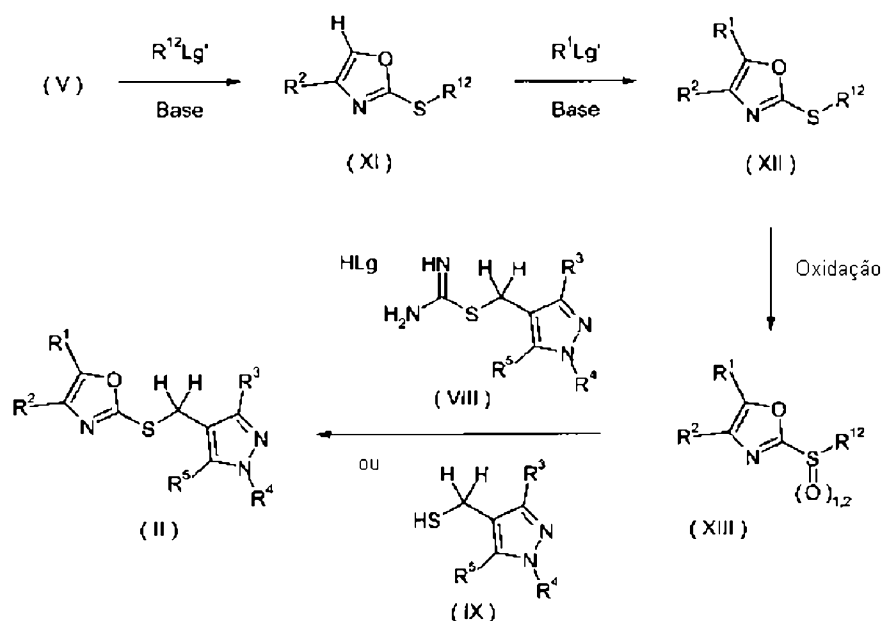
[00116] pode decorrer, por exemplo, através da reação de um derivado de oxazol da Fórmula Geral (XI)



[00117] a partir de um derivado de oxazol da Fórmula Geral (V), através da reação com um agente de alquilação  $R^{12}Lg'$ , na qual  $R^2$  apresenta o significado indicado acima de acordo com a Fórmula (I);  $R^{12}$  é preferivelmente (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, a qual não é substituída ou é substituída por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio e de modo particularmente preferido, é metila ou etila e  $Lg'$  representa um grupo de partida, sendo que como grupos de partida podem ser adequados, entre outros, cloro, bromo ou grupos metilsulfonila,

[00118] na presença de uma base forte e de um agente de alquilação  $R^1Lg'$ ,

[00119] em que  $R^1$  apresenta o significado indicado acima de acordo com a Fórmula (I), de acordo com o esquema



[00120] na qual  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula Geral (I) e  $Lg$  ou  $Lg'$  representa um grupo de partida, sendo que como grupos de partida podem ser

adequados, entre outros, flúor, cloro, bromo, iodo ou grupos de sulfonato, tais como metano-, trifluormetano-, etano-, fenil- ou toluenossulfonato e  $R^{12}$  apresenta preferivelmente o significado indicado acima.

[00121] Como base forte pode ser usada di-isopropilamida de lítio (LDA), tetrametilpiperidina de lítio (LTMP), hexametildissilazano de lítio (LHMDS), preferivelmente LDA, que podem ser preparados por processos conhecidos pelo técnico. A hexametilfosforamida (HMPT) pode ser usada, por exemplo, como cossolvente.

[00122] Como solventes servem solventes inertes, tais como hidrocarbonetos, tais como, por exemplo, hexano, heptano, ciclohexano, hidrocarbonetos aromáticos, tais como, por exemplo, benzeno, éteres, tais como, por exemplo, éter dietílico, éter metil-terc.-butílico (MTBE), tetraidrofurano e dioxano, preferivelmente tetraidrofurano. Os solventes mencionados acima também podem ser empregados como misturas. Nessa reação, os compostos da Fórmula (XI) e a base ou o agente de alquilação  $R^1Lg'$  são preferivelmente empregados em 0,9 a 1,5 mol dos últimos por mol dos primeiros. A reação é preferivelmente efetuada em uma faixa de temperatura entre  $-90^{\circ}\text{C}$  e o ponto de ebulição do solvente. O tempo de reação não está sujeito a nenhuma limitação, as reações estão geralmente concluídas após 1 a 24 horas.

[00123] Para preparar as sulfonas e sulfóxidos dos compostos da Fórmula Geral (II), na qual  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula Geral (I), é possível aplicar o método indicado em a).

[00124] Particularmente no caso em que  $R^1$  é flúor, empregam-se reagentes preferidos para a fluoração eletrofílica, tais como, por exemplo, 1-clorometil-4-flúor-1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano-bis-tetrafluorborato (F-TEDA-BF-4, SelectFluor<sup>®</sup>), imida de ácido N-fluorbenzenossulfônico (NFBS ou NFSi), N-flúor-o-

benzenodissulfonimida (NFOBS), 1-flúor-4-hidróxi-1,4-diazoniabicyclo[2.2.2]-octano bis(tetrafluorborato) (NFTh, AccuFluor®) e outros, tal como descrito em "Modern Fluoroorganic Chemistry", 2004, Wiley-VCH Verlag, Ed. P. Kirsch.

[00125] Os derivados de 2-mercapto-oxazol ou oxazol-2(3H)-tionas ou sais correspondentes dos derivados de 2-mercapto-oxazol ou derivados de oxazol-2(3H)-tiona da Fórmula Geral (V) empregadas no processo g.) são conhecidos pelo técnico ou são comercialmente disponíveis ou preparáveis por processos conhecidos pelo técnico, por exemplo, tal como descrito em Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, volume 11, Ed. E. Schaumann.

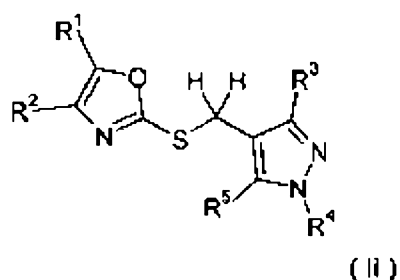
[00126] Derivados de oxazol (XI) podem, de maneira análoga aos processos conhecidos pelo técnico, ser desprotonizados regioseletivamente na posição 5. Reações análogas com o uso de uma base de alquila como butil-lítio, são descritas na literatura, por exemplo, em Boger, D. L. et al; *J. Med. Chem.* (2007) 50 (33), 1058-1068 e Molinski, T. F. et al. *J. Org. Chem.* (1998) 63, 551-555 e com terc.-butil-lítio e um sal de cobre em Marino, J. P.; Nguyen, N. *Tet. Lett.* (2003), 44, 7395-7398 e literatura ali citada.

[00127] Os derivados de oxazol da Fórmula Geral (XI) empregados no processo g.) podem ser preparados, por exemplo, de forma correspondente ao processo b.) através da reação de um derivado de 2-mercapto-oxazol ou derivado de oxazol-2(3H)-tiona da Fórmula Geral (V) com um agente de alquilação  $R^{12}Lg'$  ou por processos conhecidos pelo técnico [vide, por exemplo, Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, volume 11, Ed. E. Schaumann] ou são comercialmente disponíveis.

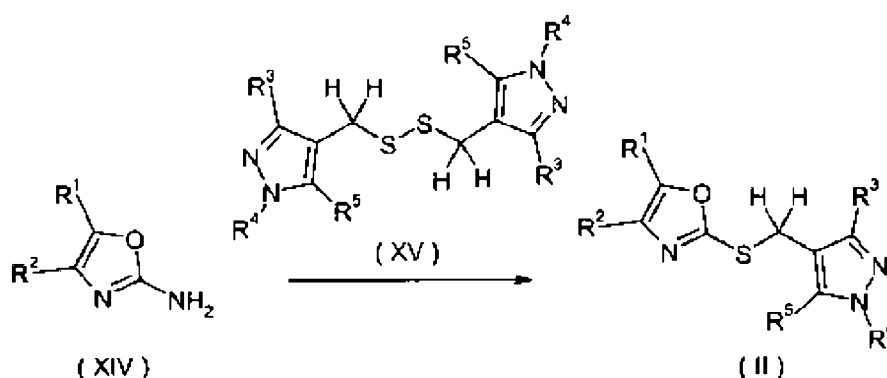
[00128] Os compostos da Fórmula (XIII) mencionados no processo g.) podem ser preparados a partir dos compostos da Fórmula (XII)

através de oxidação de acordo com o processo a) acima ou por processos conhecidos pelo técnico. Os compostos da Fórmula Geral (XIII), por seu lado, podem ser reagidos de acordo com os processos c.) ou d.) acima com sais de (1H-pirazol-4-ilmetil)-imidiotiocarbamato (VIII) ou com (1H-pirazol-4-ilmetil)-mercaptanos da Fórmula (IX) de acordo com os processos e.) acima para compostos do tipo (II).

h.) A preparação de tioéteres da Fórmula (II), na qual  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula (I),



[00129] pode ser efetuada, por exemplo, também através da reação de um derivado de dissulfeto de (1H-pirazol-4-ilmetila) da Fórmula Geral (XV) com 2-amino-oxazóis da Fórmula (XIV) e com um agente de diazotação, tal como representado no seguinte esquema



[00130] e no qual  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  apresentam os significados indicados acima de acordo com a Fórmula (I).

[00131] Os dissulfetos de (1H-pirazol-4-ilmetila) da Fórmula Geral (XV) são levados à reação com um agente de diazotação e com um derivado de 2-amino-oxazol da Fórmula Geral (XIV) em um solvente

adequado para compostos da Fórmula (II).

[00132] Solventes adequados são solventes inertes em relação à reação, tais como, por exemplo, hidrocarbonetos, assim como hexano, heptano, ciclo-hexano, hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno, clorobenzeno, tolueno, xileno, hidrocarbonetos halogenados, tais como, por exemplo, diclorometano, dicloroetano, clorofórmio e tetracloreto de carbono, ésteres, tais como, por exemplo, acetato de etila e acetato de metila, éteres, tais como, por exemplo, éter dietílico, éter metil-terc.-butílico, dioxano, nitrilas, assim como acetonitrila, alcoóis, tais como, por exemplo, metanol, etanol, álcool isopropílico, amidas, tal como, por exemplo, N,N-dimetilformamida e sulfóxidos, por exemplo, dimetilsulfóxido.

[00133] O reagente de diazotação pode ser, por exemplo, um éster de nitrito tal como nitrito de isoamila ou um sal de nitrito, tal como, por exemplo, nitrito de sódio. As proporções molares podem ser livremente selecionadas, quantidades equimolares dos dissulfetos de heteroarilalquila e dos agentes de diazotação são preferidas. Preferivelmente, a reação é efetuada a uma temperatura entre -20°C e o ponto de ebulição do solvente selecionado e está inteiramente concluída após um tempo de 0,1 a 40 horas.

[00134] A diazotação de um derivado de 2-amino-oxazol da Fórmula Geral (XIV) é descrita, por exemplo, em Hodgetts, K. J.; Kershaw, M. T. *Org. Lett.* (2002), 4(17), 2905-2907.

[00135] Os derivados de oxazol da Fórmula Geral (XIV) empregados no processo h.) são conhecidos pelo técnico ou comercialmente disponíveis ou preparáveis por processos conhecidos pelo técnico (vide *Science of Synthesis*, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, Volume 11, Ed. E. Schaumann).

[00136] Os dissulfetos de (1H-pirazol-4-ilmetila) da Fórmula Geral (XV) podem ser preparados por processos conhecidos pelo técnico,

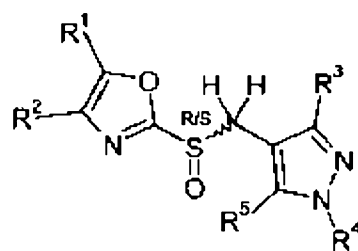
tais como são descritos, por exemplo, em Gladysz, J. A., Wong, V. K., Jick, B. S.; Tetrahedron (1979) 35, 2329.

[00137] Como grupos de partida Lg preferem-se os halogênios, por exemplo, cloro, bromo, iodo ou grupos de alquil- ou aril-sulfonila, tais como grupos metil-, etil-, fenil- ou tolilsulfonila, ou um grupo haloalquilsulfonila, tais como trifluormetila ou nitro, mas particularmente preferem-se cloro e metilsulfonila.

[00138] Como grupos de partida Lg' preferem-se os halogênios, por exemplo, cloro, bromo, iodo ou grupos de alquil- ou aril-sulfonila, tais como grupos metil-, etil-, fenil- ou tolilsulfonila, ou um grupo haloalquilsulfonila, tais como trifluormetila ou nitro, mas particularmente preferem-se cloro e metilsulfonila.

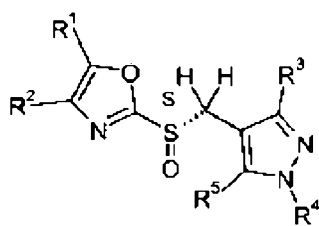
[00139] Como grupo R<sup>12</sup>, prefere-se (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, a qual não é substituída ou é eventualmente por um ou mais radicais iguais ou diferentes do grupo halogênio, de modo particularmente preferido, metila ou etila.

[00140] Os presentes compostos da Fórmula Geral (III)

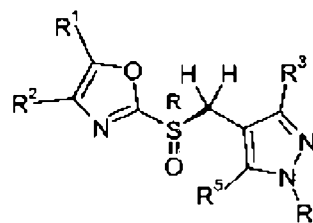


( III )

[00141] consistem em uma mistura dos respectivos enantiômeros (III-S) e (III-R) quirais na função sulfóxido:



( III-S )



( III-R )

[00142] Dessa maneira, eles apresentam um átomo de enxofre

quiral, o qual é mostrado na estrutura representada acima através da caracterização (R/S). De acordo com as regras segundo Cahn, Ingold e Prelog (regras CIP), este átomo de enxofre pode apresentar tanto uma configuração (R), quanto também uma configuração (S).

[00143] A presente invenção compreende compostos da Fórmula Geral (III), tanto com configuração (S), quanto também com configuração (R), isto é, que a presente invenção compreende os compostos da Fórmula Geral (III), nos quais o respectivo átomo de enxofre apresenta

- (1) uma configuração (R); ou
- (2) uma configuração (S).

[00144] Além disso, no contexto da presente invenção, também são compreendidas

(3) misturas desejadas de compostos da Fórmula Geral (III), os quais apresentam uma configuração (R) (compostos da Fórmula Geral (III-(R))), com compostos da Fórmula Geral (III), os quais apresentam uma configuração (S) (compostos da Fórmula Geral (III-S)).

[00145] A presente invenção compreende compostos da Fórmula Geral (III), que são racêmicos, isto é, nos quais os compostos da Fórmula Geral (III) com configuração (S) (compostos da Fórmula Geral (III-S) em comparação com a configuração (R) (compostos da Fórmula Geral (III-R) estão presentes como mistura 1:1 (50% de pureza estereoquímica).

[00146] Contudo, no contexto da presente invenção, também são preferidos compostos da Fórmula Geral (III) com configuração (S) (compostos da Fórmula Geral (III-S)) em comparação com a configuração (R) (compostos da Fórmula Geral (III-R)) com uma pureza estereoquímica de geralmente acima de 50% até 100%, preferivelmente 60 até 100%, especialmente 80 até 100%, de modo particularmente preferido, 90 até 100%, especialmente 95 até 100%, em que o respectivo composto (S) está presente, preferivelmente presente com uma enan-

tiosseletividade de respectivamente mais do que 50% ee, preferivelmente 60 até 100% ee, especialmente 80 até 100% ee, de modo muito particular, 90 até 100% ee, de modo mais preferido, 95 até 100% ee, em relação ao teor total do respectivo composto (S).

[00147] Além disso, no contexto da presente invenção também são preferidos compostos da Fórmula Geral (III) com configuração (R) (compostos da Fórmula Geral (III-R)) em comparação com a configuração (S) (compostos da Fórmula Geral (III-R)) com uma pureza estereoquímica de geralmente acima de 50% até 100%, preferivelmente 60 até 100%, especialmente 80 até 100%, de modo muito particular, 90 até 100%, especialmente 95 até 100%, em que o respectivo composto (R) está presente, preferivelmente presente com uma enantiosseletividade de respectivamente mais do que 50% ee, preferivelmente 60 até 100% ee, especialmente 80 até 100% ee, de modo muito particular, 90 até 100% ee, de modo mais preferido, 95 até 100% ee, em relação ao teor total do respectivo composto (S).

[00148] Consequentemente, a presente invenção se refere também a compostos da Fórmula Geral (III), nos quais a configuração estereoquímica está presente no átomo de enxofre (S) caracterizado com (\*) com uma pureza estereoquímica de 60 a 100% (S), preferivelmente 80 a 100% (S), especialmente 90 a 100% (S), de modo muito particular, 95 a 100% (S).

[00149] De acordo com a natureza e ligação dos substituintes, os compostos da Fórmula Geral (III) podem conter outros centros de quiralidade além do átomo de S marcado na Fórmula (III) com uma estrela (\*) e estão correspondentemente presentes como estereoisômeros. Os possíveis estereoisômeros definidos por sua forma espacial específica, tais como enantiômeros, diastereômeros, isômeros Z e E são todos compreendidos pela Fórmula (III). Se, por exemplo, estão presentes um ou mais grupos alquenila, então podem ocorrer diaste-

reômeros (isômeros Z e E). Se, por exemplo, estão presentes um ou vários átomos de carbono assimétricos, então podem ocorrer enantiômeros e diastereômeros. Os estereoisômeros podem ser obtidos a partir das misturas obtidas na preparação por métodos de separação convencionais, por exemplo, por processos de separação cromatográficos. Do mesmo modo, os estereoisômeros podem ser seletivamente preparados através do emprego de reações estereosseletivas utilizando substâncias de partida opticamente ativas e/ou substâncias auxiliares. Dessa maneira, a invenção se refere também a todos os estereoisômeros, que são compreendidos pela Fórmula Geral (III), contudo, não são indicados com sua estereoforma específica e suas misturas.

[00150] Se, por exemplo, estão presentes um ou mais grupos alquenila, então podem ocorrer diastereômeros (isômeros Z e E).

[00151] Se, por exemplo, estão presentes um ou mais átomos de carbono assimétricos, então podem ocorrer enantiômeros e diastereômeros. Estereoisômeros correspondentes podem ser obtidos a partir das misturas obtidas na preparação por métodos de separação convencionais, por exemplo, por processos de separação cromatográficos. Do mesmo modo, os estereoisômeros podem ser seletivamente preparados através do emprego de reações estereosseletivas utilizando substâncias de partida opticamente ativas e/ou substâncias auxiliares. Dessa maneira, a invenção se refere também a todos os estereoisômeros, que são compreendidos pela Fórmula Geral (I), contudo, não são indicados com sua estereoforma específica e suas misturas.

[00152] No contexto da presente invenção, também podem ser usados sais de adição de ácidos dos compostos da Fórmula Geral (I). Para a preparação dos sais de adição de ácidos dos compostos da Fórmula (I) incluem-se os seguintes ácidos: ácidos halogenídricos, tais como ácido clorídrico ou ácido bromídrico, além disso, ácido fosfórico, ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácidos carboxílicos mono- ou bifuncionais

e ácidos hidroxicarboxílicos, tais como ácido acético, ácido maleico, ácido succínico, ácido fumárico, ácido tartárico, ácido cítrico, ácido salicílico, ácido sórbico ou ácido láctico, bem como ácidos sulfônicos, tal como ácido p-toluenossulfônico ou ácido 1,5-naftalenodissulfônico. Os compostos de adição de ácidos da Fórmula (I) podem ser obtidos de maneira simples de acordo com os métodos de formação de sal convencionais, por exemplo, dissolvendo um composto da Fórmula (I) em um solvente orgânico adequado, tal como, por exemplo, metanol, acetona, cloreto de metileno ou benzina e acrescentando o ácido a temperaturas de 0 a 100°C e isolados de maneira conhecida, por exemplo, através de filtração e purificados eventualmente através de lavagem com um solvente orgânico inerte.

[00153] Os sais de adição de bases dos compostos da Fórmula (I) são preferivelmente preparados em solventes polares inertes, tais como, por exemplo, água, metanol ou acetona a temperaturas de 0 a 100°C. Bases adequadas para a preparação dos sais de acordo com a invenção, são por exemplo, carbonatos de metais alcalinos, tal como carbonato de potássio, hidróxidos de metais alcalinos e metais alcalinoterrosos, tais como, por exemplo, NaOH ou KOH, hidretos de metais alcalinos e metais alcalinoterrosos, tais como, por exemplo, NaH, alcoolatos de metais alcalinos e metais alcalinoterrosos, tais como, por exemplo, metanolato de sódio ou terc.-butilato de potássio, amoníaco, etanolamina ou hidróxido de amônio quaternário da Fórmula  $[NRR'R''R''']^+ OH^-$ .

[00154] Coleções de compostos da Fórmula (I) e/ou seus sais, que podem ser sintetizados através das reações mencionadas acima, também podem ser preparados de maneira paralela, sendo que isso pode ocorrer manualmente, parcialmente automatizado ou de maneira inteiramente automatizada. Nesse caso, por exemplo, é possível, automatizar a condução da reação, o processamento ou a purificação dos

produtos ou estágios intermediários. Ao todo, entende-se sob isto um modo de procedimento, tal como é descrito, por exemplo, por D. Tiebes em *Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening* (editor Günther Jung), Verlag Wiley 1999, nas páginas 1 a 34.

[00155] Para a condução paralela da reação e processamento, pode ser usada uma série de aparelhos disponíveis no comércio, por exemplo, blocos de reação Calypso (Calypso reaction blocks) da empresa Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, EUA ou estações de reação (reaction stations) da empresa Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, Inglaterra ou MultiPROBE Automated Workstations da empresa Perkin Elmer, Waltham, Massachusetts 02451, EUA. Para a purificação paralela de compostos da Fórmula Geral (I) e seus sais, respectivamente, de produtos intermediários obtidos na preparação há, entre outros, aparelhos de cromatografia à disposição, por exemplo, da firma ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EUA.

[00156] Os aparelhos citados levam a um modo de procedimento modular, no qual os estágios de trabalho individuais são automatizados, entre os estágios de trabalho, contudo, precisam ser efetuadas operações manuais. Isso pode ser contornado pelo emprego de sistemas de automatização parcial ou inteiramente integrados, nos quais os respectivos módulos de automação são acionados, por exemplo, por robôs. Tais sistemas de automação podem ser referidos, por exemplo, pela firma Caliper, Hopkinton, MA 01748, EUA.

[00157] A execução de estágios de síntese individuais de vários deles pode ser auxiliada pelo emprego de reagentes à base de polímero / resinas sequestrantes. Na literatura científica é descrita uma série de protocolos de teste, por exemplo, em *ChemFiles*, volume 4, nº 1, *Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis* (Sigma-Aldrich).

[00158] Além dos métodos aqui descritos, a preparação de compostos da Fórmula Geral (I) e seus sais pode ser efetuada inteira ou parcialmente por métodos suportados por fases sólidas. Para esse fim, estágios intermediários individuais ou todos os estágios intermediários da síntese ou uma síntese adaptada ao modo de procedimento correspondente é ligada a uma resina de síntese. Métodos de síntese suportados por fases sólidas são suficientemente descritos na literatura científica, por exemplo, Barry A. Bunin em "The Combinatorial Index", editora Academic Press, 1998 e Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (editor Günther Jung), editora Wiley, 1999. O uso de métodos de síntese suportados por fases sólidas permite uma série de protocolos conhecidos da literatura, que por sua vez, podem ser executados manualmente ou automatizados. As reações podem ser efetuadas, por exemplo, por meio da tecnologia IRORI em microrreatores (microreactors) da firma Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, EUA.

[00159] A execução de etapas de síntese individuais ou de várias delas através do emprego da tecnologia de micro-onda pode ser suportada tanto em fase sólida, quanto também em fase líquida. Na literatura científica é descrita uma série de protocolos de testes, por exemplo, em Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (editor C. O. Kappe e a. Stadler), editora Wiley, 2005.

[00160] A preparação de acordo com os processos aqui descritos gera compostos da Fórmula (I) e seus sais em forma de coleções de substâncias, que são mencionadas bibliotecas. O objeto da presente invenção são também bibliotecas, que contêm pelo menos dois compostos da Fórmula (I) e seus sais.

[00161] Com base em suas propriedades herbicidas e reguladoras do crescimento de plantas, as substâncias ativas também podem ser empregadas para combater plantas daninhas em culturas de plantas

conhecidas ou geneticamente modificadas a serem ainda desenvolvidas. Via de regra, as plantas transgênicas destacam-se por propriedades vantajosas particulares, por exemplo, por resistências contra certos pesticidas, principalmente certos herbicidas, resistências contra doenças de plantas ou patógenos de doenças de plantas, tais como certos insetos ou micro-organismos, tais como fungos, bactérias ou vírus. Outras propriedades particulares referem-se, por exemplo, ao material colhido com respeito à quantidade, à qualidade, à armazenabilidade, à composição e a substâncias constitutivas especiais. Dessa maneira, são conhecidas plantas transgênicas com alto teor de amido ou qualidade modificada do amido ou aquelas com diferente composição do ácido graxo do material colhido. Outras propriedades particulares podem ser encontradas em uma tolerância ou resistência contra estressores abióticos, por exemplo, calor, frio, seca, sal e radiação ultravioleta.

[00162] A aplicação dos compostos da Fórmula (I) ou de seus sais, de acordo com a invenção, é preferida em culturas transgênicas economicamente importantes de plantas úteis ou ornamentais, por exemplo, de cereais, tais como trigo, cevada, centeio, aveia, painço, arroz, mandioca e milho ou também em culturas de beterraba, algodão, soja, colza, batata, tomate, ervilha e outras variedades de legumes.

[00163] Preferivelmente, os compostos da Fórmula (I) podem ser empregados como herbicidas em culturas de plantas úteis, que são resistentes contra os efeitos fitotóxicos dos herbicidas ou foram tornados geneticamente resistentes.

[00164] Métodos convencionais para a produção de novas plantas, que em comparação com as plantas existentes até agora, apresentam propriedades modificadas, consistem, por exemplo, em processos de cultivo clássicos e na produção de mutantes.

[00165] Alternativamente, novas plantas com propriedades modificadas podem ser produzidas com auxílio de processos de engenharia genética (vide, por exemplo, a EP 0221044, EP 0131624). Em vários casos foram descritas, por exemplo,

- modificações genéticas de plantas cultivadas com a finalidade de modificar o amido sintetizado nas plantas (por exemplo, WO 92/011376 A, WO 92/014827 A, WO 91/019806 A),

- plantas transgênicas cultivadas, as quais são resistentes contra certos herbicidas do tipo glufosinato (compare, por exemplo, a EP 0.242.236 A, EP 0.242.246 A) ou glifosato (WO 92/000377 A) ou sulfonilureias (EP 0.257.993 A, US 5.013.659) ou contra combinações ou misturas desses herbicidas através de piramidação de genes ("gene stacking"), tais como plantas transgênicas cultivadas, por exemplo, milho ou soja com o nome comercial ou a designação Optimum® GAT® (tolerantes ao glifosato ALS),

- plantas transgênicas cultivadas, por exemplo, algodão, com a capacidade de produzir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt), as quais tornam as plantas resistentes contra certos parasitas (EP 0.142.924 A, EP 0.193.259 A),

- plantas transgênicas cultivadas com composição modificada do ácido graxo (WO 91/013972 A),

- plantas cultivadas geneticamente modificadas com novas substâncias constitutivas ou secundárias, por exemplo, novas fitoalexinas, que causam uma resistência aumentada a doenças (EP 0.309.862 A, EP 0.464.461 A),

- plantas geneticamente modificadas com baixa fotorrespiração, que apresentam maiores rendimentos e maior tolerância ao estresse (EP 0.305.398 A),

- plantas transgênicas cultivadas, que produzem proteínas farmacologicamente ou diagnosticamente importantes ("molecular

pharming"),

- plantas transgênicas cultivadas, que se destacam por maiores rendimentos ou melhor qualidade,

[00166] plantas transgênicas cultivadas, que se destacam por uma combinação, por exemplo, das novas propriedades mencionadas acima ("gene stacking").

[00167] Inúmeras técnicas de biologia molecular, com as quais as novas plantas transgênica com propriedades modificadas podem ser produzidas, são, em princípio, conhecidas; vide, por exemplo, I. Potrykus e G. Spangenberg (eds.) Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg ou Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

[00168] Para tais manipulações genéticas, moléculas de ácido nucleico podem ser introduzidas em plasmídeos, que permitem uma mutagênese ou uma modificação sequencial através da recombinação de sequências de DNA. Com auxílio de processos-padrão, por exemplo, podem ser efetuadas trocas de bases, sequências parciais podem ser removidas ou acrescentadas sequências naturais ou sintéticas. Para unir fragmentos de DNA entre si, é possível ligar adaptadores ou ligantes, vide, por exemplo, Sambrook et al, 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2ª edição Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; ou Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim, 2ª edição 1996.

[00169] A produção de células de plantas com uma atividade reduzida de um produto gênico pode ser obtida, por exemplo, através da expressão de pelo menos um RNA antissenso correspondente, de um RNA de senso positivo para a obtenção de um efeito de cossupressão ou pela expressão de pelo menos uma ribozima construída de maneira correspondente, que dissocia especificamente transcrições do produto gênico mencionado acima.

[00170] Para esse fim, por um lado, podem ser usadas moléculas de DNA, que compreendem toda a sequência codificadora de um produto gênico, inclusive sequências flanqueadas eventualmente presentes, como também moléculas de DNA, que compreendem apenas partes da sequência codificadora, sendo que essas partes devem ser suficientemente longas, para causar um efeito antissenso nas células. É possível também usar sequências de DNA, as quais apresentam um alto grau de homologia para as sequências codificadoras de um produto gênico, mas não são completamente idênticas.

[00171] Na expressão de moléculas de ácido nucleico em plantas, a proteína sintetizada pode estar localizada em cada compartimento desejado da célula vegetal. Mas para obter a localização em um certo compartimento, por exemplo, a região codificadora pode ser ligada com sequências de DNA, que asseguram a localização em um certo compartimento. Tais sequências são conhecidas pelo técnico (vide, por exemplo, Braun et al, EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al, Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al, Plant J. 1 (1991), 95-106). A expressão das moléculas de ácido nucleico também pode realizar-se nas organelas das células de plantas.

[00172] As células de plantas transgênicas podem ser regeneradas para plantas inteiras por técnicas conhecidas. No caso das plantas transgênicas, pode tratar-se, em princípio, de plantas de qualquer espécie de planta desejada, isto é, tanto de plantas monocotiledôneas, como também dicotiledôneas.

[00173] Dessa maneira, é possível obter plantas transgênicas, que apresentam propriedades modificadas através de superexpressão, supressão ou inibição de genes homólogos (= naturais) ou sequências de genes ou expressão de genes heterólogos (= estranhos) ou sequências de genes.

[00174] Preferivelmente, os compostos (I) de acordo com a inven-

ção, podem ser empregados em culturas transgênicas, as quais são resistentes contra substâncias de crescimento, tais como, por exemplo, 2,4 D, dicamba ou contra herbicidas, que inibem enzimas de plantas essenciais, por exemplo, acetolactato sintase (ALS), EPSP sintases, glutamina sintases (GS) ou hidroxifenilpiruvato dioxigenases (HPPD), respectivamente, contra herbicidas do grupo das sulfonilureias, dos glifosatos, glufosinatos ou benzoilisoaxazóis e substâncias ativas análogas ou contra combinações desejadas dessas substâncias ativas.

[00175] De modo particularmente preferido, os compostos, de acordo com a invenção, podem ser empregados em plantas transgênicas cultivadas, que são resistentes contra uma combinação de glifosatos e glufosinatos, glifosatos e sulfonilureias ou imidazolinonas. De modo muito particularmente preferido, os compostos de acordo com a invenção, podem ser empregados em plantas transgênicas cultivadas, tais como, por exemplo, milho ou soja com o nome comercial ou a designação Optimum® GAT® (Glyphosate ALS Tolerant).

[00176] Quando as substâncias ativas, de acordo com a invenção, são aplicadas em culturas transgênicas, ocorrem frequentemente efeitos, além dos efeitos em relação às plantas daninhas a serem observados em outras culturas, que são específicos para a aplicação na respectiva cultura transgênica, por exemplo, um espectro de ervas daninhas modificado ou especialmente ampliado, que pode ser combatido, quantidades de aplicação modificadas, que podem ser empregadas para a aplicação, preferivelmente boa combinabilidade com os herbicidas, contra os quais a cultura transgênica é resistente, bem como influência do crescimento e rendimento das plantas transgênicas cultivadas.

[00177] Por conseguinte, o objeto da invenção é também o uso dos compostos da Fórmula (I) de acordo com a invenção, como herbi-

cidas para combater plantas daninhas em plantas transgênicas cultivadas.

[00178] Os compostos, de acordo com a invenção, podem ser aplicados em forma de pós de pulverização, concentrados emulsificáveis, soluções aspersíveis, pós de polvilhamento ou granulados nas preparações convencionais. Por conseguinte, o objeto da invenção são também herbicidas e agentes reguladores do crescimento de plantas, os quais contêm os compostos de acordo com a invenção.

[00179] Os compostos da Fórmula Geral (I) podem ser formulados de diferente maneira, dependendo dos parâmetros biológicos e/ou químico-físicos predeterminados. Como possibilidades de formulações incluem-se, por exemplo: pós de pulverização (WP), pós hidrossolúveis (SP), concentrados hidrossolúveis, concentrados emulsificáveis (EC), emulsões (EW), tais como emulsões óleo-em-água e água-em-óleo, soluções aspersíveis, concentrados de suspensão (SC), dispersões à base de óleo ou água, soluções miscíveis em óleo, suspensões em cápsulas (CS), pós de polvilhamento (DP), desinfetantes, granulados para a aplicação por espalhamento e no solo, granulados (GR) em forma de microgranulados, granulados de pulverização, granulados revestidos e de adsorção, granulados dispersíveis em água (WG), granulados hidrossolúveis (SG), formulações ULV, microcápsulas e ceras.

[00180] Esses tipos de formulações individuais são, em princípio, conhecidos e são descritos, por exemplo, em: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", volume 7, C. Hanser Verlag Munique, 4ª edição 1986; van Valkenburg, "Pesticides Formulations", Marcel Dekker N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3a. Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. Londres.

[00181] Os agentes auxiliares de formulações necessários, tais como materiais inertes, agentes tensoativos, solventes e outras subs-

tâncias aditivas, são igualmente conhecidos e são descritos, por exemplo, em: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2a Ed., Darland Books, Caldwell N.J.; H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2a Ed., J. Wiley & Sons, N.Y. Marsden, "Solvents Guide", 2a Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's, "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Volume 7, C. Hanser Verlag Munique, 4ª Ed. 1986.

[00182] Com base nessas formulações, é possível produzir também combinações com outras substâncias de ação pesticida, tais como, por exemplo, inseticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, bem como com protetores, adubos e/ou reguladores de crescimento, por exemplo, em forma de uma formulação pronta ou como mistura de tanque.

[00183] Pós de pulverização são preparados uniformemente dispersíveis em água, que ao lado da substância ativa, além de um diluente ou substância inerte, ainda contêm agentes tensoativos de natureza iônica e/ou não iônica (umectantes, agentes de dispersão), por exemplo, alquilfenóis polioxetilados, alcoóis graxos polioxetilados, aminas graxas polioxetiladas, sulfatos de éter poliglicólico de álcool graxo, alcanossulfonatos, alquilbenzenossulfonatos, ligninossulfonato de sódio, 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-dissulfonato de sódio, dibutilnaftaleno-sulfonato de sódio ou também oleoilmetilaurinato de sódio. Para a produção dos pós de pulverização, as substâncias ativas herbicidas são, por exemplo, finamente moídas em aparelhos convencionais, tais como moinhos de martelos, moinhos de ventoinhas e moinhos de jato de ar e ao mesmo tempo ou subsequentemente, são misturadas com

os agentes auxiliares de formulações.

[00184] Concentrados emulsificáveis são produzidos dissolvendo a substância ativa em um solvente orgânico, por exemplo, butanol, ciclo-hexanona, dimetilformamida, xileno ou também em compostos aromáticos com ponto de ebulição mais elevado ou hidrocarbonetos ou misturas dos solventes orgânicos com adição de um ou mais agentes tensoativos de natureza iônica e/ou não iônica (emulsificantes). Como emulsificantes podem ser usados, por exemplo: sais de alquilarilsulfonato de cálcio, tais como dodecilbenzenossulfonato de cálcio ou emulsificantes não iônicos, tais como éster poliglicólico de ácido graxo, éter alquilarilpoliglicólico, éter poliglicólico de álcool graxo, produtos de condensação de óxido de propileno-óxido de etileno, alquilmoliéteres, ésteres de sorbitano, tais como, por exemplo, ésteres de ácido sorbitanograxo ou ésteres de ácido polioxietilenossorbitanograxo, tais como, por exemplo, ésteres de ácido polioxietilenossorbitanograxo.

[00185] Pós de polvilhamento são obtidos moendo a substância ativa com substâncias sólidas finamente divididas, por exemplo, talco, argilas naturais, tais como caulim, bentonita e pirofilita ou terra de infusórios.

[00186] Concentrados de suspensão podem ser à base de água ou óleo. Eles podem ser produzidos, por exemplo, através de moagem por via úmida por meio de moinhos de pérolas comercialmente usuais e eventualmente adição de agentes tensoativos, tais como já são citados, por exemplo, acima nos outros tipos de formulações.

[00187] Emulsões, por exemplo, emulsões óleo-em-água (EW) podem ser produzidas, por exemplo, por meio de agitadores, moinhos coloidais e/ou misturadores estáticos com o emprego de solventes orgânicos aquosos e eventualmente agentes tensoativos, tais como já são citados, por exemplo, acima nos outros tipos de formulações.

[00188] Granulados podem ser produzidos ou vaporizando a sub-

stância ativa sobre material inerte granulado, capaz de adsorção ou aplicando os concentrados de substância ativa por meio de agentes de adesão, por exemplo, álcool polivinílico, poliacrilato de sódio ou também óleos minerais, sobre a superfície de veículos, tais como areia, caulinitas ou de material inerte granulado. Substâncias ativas adequadas também podem ser granuladas de maneira usual para a produção de grânulos de adubo – caso desejado, em mistura com adubos.

[00189] Granulados dispersíveis em água são produzidos, via de regra, pelos processos convencionais, tais como secagem por atomização, granulação em leito fluidizante, granulação em pratos, mistura com misturadores de alta velocidade e extrusão sem material inerte sólido.

[00190] Para a produção de granulados de pratos, leito fluidizante, extrusão e de pulverização, vide, por exemplo, os processos em "Spray-Drying Handbook" 3a ed. 1979, G. Goodwin Ltd., Londres; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, páginas 147 e seguintes, "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5a. Ed., McGraw-Hill, Nova York 1973, página 8-57.

[00191] Para outras particularidades para a formulação de preparados para proteger plantas, vide, por exemplo, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley e Sons, Inc., Nova York, 1961, páginas 81-96 e J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5a Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

[00192] As preparações agroquímicas contêm, via de regra, 0,1 a 99% em peso, especialmente 0,1 a 95% em peso de substância ativa da Fórmula (I).

[00193] Nos pós de pulverização, a concentração da substância ativa importa, por exemplo, em cerca de 10 a 90% em peso, o restante para 100% em peso, consiste nos componentes de formulações con-

vencionais. Nos concentrados emulsificáveis, a concentração de substância ativa pode importar em cerca de 1 a 90, preferentemente 5 a 80% em peso. Formulações em forma de pó contêm 1 a 30% em peso de substância ativa, preferentemente na maioria das vezes, 5 a 20% em peso de substância ativa, soluções aspersíveis contêm cerca de 0,05 a 80, preferentemente 2 a 50% em peso de substância ativa. Nos granulados dispersíveis em água, o teor da substância ativa depende, em parte, se o composto eficaz está presente em forma líquida ou sólida e quais são os agentes auxiliares de granulação, materiais de enchimento e outros usados. Nos granulados dispersíveis em água, o teor da substância ativa encontra-se, por exemplo, entre 1 e 95% em peso, preferentemente entre 10 e 80% em peso.

[00194] Além disso, as formulações de substâncias ativas mencionadas contêm eventualmente os agentes de adesão, umidificação, dispersão, emulsificação, penetração, conservação, de proteção contra geada e solventes, materiais de enchimento, de suporte e corantes, desespumantes, inibidores de evaporação e agentes que influenciam o valor de pH e a viscosidade convencionais.

[00195] Os compostos da Fórmula Geral (I) ou seus sais podem ser empregados combinados com outras substâncias de ação pesticida, tais como, por exemplo, inseticidas, acaricidas, nematocidas, herbicidas, fungicidas, protetores, adubos e/ou reguladores de crescimento, por exemplo, como formulação pronta ou como mistura de tanque.

[00196] Como participantes de combinações para os compostos da Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção em formulações de misturas ou na mistura de tanque, podem ser empregadas, por exemplo, substâncias ativas conhecidas, que se baseiam em uma inibição de, por exemplo, acetolactato sintase, acetil-CoA-carboxilase, celulose sintase, enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintase, glutamina sintase, p-hidroxifenilpiruvato dioxigenase, fitoendessaturase, fotossiste-

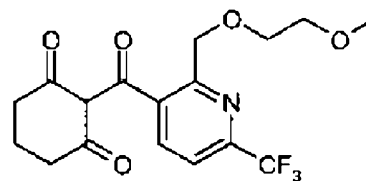
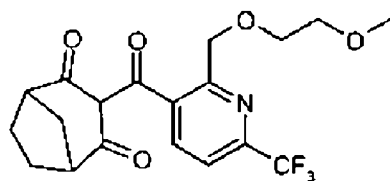
ma I, fotossistema II, protoporfirinogeno oxidase, tais como são conhecidas, por exemplo, de Weed Research 26 (1986) 441-445 ou "The Pesticide Manual", 14a Edição, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2003 e literatura ali citada. Como herbicidas ou reguladores do crescimento de plantas conhecidos, que podem ser combinados com os compostos de acordo com a invenção, podem ser mencionadas, por exemplo, as seguintes substâncias ativas (os compostos são designados ou pelo "nome comum" de acordo com a International Organization for Standardization (ISO) ou pelo nome químico ou com o número de código) e compreendem sempre todas as formas de aplicação, tais como ácidos, sais, ésteres e isômeros, tais como estereoisômeros e isômeros ópticos. Nesse caso, são mencionadas uma e, em parte, também várias formas de aplicação:

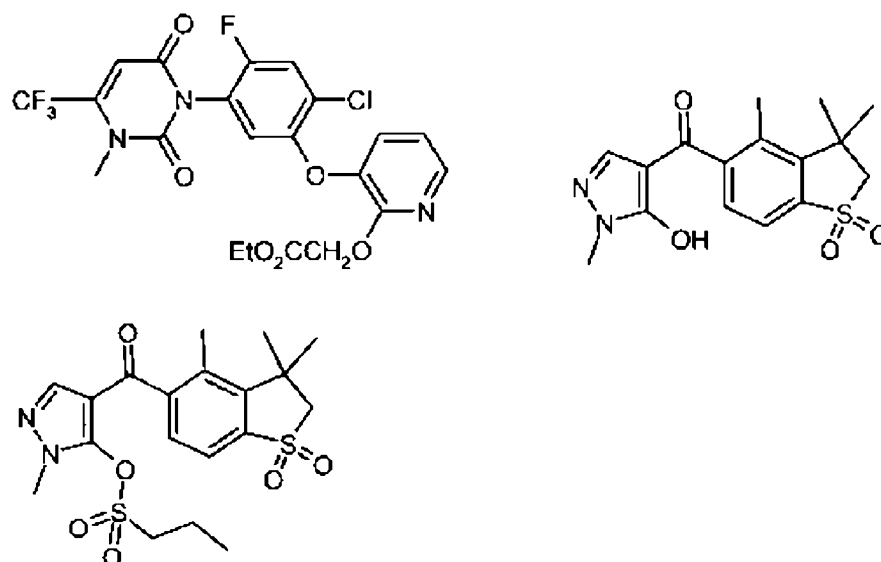
[00197] acetoclor, acibenzolar, acibenzolar-S-metila, acifluorfen, acifluorfen-sódio, aclonifen, alaclor, alidoclor, aloxidim, aloxidim-sódio, ametrin, amicarbazona, amidoclor, amidossulfuron, aminociclopiraclor, aminopiralida, amitrol, sulfamato de amônio, ancimidol, anilofos, asulam, atrazina, azafenidina, azinsulfuron, aziprotrin, BAH-043, BAS-140H, BAS-693H, BAS-714H, BAS-762H, BAS-776H, BAS-800H, beflubutamida, benazolina, benazolin-etila, bencarbazona, benfluralina, benfuresato, bensulida, bensulfuron-metila, bentazona, benzfendizona, benzobiciclon, benzofenap, benzofluor, benzoilprop, bifenox, bilanafos, bilanafos-sódio, bispiribac, bispiribac-sódio, bromacila, bromobutida, bromofenoxim, bromoxinil, bromuron, butaclor, butafenacila, butamifos, butenaclor, butralin, butroxidim, butilato, cafenstrol, carbetamida, carfentrazona, carfentrazon-etila, clometoxifen, cloramben, clorazifop, clorazifop-butila, clorbromuron, clorbufam, clorfenac, clorfenac-sódio, clorfenprop, clorflurenol, clorflurenol-metila, cloridazon, clorimuron, clorimuron-etila, cloreto de clormequat, clornitrofen, cloroftalim, clortal-dimetila, clorotoluron, clorsulfuron, cinidon, cinidon-etila, cinmetilin, ci-

nosulfuron, cletodim, clodinafop, clodinafop-propargila, clofencet, clo-mazona, clomeprop, cloprop, clopiralida, cloransulam, cloransulam-metila, cumiluron, cianamida, cianazina, ciclanilida, cicloato, ciclossulfamuron, cicloxidim, cicluron, cihalofop, cihalofop-butila, ciperquat, ciprazina, ciprazol, 2,4-D, 2,4-DB, diamuron/dinron, dalapon, daminozida, dazomet, n-decanol, desmedifam, desmetrin, detosil-pirazolato (DTP), dialato, dicamba, diclobenila, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclofop-metila, diclofop-P-metila, diclosulam, dietatil, dietatil-etila, difenoxuron, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflufenzopir-sódio, dimefuron, dikegulac-sódio, dimefuron, dimepiperato, dimetaclor, dimetametrina, dimetenamida, dimetenamida-P, dimetipin, dimetrassulfuron, dinitramina, dinoseb, dinoterb, difenamida, dipropetrin, diquat, dibrometo de diquat, ditiopir, diuron, DNOC, eglinazina-etila, endotal, EPTC, esprocarb, etalfluralina, etametsulfuron-metila, etefon, etidimuron, etiozina, etofumesato, etoxifeno, etoxifen-etila, etoxissulfuron, etobenzanida, F-5331, isto é, N-[2-cloro-4-flúor-5-[4-(3-fluorpropil)-4,5-dihidro-5-oxo-1H-tetrazol-1-il]-fenil]-etanossulfonamida, fenoprop, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etila, fenoxaprop-P-etila, fentrazamida, fenuron, flamprop, flamprop-M-isopropila, flamprop-M-metila, flazasulfuron, flucarbazona, flucarbazon-sódio, flucetossulfuron, flucloralin, flufenacet (tiafluamida), flufenpir, flufempir-etila, flumetralina, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentila, flumioxazin, flumipropin, fluometuron, fluordifen, fluorglicofen, fluoroglicofen-etila, flupoxam, flupropacila, flupropanato, flupirsulfuron, flupirsulfuron-metil-sódio, flurenol, flurenol-butila, fluridon, flurocloridona, fluroxipir, fluroxipirmeptila, flurprimidol, flurtamone, flutiacet, flutiacet-metila, flutiamida, fomesafen, foransulfuron, forclorfenuron, fosamina, furiloxifen, ácido giberelínico, glufosinato, glufosinato-L, glufosinato-amônio, glifosato, glifosato-isopropilamônio, H-9201, halosafen, halossulfuron, halossulfuron-metila, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-etoxietila, haloxifop-P-

etoxietila, haloxifop-metila, haloxifop-P-metila, hexazinona, HNPC-9908, HOK-201, HW-02, imazametabenz, imazametabenz-metila, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin, imazetapir, imazossulfuron, inabenfida, indanofan, ácido indolacético (IAA), ácido 4-indol-3-ilbutírico (IBA), iodossulfuron, iodosulfuron-metil-sódio, ioxinila, isocarbamida, isopropalina, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxaclortol, isoxaflutol, isoxapirifop, KUH-043, KUH-071, karbutilato, ketospiradox, lactofen, lenacila, linuron, hidrazida de ácido maleico, MCPA, MCPB, MCPB-metila, -etila e -sódio, mecoprop, mecoprop-sódio, mecoprop-butotila, mecoprop-P-butotila, mecoprop-P-dimetilamônio, mecoprop-P-2-etil-hexila, mecoprop-P-potássio, mefenacet, mefluidida, cloreto de mepiquat, mesossulfuron, mesossulfuron-metila, mesotriona, metoxifenona, metildimron, 1-metilciclopropeno, isotiocianato de metila, metobenzuron, metobromuron, metolaclor, S-metolaclor, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron, metsulfuron-metila, molinato, monalida, monocarbamida, di-hidrogenossulfato de monocarbamida, monolinuron, monossulfuron, monuron, MT 128, MT-5950, isto é, N-[3-cloro-4-(1-metiletil)-fenil]-2-metilpentanamida, NGGC-011, naproanilida, nappropamida, naptalam, NC-310, isto é, 4-(2,4-diclorobenzoil)-1-metil-5-benziloxipirazóis, neburon, nicosulfuron, nipiraclofeno, nitalina, nitrofen, nitrofenolato-sódio (mistura isomérica), nitrofluorfen, ácido nonanoico, norflurazon, orbencarb, ortossulfamuron, orizalina, oxadiargila, oxadiazon, oxassulfuron, oxaziclomefon, oxifluorfen, paclobutrazol, paraquat, dicloreto de paraquat, ácido pelargônico (ácido nonanoico), pendimetalin, pendralina, penoxsulam, pentanoclor, pentoxazona, perfluidona, petoxamid, fenisofam, fenmedifam, fenmedifam-etila, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperofos, pirifenop, pirifenop-butila, preti-laclor, primissulfuron, primissulfuron-metila, probenazol, profluazol, prociazina, prodiamina, prifluralina, profoxidim, prohexadiona, prohexadiona-cálcio, prohidrojasmona, prometon, prometrin, propaclor, pro-

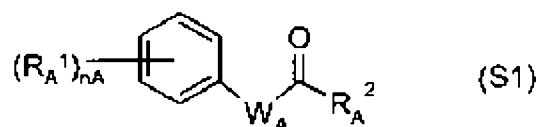
panila, propaquizafop, propazina, profam, propisoclor, propoxicarbazona, propoxicarbazon-sódio, propizamida, prossulfalina, prossulfocarb, prossulfuron, prinaclor, piraclonila, piraflufen, piraflufen-etila, pirassulfotol, pirazolinato (pirazolato), pirazossulfuron-etila, pirazoxifen, piribambenz, piribambenz-isopropila, piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, piriftalida, piriminobac, piriminobac-metila, pirimisulfan, piritiobac, piritiobac-sódio, piroxassulfona, piroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinoclamina, quizalofop, quizalofop-etila, quizalofop-P, quizalofop-P-etila, quizalofop-P-tefurila, rimsulfuron, saflufenacil, secbumeton, setoxidim, siduron, simazina, simetrin, SN-106279, sulcotriona, sulfalato (CDEC), sulfentrazona, sulfometuron, sulfometuron-metila, sulfosato (glifosato-trimésio), sulfosulfuron, SYN-523, SYP-249, SYP-298, SYP-300, tebutam, tebutiuron, tecnazeno, tefuriltriona, tembotriona, tepraloxidim, terbacila, terbucarb, terbuclor, terbumeton, terbutilazina, terbutrin, TH-547, tenilclor, tiafluamida, tiazafluron, tiazopir, tidiazimina, tidiazuron, tiencarbazona, tiencarbazon-metila, tifensulfuron, tifensulfuron-metila, tiobencarb, tiocarbazila, topramezona, tralcoxidim, trialato, triassulfuron, triaziflam, triazofenamida, tribenuron, tribenuron-metila, ácido tricloroacético (TCA), triclopir, tridifane, trietazina, trifloxissulfuron, trifloxissulfuron-sódio, trifluralina, triflussulfuron, triflussulfuron-metila, trimeturon, trinexapac, trinexapac-ryils, tritossulfuron, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P, vernolato, ZJ-0166, ZJ-0270, ZJ-0543, ZJ-0862, bem como os seguintes compostos





[00198] De particular interesse é o combate seletivo de plantas daninhas em culturas de plantas úteis e ornamentais. Embora os compostos da Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção, já apresentem seletividades boas até suficientes em muitas culturas, em princípio, em algumas culturas e principalmente também no caso de misturas com outros herbicidas, que são menos seletivos, podem ocorrer fitotoxicidades nas plantas cultivadas. Em relação a isso, combinações de compostos da Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção, de particular interesse são aquelas, que contêm os compostos da Fórmula Geral (I) ou suas combinações com outros herbicidas ou pesticidas e protetores. Os protetores, os quais são empregados com um teor antidoticamente eficaz, reduzem os efeitos colaterais fitotóxicos dos herbicidas/pesticidas empregados, por exemplo, em culturas economicamente importantes, tais como cereais (trigo, cevada, centeio, milho, arroz, painço), beterrabas, cana-de-açúcar, colza, algodão e soja, preferentemente cereais. Os seguintes grupos de compostos são incluídos, por exemplo, como protetores para os compostos (I) individuais ou, então, em suas combinações com outros pesticidas:

S1) compostos da Fórmula (S1)

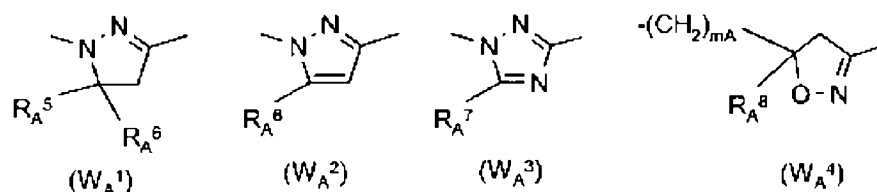


[00199] em que os símbolos e índices apresentam os seguintes significados:

[00200]  $n_A$  é um número natural de 0 a 5, preferentemente 0 a 3;

[00201]  $R_A^1$  é halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi, nitro ou (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquila;

[00202]  $W_A$  é um radical heterocíclico divalente não substituído ou substituído, do grupo dos heterociclos com cinco anéis aromáticos ou parcialmente insaturados com 1 a 3 átomos de heteroanel do grupo N e O, em que pelo menos um átomo de N e, no máximo, um átomo de O estão contidos no anel, preferentemente um radical do grupo ( $W_A^1$ ) até ( $W_A^4$ ),



[00203]  $m_A$  é 0 ou 1;

[00204]  $R_A^2$  é  $OR_A^3$ ,  $SR_A^3$  ou  $NR_A^3R_A^4$  ou heterociclo saturado ou insaturado com 3 a 7 membros com pelo menos um átomo de N e até 3 heteroátomos, preferentemente do grupo O e S, que através do átomo de N está ligado com o grupo carbonila em (S1) e não é substituído ou é substituído por radicais do grupo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi ou fenila eventualmente substituída, preferentemente um radical da Fórmula  $OR_A^3$ ,  $NHR_A^4$  ou  $N(CH_3)_2$ , especialmente da Fórmula  $OR_A^3$ ;

[00205]  $R_A^3$  é hidrogênio ou um radical hidrocarboneto alifático não substituído ou substituído, preferentemente com um total de 1 a 18 átomos de carbono;

[00206]  $R_A^4$  é hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alcóxi ou fenila

não substituída ou substituída;

[00207]  $R_A^5$  é hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquila, ciano ou COOR<sub>A</sub><sup>9</sup>, na qual R<sub>A</sub><sup>9</sup> é hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)hidroxialquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)cicloalquila ou tri-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquil-silila;

[00208]  $R_A^6$ ,  $R_A^7$ ,  $R_A^8$ , iguais ou diferentes, são hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)cicloalquila ou fenila não substituída ou substituída;

[00209] preferentemente:

a) compostos do tipo ácido diclorofenilpirazolin-3-carboxílico (S1<sup>a</sup>), preferivelmente compostos, tais como

[00210] ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-(etoxicarbonil)-5-metil-2-pirazolin-3-carboxílico,

[00211] éster etílico de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-(etoxicarbonil)-5-metil-2-pirazolin-3-carboxílico (S1-1) ("mefenpir-dietila") e compostos relacionados, tais como são descritos na WO 91/07874;

b) derivados do ácido diclorofenilpirazolcarboxílico (S1<sup>b</sup>), preferivelmente compostos, tais como éster etílico de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-metil-pirazol-3-carboxílico (S1-2), éster etílico de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-isopropil-pirazol-3-carboxílico (S1-3), éster etílico de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-(1,1-dimetil-etil)pirazol-3-carboxílico (S1-4) e compostos relacionados, tais como são descritos na EP-A-333.131 e EP-A-269.806;

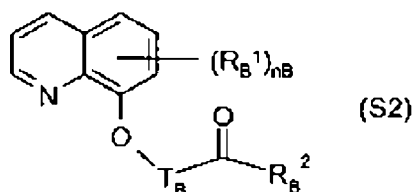
c) derivados do ácido 1,5-difenilpirazol-3-carboxílico (S1<sup>c</sup>), preferivelmente compostos tais como éster etílico de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-fenilpirazol-3-carboxílico (S1-5), éster metílico de ácido 1-(2-clorofenil)-5-fenilpirazol-3-carboxílico (S1-6) e compostos relacionados, tais como são descritos, por exemplo, na EP-A-268554;

d) compostos do tipo ácidos triazolcarboxílicos (S1<sup>d</sup>), preferivelmente compostos, tais como fenclorazol(-éster etílico), isto é, éster

etílico de ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-triclorometil-(1H)-1,2,4-triazol-3-carboxílico (S1-7) e compostos relacionados, tais como são descritos na EP-A-174.562 e EP-A-346.620;

e) compostos do tipo ácido 5-benzil- ou 5-fenil-2-isoxazolin-3-carboxílico ou do ácido 5,5-difenil-2-isoxazolin-3-carboxílico (S1<sup>e</sup>), preferivelmente compostos, tais como éster etílico de ácido 5-(2,4-diclorobenzil)-2-isoxazolin-3-carboxílico (S1-8) ou éster etílico de ácido 5-fenil-2-isoxazolin-3-carboxílico (S1-9) e compostos relacionados, tais como são descritos na WO 91/08202 ou ácido 5,5-difenil-2-isoxazolin-carboxílico (S1-10) ou éster etílico de ácido 5,5-difenil-2-isoxazolin-carboxílico (S1-11) ('isoxadifen-etila") ou éster n-propílico de ácido 5,5-difenil-2-isoxazolin-carboxílico (S1-12) ou do éster etílico de ácido 5-(4-fluorfenil)-5-fenil-2-isoxazolin-3-carboxílico (S1-13), tais como são descritos no pedido de patente WO-A-95/07897.

## S2) Derivados de quinolina da Fórmula (S2)



[00212] em que os símbolos e índices apresentam os seguintes significados:

[00213]  $R_B^1$  é halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi, nitro ou (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquila;

[00214]  $n_B$  é um número natural de 0 a 5, preferivelmente 0 a 3;

[00215]  $R_B^2$  é  $OR_B^3$ ,  $SR_B^3$  ou  $NR_B^3R_B^4$  ou um heterociclo saturado ou insaturado com 3 a 7 membros com pelo menos um átomo de N e até 3 heteroátomos, preferivelmente do grupo O e S, que através do átomo de N está ligado ao grupo carbonila em (S2) e não é substituído ou é substituído por radicais do grupo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi ou fenila eventualmente substituída, preferivelmente um radical da Fórmu-

la  $OR_B^3$ ,  $NHR_B^4$  ou  $N(CH_3)_2$ , especialmente da Fórmula  $OR_B^3$ ;

[00216]  $R_B^3$  é hidrogênio ou um radical hidrocarboneto alifático não substituído ou substituído, preferivelmente com um total de 1 a 18 átomos de carbono;

[00217]  $R_B^4$  é hidrogênio,  $(C_1-C_6)$ alquila,  $(C_1-C_6)$ alcóxi ou fenila não substituída ou substituída;

[00218]  $T_B$  é uma cadeia  $(C_1$  ou  $C_2)$ -alcanodiila, que não é substituída ou é substituída com um ou dois radicais  $(C_1-C_4)$ alquila ou com  $[(C_1-C_3)$ -alcóxi]-carbonila;

[00219] preferivelmente:

a) compostos do tipo do ácido 8-quinolinoxiacético ( $S2^a$ ), preferivelmente éster (1-metil-hexílico) de ácido (5-cloro-8-quinolinóxi)acético ("cloquintocet-mexila" ( $S2-1$ ),

[00220] éster (1,3-dimetil-but-1-ílico) de ácido (5-cloro-8-quinolinóxi)acético ( $S2-2$ ),

[00221] éster 4-alilóxi-butílico de ácido (5-cloro-8-quinolinóxi)acético ( $S2-3$ ),

[00222] éster 1-alilóxi-prop-2-ílico de ácido (5-cloro-8-óxi)quinolinóxi)acético ( $S2-4$ ),

[00223] éster etílico de ácido (5-cloro-8-óxi)quinolinóxi)acético ( $S2-5$ ),

[00224] éster metílico de ácido (5-cloro-8-óxi)quinolinóxi)acético ( $S2-6$ ),

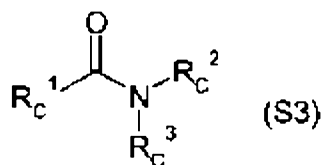
[00225] éster alílico de ácido (5-cloro-8-óxi)quinolinóxi)acético ( $S2-7$ ),

[00226] éster 2-(2-propiliden-iminóxi)-1-etílico de ácido (5-cloro-8-óxi)quinolinóxi)acético ( $S2-8$ ), éster 2-oxo-prop-1-ílico de ácido (5-cloro-8-óxi)quinolinóxi)acético ( $S2-9$ ) e compostos relacionados, tais como são descritos na EP-A-86.750, EP-A-94.349 e EP-A-191.736 ou EP-A-0.492.366, bem como ácido (5-cloro-8-

óxi)quinolinóxi)acético(S2-10), seus hidratos e sais, por exemplo, seus sais de lítio, sódio, potássio, cálcio, magnésio, alumínio, ferro, amônio, amônio quaternário, sulfônio ou fosfônio, tais como são descritos na WO-A-2002/34048;

b) compostos do tipo ácido (5-cloro-8-óxi)quinolinóxi)malônico (S2<sup>b</sup>), preferivelmente compostos, tais como éster dietílico de ácido (5-cloro-8-óxi)quinolinóxi)malônico, éster dialílico de ácido (5-cloro-8-óxi)quinolinóxi)malônico e compostos relacionados, tais como são descritos na EP-A-0.582.198.

### S3) Compostos da Fórmula (S3)



[00227] na qual os símbolos e índices apresentam os seguinte significados:

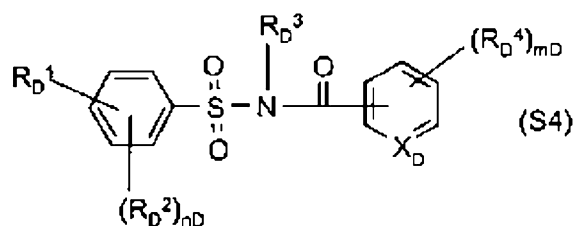
[00228]  $\text{R}_C^1$  é (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquenila, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)cicloalquila, preferivelmente diclorometila;

[00229]  $\text{R}_C^2$ ,  $\text{R}_C^3$ , iguais ou diferentes, são hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquinila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquenila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilcarbamoil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquenilcarbamoil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, dioxolanil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, tiazolila, furila, furilalquila, tienila, piperidila, fenila não substituída ou substituída ou  $\text{R}_C^2$  e  $\text{R}_C^3$  juntos, formam um anel heterocíclico não substituído ou substituído, preferivelmente um anel oxazolidina, tiazolidina, piperidina, morfolina, hexahidropirimidina ou benzoxazina;

[00230] preferivelmente:

[00231] substâncias ativas do tipo dicloracetamidas, que frequentemente são aplicadas como protetores de pré-emergência (protetores eficazes no solo), tais como, por exemplo,

- [00232] "diclormid" (N,N-dialil-2,2-dicloroacetamida) (S3-1),
- [00233] "R-29148" (3-dicloroacetil-2,2,5-trimetil-1,3-oxazolidina) da empresa Stauffer, (S3-2),
- [00234] "R-28725" (3-dicloroacetil-2,2,-dimetil-1,3-oxazolidina) da empresa Stauffer (S3-3),
- [00235] "benoxacor" (4-dicloroacetil-3,4-dihidro-3-metil-2H-1,4-benzoxazina) (S3-4),
- [00236] "PPG-1292" (N-alil-N-[(1,3-dioxolan-2-il)metil]dicloroacetamida) da empresa PPG Industries (S3-5),
- [00237] "DKA-24" (N-alil-N-[(alilaminocarbonil)metil]dicloroacetamida) da empresa Sagro-Chem (S3-6),
- [00238] "AD-67" ou "MON 4660" (3-dicloroacetil-1-oxa-3-aza-spiro[4,5]decano) da empresa Nitrokemia ou Monsanto (S3-7),
- [00239] "TI-35" (1-dicloroacetil-azepano) da empresa TRI-Chemical RT (S3-8),
- [00240] "diclonon" (diciclonon) ou "BAS145138" ou "LAB145138" (S3-9)
- [00241] (3-dicloroacetil-2,5,5-trimetil-1,3-diazabicyclo[4.3.0]nonano) da empresa BASF,
- [00242] "furilazol" ou "MON 13900" ((RS)-3-dicloroacetil-5-(2-furil)-2,2-dimetiloxazolidina) (S3-10); bem como seu isômero (R) (S3-11).
- [00243] S4) N-acilsulfonamidas da Fórmula (S4) e seus sais,



[00244] na qual os símbolos e índices apresentam os seguintes significados:

[00245]  $X_D$  é CH ou N;

- [00246]  $R_D^1$  é  $CO-NR_D^5R_D^6$  ou  $NHCO-R_D^7$ ;
- [00247]  $R_D^2$  é halogênio,  $(C_1-C_4)$ haloalquila,  $(C_1-C_4)$ haloalcóxi, nitro,  $(C_1-C_4)$ alquila,  $(C_1-C_4)$ alcóxi,  $(C_1-C_4)$ alquilsulfonila,  $(C_1-C_4)$ alcoxycarbonila ou  $(C_1-C_4)$ alquilcarbonila;
- [00248]  $R_D^3$  é hidrogênio,  $(C_1-C_4)$ alquila,  $(C_2-C_4)$ alquenila ou  $(C_2-C_4)$ -alquinila;
- [00249]  $R_D^4$  é halogênio, nitro,  $(C_1-C_4)$ alquila,  $(C_1-C_4)$ haloalquila,  $(C_1-C_4)$ haloalcóxi,  $(C_3-C_6)$ cicloalquila, fenila,  $(C_1-C_4)$ alcóxi, ciano,  $(C_1-C_4)$ alquiltio,  $(C_1-C_4)$ alquilsulfinila,  $(C_1-C_4)$ alquilsulfonila,  $(C_1-C_4)$ alcoxycarbonila ou  $(C_1-C_4)$ alquilcarbonila;
- [00250]  $R_D^5$  é hidrogênio,  $(C_1-C_6)$ alquila,  $(C_3-C_6)$ -cicloalquila,  $(C_2-C_6)$ alquenila,  $(C_2-C_6)$ alquinila,  $(C_5-C_6)$ cicloalquenila, fenila ou heterociclila com 3 a 6 membros contendo heteroátomos  $v_D$  do grupo nitrogênio, oxigênio e enxofre, sendo que os sete radicais mencionados por último são substituídos por substituintes  $v_D$  do grupo halogênio,  $(C_1-C_6)$ alcóxi,  $(C_1-C_6)$ haloalcóxi,  $(C_1-C_2)$ alquilsulfinila,  $(C_1-C_2)$ alquilsulfonila,  $(C_3-C_6)$ cicloalquila,  $(C_1-C_4)$ alcoxycarbonila,  $(C_1-C_4)$ alquilcarbonila e fenila e no caso de radicais cíclicos, também por  $(C_1-C_4)$ alquila e  $(C_1-C_4)$ haloalquila;
- [00251]  $R_D^6$  é hidrogênio,  $(C_1-C_6)$ alquila,  $(C_2-C_6)$ alquenila ou  $(C_2-C_6)$ alquinila, sendo que os três radicais mencionados por último são substituídos por radicais  $v_D$  do grupo halogênio, hidróxi,  $(C_1-C_4)$ alquila,  $(C_1-C_4)$ alcóxi e  $(C_1-C_4)$ alquiltio ou
- [00252]  $R_D^5$  e  $R_D^6$  juntos com o átomo de nitrogênio que os porta, formam um radical pirrolidinila ou piperidinila;
- [00253]  $R_D^7$  é hidrogênio,  $(C_1-C_4)$ -alquilamino, di- $(C_1-C_4)$ -alquilamino,  $(C_1-C_6)$ -alquila,  $(C_3-C_6)$ -cicloalquila, sendo que os dois radicais mencionados por último são substituídos por substituintes  $v_D$  do grupo halogênio,  $(C_1-C_4)$ alcóxi,  $(C_1-C_6)$ -haloalcóxi e  $(C_1-C_4)$ alquiltio e no caso de radicais cíclicos, também por  $(C_1-C_4)$ alquila e  $(C_1-$

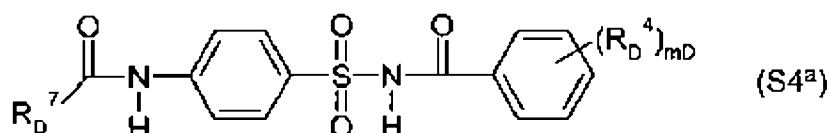
C<sub>4</sub>)haloalquila;

[00254] n<sub>D</sub> é 0, 1 ou 2;

[00255] m<sub>D</sub> é 1 ou 2;

[00256] v<sub>D</sub> é 0, 1, 2 ou 3;

[00257] destes, são preferidos compostos do tipo N-acilsulfonamidas, por exemplo, da seguinte Fórmula (S4<sup>a</sup>), que são conhecidas, por exemplo, da WO-A-97/45016



na qual

[00258] R<sub>D</sub><sup>7</sup> representa (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquila, sendo que os dois radicais mencionados por último são substituídos por substituintes v<sub>D</sub> do grupo halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi e (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquiltio e no caso de radicais cíclicos, também por (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila e (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquila;

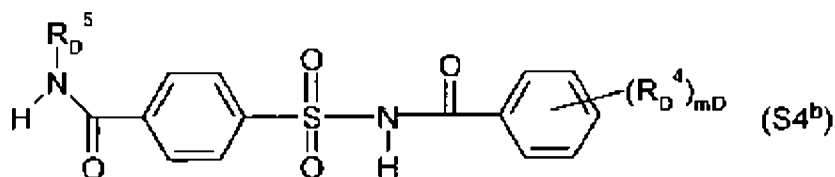
[00259] R<sub>D</sub><sup>4</sup> representa halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi, CF<sub>3</sub>;

[00260] m<sub>D</sub> representa 1 ou 2;

[00261] v<sub>D</sub> é 0, 1, 2 ou 3;

[00262] bem como

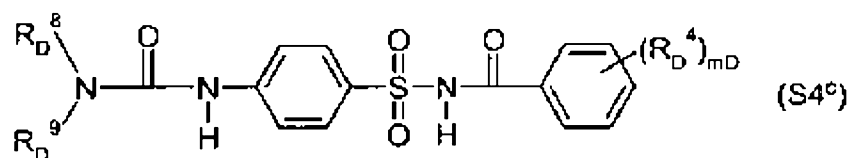
[00263] amidas de ácido acilsulfamoilbenzoico, por exemplo, da seguinte Fórmula (S4<sup>b</sup>), que são conhecidas, por exemplo, da WO-A-99/16744,



[00264] por exemplo, aquelas, nas quais

[00265] R<sub>D</sub><sup>5</sup> é ciclopropila e (R<sub>D</sub><sup>4</sup>) é 2-OMe ("ciprossulfamida", S4-1),

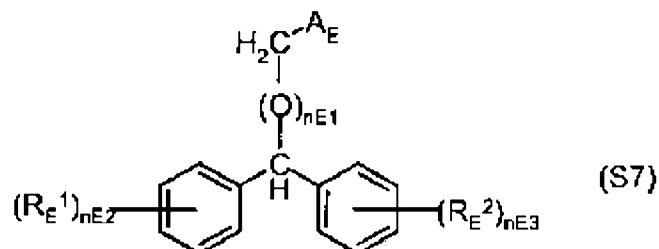
- [00266]  $R_D^5$  é ciclopropila e  $(R_D^4)$  é 5-Cl-2-OMe (S4-2),  
 [00267]  $R_D^5$  é etila e  $(R_D^4)$  é 2-OMe (S4-3),  
 [00268]  $R_D^5$  é isopropila e  $(R_D^4)$  é 5-Cl-2-OMe (S4-4) e  
 [00269]  $R_D^5$  é isopropila e  $(R_D^4)$  é 2-OMe (S4-5);  
 [00270] bem como compostos do tipo das N-acilsulfamoilfenilureias da Fórmula (S4<sup>c</sup>), que são conhecidas, por exemplo, da EP-A-365484,



- [00271] na qual  
 [00272]  $R_D^8$  e  $R_D^9$  independentes uns dos outros, são hidrogênio,  $(C_1-C_8)$ alquila,  $(C_3-C_8)$ cicloalquila,  $(C_3-C_6)$ alquenila,  $(C_3-C_6)$ alquinila,  
 [00273]  $R_D^4$  é halogênio,  $(C_1-C_4)$ alquila,  $(C_1-C_4)$ alcóxi,  $CF_3$ ,  
 [00274]  $m_D$  representa 1 ou 2;  
 [00275] por exemplo,  
 [00276] 1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3-metilureia,  
 [00277] 1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3,3-dimetilureia,  
 [00278] 1-[4-(N-4,5-dimetilbenzoilsulfamoil)fenil]-3-metilureia.  
 [00279] S5) Substâncias ativas da classe dos compostos hidroxiaromáticos e dos derivados de ácido carboxílico aromático-alifáticos (S5), por exemplo,  
 [00280] éster etílico de ácido 3,4,5-triacetoxibenzoico, ácido 3,5-dimetóxi-4-hidroxibenzoico, ácido 3,5-di-hidroxibenzoico, ácido 4-hidroxissalicílico, ácido 4-fluorsalicílico, ácido 2-hidroxicinâmico, ácido 2,4-diclorocinâmico, tais como são descritos na WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001.  
 [00281] S6) Substâncias ativas da classe das 1,2-dihidroquinoxalin-2-onas (S6), por exemplo, 1-metil-3-(2-tienil)-1,2-dihidroquinoxalin-2-ona, 1-metil-3-(2-tienil)-1,2-dihidroquinoxalin-2-tiona,

cloridrato de 1-(2-aminoetil)-3-(2-tienil)-1,2-di-hidroquinoxalin-2-ona, 1-(2-metilsulfonilaminoetil)-3-(2-tienil)-1,2-di-hidro-quinoxalin-2-ona, tais como são descritas na WO-A-2005/112630.

[00282] S7) Compostos da Fórmula (S7), tais como são descritos na WO-A-1998/38856



[00283] na qual os símbolos e índices apresentam os seguintes significados:

[00284]  $R_E^1$ ,  $R_E^2$  são, independentes uns dos outros, halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilamino, di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilamino, nitro;

[00285]  $A_E$  é  $COOR_E^3$  ou  $COSR_E^4$ ,

[00286]  $R_E^3$ ,  $R_E^4$  são, independentes uns dos outros, hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquinila, cianoalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquila, fenila, nitrofenila, benzila, halobenzila, piridinilalquila e alquilamônio,

[00287]  $n_E^1$  é 0 ou 1

[00288]  $n_E^2$ ,  $n_E^3$  são, independentes uns dos outros, 0, 1 ou 2,

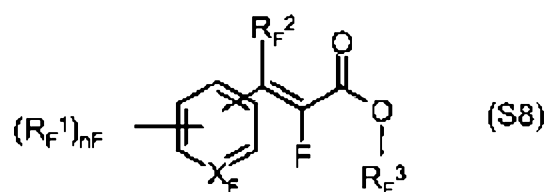
[00289] preferivelmente:

[00290] ácido difenilmetoxiacético,

[00291] éster etílico de ácido difenilmetoxiacético,

[00292] éster metílico de ácido difenilmetoxiacético (registro CAS nº 41858-19-9) (S7-1).

[00293] S8) Compostos da Fórmula (S8), tais como são descritos na WO-A-98/27049



[00294] na qual

[00295]  $X_F$  representa CH ou N,

[00296]  $n_F$ , no caso em que  $X_F$  é N, representa um número inteiro de 0 a 4 e no caso em que  $X_F$  é CH, representa um número inteiro de 0 a 5,

[00297]  $R_F^1$  representa halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcóxi, nitro, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquiltio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilsulfonila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcoxycarbonila, fenila eventualmente substituída, fenóxi eventualmente substituído,

[00298]  $R_F^2$  representa hidrogênio ou (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila,

[00299]  $R_F^3$  representa hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquinila ou arila, sendo que cada um dos radicais contendo carbono mencionado acima, não é substituído ou é substituído por um ou mais, preferivelmente por até três radicais iguais ou diferentes do grupo, que consiste em halogênio e alcóxi ou seus sais,

[00300] preferivelmente compostos, nos quais

[00301]  $X_F$  representa CH,

[00302]  $n_F$  representa um número inteiro de 0 a 2,

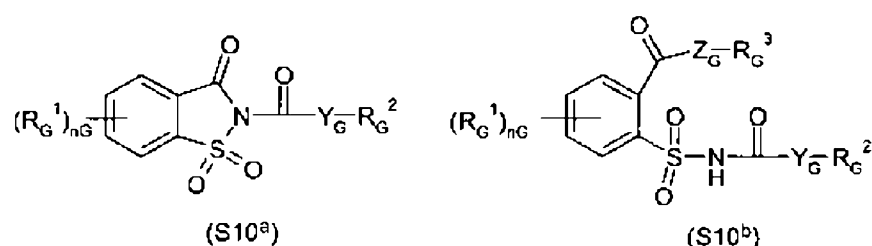
[00303]  $R_F^1$  representa halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalcóxi,

[00304]  $R_F^2$  representa hidrogênio ou (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila,

[00305]  $R_F^3$  representa hidrogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alquila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alquinila ou arila, sendo que cada um dos radicais contendo carbono mencionado acima, não é substituído ou é substituído por um ou mais, preferivelmente por até três radicais iguais ou diferentes do grupo, que consiste em halogênio e alcóxi ou seus sais.

[00306] S9) Substâncias ativas da classe das 3-(5-tetrazolilcarbonil)-2-quinolonas (S9), por exemplo, 1,2-di-hidro-4-hidróxi-1-etil-3-(5-tetrazolilcarbonil)-2-quinolona (registro CAS nº 219479-18-2), 1,2-di-hidro-4-hidróxi-1-metil-3-(5-tetrazolilcarbonil)-2-quinolona (registro CAS nº 95855-00-8), tais como são descritas na WO-A-1999/000020.

[00307] S10) Compostos das fórmulas (S10<sup>a</sup>) ou (S10<sup>b</sup>), tais como são descritos na WO-A-2007/023719 e WO-A-2007/023764



[00308] nas quais

[00309] R<sub>G</sub><sup>1</sup> representa halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila, metóxi, nitro, ciano, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>

[00310] Y<sub>G</sub>, Z<sub>G</sub> independentes uns dos outros, representam O ou S,

[00311] n<sub>G</sub> representa um número inteiro de 0 a 4,

[00312] R<sub>G</sub><sup>2</sup> representa (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)alquila (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)alquenila (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)cicloalquila arila; benzila, halogenobenzila,

[00313] R<sub>G</sub><sup>3</sup> representa hidrogênio ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alquila.

[00314] S11) Substâncias ativas do tipo dos compostos óxi-imino (S11), que são conhecidas como desinfetantes de sementes, tais como, por exemplo,

[00315] "oxabetrinila" ((Z)-1,3-dioxolan-2-ilmetóxi-imino(fenil)acetonitrila (S11-1), que é conhecida como protetor de desinfetante de semente para painço contra danos de metolaclor,

[00316] "fluxofenim" (1-(4-clorofenil)-2,2,2-trifluor-1-etanon-O-(1,3-dioxolan-2-ilmetil)-oxima) (S11-2), que é conhecido como protetor de desinfetante de semente para painço contra danos de metolaclor e

[00317] "ciometrinila" ou "CGA-43089" ((Z)-cianometóxi-imino(fenil)acetonitrila) (S11-3), que é conhecida como protetor de desinfetante de semente para painço contra danos de metolaclor.

[00318] S12) Substâncias ativas da classe das isotiocromanonas (S12), tais como, por exemplo, metil-[(3-oxo-1H-2-benzotiopiran-4(3H)-iliden)metóxi]acetatos (registro CAS nº 205121-04-6) (S12-1) e compostos relacionados da WO-A-1998/13361.

[00319] S13) Um ou mais compostos do grupo (S13):

[00320] "anidrido naftálico" (anidrido de ácido 1,8-naftalenodicarboxílico (S13-1), que é conhecido como protetor de desinfetante de semente para milho contra danos de herbicidas de tio-carbamato,

[00321] "fenclorim" (4,6-dicloro-2-fenilpirimidina ) (S13-2), que é conhecido como protetor para pretilaclor em arroz semeado,

[00322] "flurazol" (benzil-2-cloro-4-trifluormetil-1,3-tiazol-5-carboxilato) (S13-3), que é conhecido como protetor de desinfetante de semente para painço contra danos do alaclor e metolaclor,

[00323] "CL 304415" (registro CAS nº 31541-57-8) (ácido 4-carbóxi-3,4-di-hidro-2H-1-benzopiran-4-acético) (S13-4) da empresa American Cyanamid, que é conhecido como protetor para milho contra danos de imidazolinonas,

[00324] "MG 191" (registro CAS nº 96420-72-3) (2-diclorometil-2-metil-1,3-dioxolano) (S13-5) da empresa Nitrokemia, que é conhecida como protetor para milho,

[00325] "MG-838" (registro CAS nº 133993-74-5) (2-propenil-1-oxa-4-azaspiro[4,5]decan-4-carboditioato (S13-6) da empresa Nitrokemia,

[00326] "disulfoton" (O,O-dietil S-2-etiltioetil fosforoditioato) (S13-7),

[00327] "dietolato" (O,O-dietil-O-fenilfosforotioato) (S13-8),

- [00328] "mefenato" (4-clorofenil-metilcarbamato) (S13-9).
- [00329] S14) Substâncias ativas, que além de um efeito herbicida contra plantas daninhas, também apresentam um efeito protetor em plantas cultivadas, tal como arroz, tais como, por exemplo,
- [00330] "dimepiperato" ou "MY-93" (S-1-metil-1-feniletil-piperidin-1-carbotioato), que é conhecido como protetor para arroz contra danos do herbicida molinato,
- [00331] "daimuron" ou "SK 23" (1-(1-metil-1-feniletil)-3-p-tolil-ureia), que é conhecido como protetor para arroz contra danos do herbicida imazossulfuron,
- [00332] "cumiluron" = "JC-940" (3-(2-clorofenilmetil)-1-(1-metil-1-feniletil)-ureia, vide JP-A-60087254), que é conhecido como protetor para arroz contra danos de alguns herbicidas,
- [00333] "metoxifenona" ou "NK 049" (3,3'-dimetil-4-metóxi-benzofenona), que é conhecida como protetor para arroz contra danos de alguns herbicidas,
- [00334] "CSB" (1-bromo-4-(clorometilsulfonil)benzeno da Kumai (registro CAS nº 54091-06-4), que é conhecido como protetor contra danos de alguns herbicidas no arroz.
- [00335] S15) Substâncias ativas, que são prioritariamente empregadas como herbicidas, contudo, também apresentam efeito protetor em plantas cultivadas, por exemplo,
- [00336] ácido (2,4-diclorofenóxi)acético (2,4-D),
- [00337] ácido (4-clorofenóxi)acético,
- [00338] ácido (R,S)-2-(4-cloro-o-tolilóxi)propiónico (mecoprop),
- [00339] ácido 4-(2,4-diclorofenóxi)butírico (2,4-DB),
- [00340] ácido (4-cloro-o-tolilóxi)acético (MCPA),
- [00341] ácido 4-(4-cloro-o-tolilóxi)butírico,
- [00342] ácido 4-(4-clorofenóxi)butírico,
- [00343] ácido 3,6-dicloro-2-metoxibenzoico (dicamba),

[00344] 1-(etoxicarbonil)etil-3,6-dicloro-2-metoxibenzoato (lactidiclor-etila).

[00345] Alguns dos protetores já são conhecidos como herbicidas e dessa maneira, além do efeito herbicida nas plantas daninhas, desenvolvem ao mesmo tempo, também, um efeito protetor nas plantas cultivadas.

[00346] As proporções de peso da (mistura) herbicida para protetor depende geralmente da quantidade de aplicação do herbicida e da eficácia do respectivo protetor e pode variar dentro de amplos limites, por exemplo, na faixa de 200:1 até 1:200, preferivelmente 100:1 até 1:100, especialmente 20:1 até 1:20. Os protetores podem ser formulados de maneira análoga aos compostos da Fórmula (I) ou suas misturas com outros herbicidas/pesticidas e preparados e aplicados como formulação pronta ou mistura de tanque com os herbicidas.

[00347] Para a aplicação, as formulações presentes em forma comercial são eventualmente diluídas de maneira habitual, por exemplo, no caso dos pós de pulverização, concentrados emulsificáveis, dispersões e granulados dispersíveis em água, por meio de água. Preparações em forma de pó, granulados para o solo ou para espalhar, bem como soluções aspersíveis, normalmente não são mais diluídos com outras substâncias inertes antes da aplicação.

[00348] Com as condições externas, tais como temperatura, umidade, a natureza do herbicida usado e outros, a quantidade de aplicação necessária dos compostos da Fórmula (I) varia. Ela pode oscilar dentro de amplos limites, por exemplo, entre 0,001 e 10,0 kg/ha ou mais de substância ativa, preferivelmente, contudo, ela se encontra entre 0,005 e 5 kg/ha.

[00349] A presente invenção é detalhadamente ilustrada com base nos seguintes exemplos, os quais, contudo, não limitam de modo algum a invenção.

[00350] Exemplos de síntese

[00351] A seguir, descrevem-se alguns exemplos de síntese de compostos da Fórmula Geral (I) ou seus sais.

[00352] 2-([5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfanil)-1,3-oxazol (exemplo 49)

[00353] 1,3-oxazol-2(3H)-tiona (2,960 g, 29 mmols; preparada tal como descrito na WO 2003/006442 A) é previamente introduzida em 50 mL de acetonitrila. Sob resfriamento em banho de gelo, acrescenta-se 1,8-diazabicyclo(5.4.0)undec-7-eno (DBU, 4,81 ml, 32 mmols) por gotejamento. Agita-se a 25°C por 30 minutos. Uma solução de 4-(bromometil)-5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol (9,045 g, 29 mmols) dissolvida em acetonitrila é acrescentada por gotejamento. Agita-se a 25°C por mais 4 horas e deixa em repouso durante a noite. Para o processamento, a mistura de reação é colocada em água e extraída duas vezes com diclorometano, em seguida, é lavada com água e finalmente com solução saturada de NaCl. As fases orgânicas combinadas são secadas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas. O produto bruto é cromatograficamente purificado (heptano: acetato de etila, gradiente 10:0 até 7:3). Obtêm-se 7,6 g de produto (74,9% da teoria).

[00354] RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,82 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,32 (s, 2H, SCH<sub>2</sub>); 6,75 (t, 1H, OCHF<sub>2</sub>); 7,11 (br s, 1H); 7,68 (br s, 1H).

[00355] 2-([5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfinil)-1,3-oxazol (exemplo 50)

[00356] 2-([5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfanil)-1,3-oxazol (2,00 g, 6 mmols) é previamente introduzido em 333 mL de diclorometano sob uma atmosfera de argônio. Em seguida, sob agitação e resfriamento com gelo, acrescenta-se ácido 3-cloro-perbenzoico (1,362 g, 6 mmols, a 77%) em porções e agita-se a 0°C por mais 6 horas. Para o processamento, a mistura de reação é

lavada duas vezes com solução de hidróxido de sódio a 2 molar, em seguida, com água e, finalmente, com solução saturada de NaCl. As fases orgânicas combinadas são secadas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas. O produto bruto é cromatograficamente purificado (heptano : acetato de etila, gradiente 10:0 até 6:4). Obtém-se 1,98 g de produto (89,7% da teoria).

[00357] RMN ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz): 3,86 (s, 3H,  $\text{CH}_3$ ); 4,36 (d, 1H,  $\text{S(O)CH}_2$ ); 4,49 (d, 1H,  $\text{S(O)CH}_2$ ); 6,97 (dd, 1H,  $\text{OCHF}_2$ ); 7,39 (br s, 1H); 7,93 (br s, 1H).

[00358] 2-[(S)-{[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil]-1,3-oxazol (exemplo 2285) e 2-[(R)-{[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil]-1,3-oxazol (exemplo 3041)

[00359] O 2-[(S)-{[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil]-1,3-oxazol (0,5 g, a 99%) racêmico obtido é separado nos enantiômeros através de HPLC quiral preparatória (coluna: Chiralpak<sup>®</sup> IC; eluente: n-heptano/2-propanol 80:20; fluxo: 90 ml/min; temperatura da coluna: 25°C). Dessa maneira, obtém-se 0,2 g (40% da teoria) de 2-[(S)-{[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil]-1,3-oxazol ( $T_r = 8,129$  min,  $[\alpha]_D^{25} = 126,1^\circ$ ) e 0,2 g (40% da teoria) de 2-[(R)-{[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil]-1,3-oxazol ( $T_r = 10,286$  min,  $[\alpha]_D^{25} = 123,3^\circ$ ).

[00360] A configuração absoluta de 2-[(S)-{[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil]-1,3-oxazol foi confirmada por meio da análise estrutural de raios X.

[00361] Tempos de retenção ( $T_r$  em minutos) e relações enantioméricas (ee) de compostos quirais foram determinados por meio de HPLC quiral analítica [Chiralpak<sup>®</sup> coluna IC (250 x 4,6 mm, tamanho do grão 10  $\mu\text{m}$ ), temperatura 25°C, fluxo 1 ml/min, n-heptano / 2-propanol 80:20 v/v].

[00362] Racematos ou misturas enantioméricas foram separados por meio de HPLC quiral preparatória nos respectivos enantiômeros [Chiralpak® coluna IC (250 x 50 mm, tamanho do grão 20 µm), temperatura 25°C, fluxo 90 ml/min, n-heptano / 2-propanol 80:20 v/v].

[00363] 2-({[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfanil)-1,3-oxazol (exemplo 51)

[00364] 2-({[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfanil)-1,3-oxazol (0,30 g, 1 mmol) é previamente introduzido em 50 mL de diclorometano sob uma atmosfera de argônio. Em seguida, sob agitação e resfriamento com gelo, acrescenta-se ácido 3-cloro-perbenzoico (0,449 g, 2 mmols, a 77%) em porções e agita-se a 25°C por mais 3 horas e deixa-se em repouso durante a noite. São acrescentados mais 100 mg de ácido 3-cloro-perbenzoico e agitados a 25°C por mais 4 horas. Para o processamento, a mistura de reação é lavada duas vezes com solução de hidróxido de sódio 2 molar, em seguida, com água e finalmente, com solução saturada de NaCl. As fases orgânicas combinadas são secadas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas. O produto bruto é purificado por meio de HPLC preparatória (fase reversa). Obtém-se 0,097 g de produto (28% da teoria).

[00365] RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,87 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,59 (s, 2H, S(O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>); 6,84 (t, 1H, OCHF<sub>2</sub>); 7,4 (br s, 1H); 7,89 (br s, 1H).

[00366] 5-bromo-2-({[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfanil)-1,3-oxazol (exemplo 787)

[00367] Preparação de 2-({[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfanil)-1,3-oxazol [de acordo com Can. J. Chem. volume 50, 3082-3083 (1972)]

[00368] Ácido di-hidroxifumárico (5,00 g, 34 mmols) é colocado em porções, sob uma atmosfera de argônio, em água aquecida a 60°C (20 ml) (desprendimento de gás). Agita-se por tanto tempo a 60°C, até que

não se realize mais qualquer desprendimento de gás. (cerca de 1 hora; solução 1). O rodaneto de potássio (3,282 g, 34 mmols) é previamente introduzido em etanol (25 ml). A 0°C acrescenta-se ácido clorídrico concentrado (4 ml, 4,76 g, 48 mmol) por gotejamento e agita-se a 25°C por uma hora. O cloreto de potássio precipitado formado é aspirado e o filtrado é lentamente gotejado à solução 1 à temperatura ambiente e, em seguida, continua-se a agitar ao refluxo por 12 horas. A solução de reação é concentrada e o resíduo aquoso é acrescentado à acetonitrila (50 ml). Inicialmente, acrescenta-se o carbonato de potássio (7,00 g, 51 mmols) e em seguida, 4-(bromometil)-5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol (5,218 g, 17 mmols) e agita-se a 60°C por mais 7 horas. Para o processamento, a mistura de reação é colocada em água e extraída duas vezes com acetato de etila, em seguida, é lavada com água e finalmente, com solução saturada de NaCl. As fases orgânicas combinadas são secadas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas. O produto bruto é cromatograficamente purificado (heptano : acetato de etila, gradiente 10:0 até 7:3). Obtêm-se 3,09 g de produto (26,4% da teoria).

[00369] Preparação de 5-bromo-2-([5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfanil]-1,3-oxazol

[00370] 2-([5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfanil]-1,3-oxazol (1,24 g, 4 mmols) é previamente introduzido em 20 mL de dimetilformamida. Em seguida, acrescenta-se N-bromossuccinimida em porções sob agitação (0,892 g, 5 mmols). Agita-se a 40°C por mais 6 horas. Para o processamento, a mistura de reação é colocada em água, extraída duas vezes com diclorometano, em seguida, é lavada com água e finalmente, com solução saturada de NaCl. As fases orgânicas combinadas são secadas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas. O produto bruto é

cromatograficamente purificado (heptano : acetato de etila, gradiente 10:0 até 7:3). Obtém-se 0,70 g de produto (43,2% da teoria).

[00371] RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,81 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,28 (s, 2H, SCH<sub>2</sub>); 6,71 (t, 1H, OCHF<sub>2</sub>); 6,98 (s, 1H).

[00372] 5-cloro-2-([5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfanil]-1,3-oxazol (exemplo 541)

[00373] 2-([5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfanil]-1,3-oxazol (1,02 g, 3 mmols) é previamente introduzido em 15 mL de dimetilformamida. Em seguida, sob agitação, acrescenta-se N-clorossuccinimida (0,550 g, 4 mmols) em porções. Agita-se a 40°C por mais 4 horas. Para o processamento, a mistura de reação é colocada em água, extraída duas vezes com diclorometano, em seguida, lavada com água e finalmente, com solução saturada de NaCl. As fases orgânicas combinadas são secadas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas. O produto bruto é cromatograficamente purificado (heptano : acetato de etila, gradiente 10:0 até 7:3). Obtém-se 0,45 g de produto (35,9% da teoria).

[00374] RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,80 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,28 (s, 2H, SCH<sub>2</sub>); 6,69 (t, 1H, OCHF<sub>2</sub>); 6,88 (s, 1H).

[00375] 5-iodo-2-([5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfanil]-1,3-oxazol (exemplo 1033)

[00376] 2-([5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfanil]-1,3-oxazol (0,700 g, 2 mmols) é previamente introduzido em 10 mL de dimetilformamida. Em seguida, sob agitação acrescenta-se N-iodossuccinimida (0,750 g, 3,3 mmols) em porções. Agita-se a 40°C por mais 16 horas. Para o processamento, a mistura de reação é colocada em água e extraída duas vezes com diclorometano, em seguida, lavada com água e finalmente, com solução saturada de NaCl. As fases orgânicas combinadas são secadas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas. O

produto bruto é cromatograficamente purificado (heptano : acetato de etila, gradiente 10:0 até 8:2). Obtém-se 0,25 g de produto (24,5% da teoria).

[00377] RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,80 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,29 (s, 2H, SCH<sub>2</sub>); 6,70 (t, 1H, OCHF<sub>2</sub>); 7,11 (s, 1H).

[00378] 2-([5-(cloro)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfanil]-1,3-oxazol (exemplo 34)

[00379] Preparação de 2-(metilsulfonil)-1,3-oxazol

[00380] 1,3-oxazol-2(3H)-tione (1,00 g, 10 mmols; preparada tal como descrito na WO 2003/006442 A) é previamente introduzida em 20 mL de acetonitrila, sob atmosfera de gás protetor. O iodometano (1,544 g, 0,677 ml, 11 mmols) é acrescentado por gotejamento, em seguida, adicionado o carbonato de potássio (1,503 ml, 11 mmols). Agita-se a 25°C por 6 horas. Para o processamento, a mistura de reação é colocada em água e extraída duas vezes com diclorometano (100 ml) e em seguida, lavada com água e finalmente com solução saturada de NaCl. As fases orgânicas combinadas são secadas sobre sulfato de magnésio, filtradas e diretamente ulteriormente reagidas. A essa solução em diclorometano, acrescenta-se em seguida, sob agitação e resfriamento em gelo, ácido 3-cloro-perbenzoico (5,100 g, 23 mmols, a 77%) em porções, agita-se a 25°C por mais 6 horas e deixa-se em repouso durante a noite. Para o processamento, a mistura de reação é extraída duas vezes com solução de hidróxido de sódio a 2 molar, em seguida, lavada com água e finalmente, com solução saturada de NaCl. As fases orgânicas combinadas são secadas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas. Obtém-se 0,820 g de produto (50,7% da teoria).

[00381] RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,35 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 7,38 (br s, 1H); 7,88 (br s, 1H).

[00382] Solução de 2([5-(cloro)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-

4-il]metil}sulfanil)-1,3-oxazol

[00383] A uma mistura vigorosamente agitada constituída de 50 mL de tolueno e soda cáustica aquosa a 50% (21 g), acrescenta-se imidotiocarbamato bromidrato de [5-cloro-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metila (1,934 g, 5 mmols) e agita-se vigorosamente por mais 1,5 hora. Em seguida, acrescentam-se brometo de tetra-n-butilamônio (0,494 g, 2 mmols) e 2-(metilsulfonil)-1,3-oxazol (0,805 g, 5 mmols) e agita-se fortemente a 25°C por mais 6 horas. Para o processamento, a solução de reação é colocada em água e extraída com tolueno. As fases orgânicas combinadas são secadas e concentradas. Obtém-se 1,290 g de produto (75,2% da teoria).

[00384] RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,89 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,33 (s, 2H, SCH<sub>2</sub>); 7,12 (br s, 1H); 7,68 (br s, 1H).

[00385] Os compostos descritos nas seguintes tabelas 1 – 3 são obtidos de acordo com ou de maneira análoga aos exemplos de síntese descritos acima.

[00386] Nas tabelas significam:

Me = metila

Et = etila

Ph = fenila

Pr = n-propila

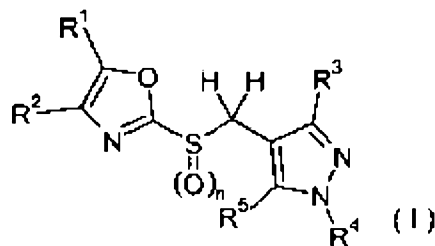
cPr = ciclopropila

iPr = isopropila

tBu = terc-butila

cPen = ciclopentila

Tabela 1: Compostos da Fórmula (I)



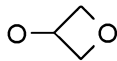
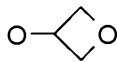
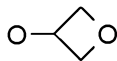
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|------------------|------------------|-----------------|--------|
| 1.     | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | Ph               | Cl              | 0      |
| 2.     | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | Ph               | Cl              | 1      |
| 3.     | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | Ph               | Cl              | 2      |
| 4.     | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl              | 0      |
| 5.     | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl              | 1      |
| 6.     | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl              | 2      |
| 7.     | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl              | 0      |
| 8.     | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl              | 1      |
| 9.     | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl              | 2      |
| 10.    | H              | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 11.    | H              | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 12.    | H              | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 13.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 0      |
| 14.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 1      |
| 15.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 2      |
| 16.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 0      |
| 17.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 1      |
| 18.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 2      |
| 19.    | H              | H              | Cl               | Et               | Cl              | 0      |
| 20.    | H              | H              | Cl               | Et               | Cl              | 1      |
| 21.    | H              | H              | Cl               | Et               | Cl              | 2      |
| 22.    | H              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 0      |
| 23.    | H              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 1      |
| 24.    | H              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 2      |
| 25.    | H              | H              | Me               | Me               | Me              | 0      |
| 26.    | H              | H              | Me               | Me               | Me              | 1      |
| 27.    | H              | H              | Me               | Me               | Me              | 2      |
| 28.    | H              | H              | Me               | Me               | Cl              | 0      |
| 29.    | H              | H              | Me               | Me               | Cl              | 1      |
| 30.    | H              | H              | Me               | Me               | Cl              | 2      |
| 31.    | H              | H              | Cl               | Me               | Cl              | 0      |
| 32.    | H              | H              | Cl               | Me               | Cl              | 1      |
| 33.    | H              | H              | Cl               | Me               | Cl              | 2      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|----------------|-----------------------------------|--------|
| 34.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 0      |
| 35.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 1      |
| 36.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 2      |
| 37.    | H              | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 38.    | H              | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 39.    | H              | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 40.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 0      |
| 41.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 1      |
| 42.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 2      |
| 43.    | H              | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 44.    | H              | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 45.    | H              | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 46.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 0      |
| 47.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 1      |
| 48.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 2      |
| 49.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 50.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 51.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 52.    | H              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 53.    | H              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 54.    | H              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 55.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 56.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 57.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 58.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 59.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 60.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 61.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 0      |
| 62.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 1      |
| 63.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 2      |
| 64.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 0      |
| 65.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 1      |
| 66.    | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 2      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|-----------------|--------|
| 67.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SEt             | 0      |
| 68.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SEt             | 1      |
| 69.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SEt             | 2      |
| 70.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Me              | 0      |
| 71.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Me              | 1      |
| 72.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Me              | 2      |
| 73.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Et              | 0      |
| 74.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Et              | 1      |
| 75.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Et              | 2      |
| 76.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Et             | Cl              | 0      |
| 77.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Et             | Cl              | 1      |
| 78.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Et             | Cl              | 2      |
| 79.    | H              | H              | Cl              | Et             | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 80.    | H              | H              | Cl              | Et             | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 81.    | H              | H              | Cl              | Et             | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 82.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr            | Cl              | 0      |
| 83.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr            | Cl              | 1      |
| 84.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr            | Cl              | 2      |
| 85.    | H              | H              | Cl              | iPr            | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 86.    | H              | H              | Cl              | iPr            | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 87.    | H              | H              | Cl              | iPr            | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 88.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu            | Cl              | 0      |
| 89.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu            | Cl              | 1      |
| 90.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu            | Cl              | 2      |
| 91.    | H              | H              | Cl              | tBu            | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 92.    | H              | H              | Cl              | tBu            | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 93.    | H              | H              | Cl              | tBu            | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 94.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen           | Cl              | 0      |
| 95.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen           | Cl              | 1      |
| 96.    | H              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen           | Cl              | 2      |
| 97.    | H              | H              | Cl              | cPen           | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 98.    | H              | H              | Cl              | cPen           | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 99.    | H              | H              | Cl              | cPen           | CF <sub>3</sub> | 2      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-----------------|--------|
| 100.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 0      |
| 101.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 1      |
| 102.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 2      |
| 103.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 104.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 105.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 106.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 0      |
| 107.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 1      |
| 108.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 2      |
| 109.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 110.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 111.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 112.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 0      |
| 113.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 1      |
| 114.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 2      |
| 115.   | H              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 116.   | H              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 117.   | H              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 118.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 0      |
| 119.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 1      |
| 120.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 2      |
| 121.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 122.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 123.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 124.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 0      |
| 125.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 1      |
| 126.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 2      |
| 127.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 128.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 129.   | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 130.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl              | 0      |
| 131.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl              | 1      |
| 132.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl              | 2      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|-----------------|--------|
| 133.   | H              | H              | Me              | Ph             | Me              | 0      |
| 134.   | H              | H              | Me              | Ph             | Me              | 1      |
| 135.   | H              | H              | Me              | Ph             | Me              | 2      |
| 136.   | H              | H              | Me              | Ph             | Cl              | 0      |
| 137.   | H              | H              | Me              | Ph             | Cl              | 1      |
| 138.   | H              | H              | Me              | Ph             | Cl              | 2      |
| 139.   | H              | H              | Et              | Ph             | Cl              | 0      |
| 140.   | H              | H              | Et              | Ph             | Cl              | 1      |
| 141.   | H              | H              | Et              | Ph             | Cl              | 2      |
| 142.   | H              | H              | Pr              | Ph             | Cl              | 0      |
| 143.   | H              | H              | Pr              | Ph             | Cl              | 1      |
| 144.   | H              | H              | Pr              | Ph             | Cl              | 2      |
| 145.   | H              | H              | iPr             | Ph             | Cl              | 0      |
| 146.   | H              | H              | iPr             | Ph             | Cl              | 1      |
| 147.   | H              | H              | iPr             | Ph             | Cl              | 2      |
| 148.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl              | 0      |
| 149.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl              | 1      |
| 150.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl              | 2      |
| 151.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me              | 0      |
| 152.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me              | 1      |
| 153.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me              | 2      |
| 154.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 155.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 156.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 157.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F               | 0      |
| 158.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F               | 1      |
| 159.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F               | 2      |
| 160.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe             | 0      |
| 161.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe             | 1      |
| 162.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe             | 2      |
| 163.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt             | 0      |
| 164.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt             | 1      |
| 165.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt             | 2      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                        | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 166.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 0      |
| 167.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 1      |
| 168.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 2      |
| 169.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 0      |
| 170.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 1      |
| 171.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 2      |
| 172.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 0      |
| 173.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 1      |
| 174.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 2      |
| 175.   | H              | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 0      |
| 176.   | H              | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 1      |
| 177.   | H              | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 2      |
| 178.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |   | 0      |
| 179.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 1      |
| 180.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 2      |
| 181.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                     | 0      |
| 182.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                     | 1      |
| 183.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                     | 2      |
| 184.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 0      |
| 185.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 1      |
| 186.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 2      |
| 187.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                   | 0      |
| 188.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                   | 1      |
| 189.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                   | 2      |
| 190.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    | 0      |
| 191.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    | 1      |
| 192.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    | 2      |
| 193.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   | 0      |
| 194.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   | 1      |
| 195.   | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   | 2      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|---------------------------------------------------|--------|
| 196.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 197.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 198.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 199.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>               | 0      |
| 200.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>               | 1      |
| 201.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>               | 2      |
| 202.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                            | 0      |
| 203.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                            | 1      |
| 204.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                            | 2      |
| 205.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                          | 0      |
| 206.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                          | 1      |
| 207.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                          | 2      |
| 208.   | H              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 0      |
| 209.   | H              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 1      |
| 210.   | H              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 2      |
| 211.   | H              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 0      |
| 212.   | H              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 1      |
| 213.   | H              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 2      |
| 214.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 0      |
| 215.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 1      |
| 216.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 2      |
| 217.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 0      |
| 218.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 1      |
| 219.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 2      |
| 220.   | H              | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 0      |
| 221.   | H              | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 1      |
| 222.   | H              | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 2      |
| 223.   | H              | H              | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 0      |
| 224.   | H              | H              | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 1      |
| 225.   | H              | H              | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 2      |
| 226.   | H              | H              | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 0      |
| 227.   | H              | H              | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 1      |
| 228.   | H              | H              | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 2      |

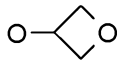
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                  | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                   | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|---------------------------------|------------------|----------------------------------|--------|
| 229.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 230.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 231.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 232.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 233.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 234.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 235.   | H              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 236.   | H              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 237.   | H              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 238.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 239.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 240.   | H              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 241.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 0      |
| 242.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 1      |
| 243.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 2      |
| 244.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 245.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 246.   | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 247.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                               | 0      |
| 248.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                               | 1      |
| 249.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                               | 2      |
| 250.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                               | 0      |
| 251.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                               | 1      |
| 252.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                               | 2      |
| 253.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 0      |
| 254.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 1      |
| 255.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 2      |
| 256.   | F              | H              | Cl                              | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 257.   | F              | H              | Cl                              | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 258.   | F              | H              | Cl                              | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 259.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OMe                              | 0      |
| 260.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OMe                              | 1      |
| 261.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OMe                              | 2      |

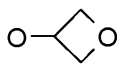
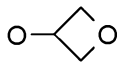
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|------------------|----------------|-----------------|--------|
| 262.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | CN              | 0      |
| 263.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | CN              | 1      |
| 264.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | CN              | 2      |
| 265.   | F              | H              | Cl               | Et             | Cl              | 0      |
| 266.   | F              | H              | Cl               | Et             | Cl              | 1      |
| 267.   | F              | H              | Cl               | Et             | Cl              | 2      |
| 268.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me             | Cl              | 0      |
| 269.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me             | Cl              | 1      |
| 270.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me             | Cl              | 2      |
| 271.   | F              | H              | Me               | Me             | Me              | 0      |
| 272.   | F              | H              | Me               | Me             | Me              | 1      |
| 273.   | F              | H              | Me               | Me             | Me              | 2      |
| 274.   | F              | H              | Me               | Me             | Cl              | 0      |
| 275.   | F              | H              | Me               | Me             | Cl              | 1      |
| 276.   | F              | H              | Me               | Me             | Cl              | 2      |
| 277.   | F              | H              | Cl               | Me             | Cl              | 0      |
| 278.   | F              | H              | Cl               | Me             | Cl              | 1      |
| 279.   | F              | H              | Cl               | Me             | Cl              | 2      |
| 280.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | Cl              | 0      |
| 281.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | Cl              | 1      |
| 282.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | Cl              | 2      |
| 283.   | F              | H              | Cl               | Me             | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 284.   | F              | H              | Cl               | Me             | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 285.   | F              | H              | Cl               | Me             | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 286.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | F               | 0      |
| 287.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | F               | 1      |
| 288.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | F               | 2      |
| 289.   | F              | H              | OMe              | Me             | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 290.   | F              | H              | OMe              | Me             | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 291.   | F              | H              | OMe              | Me             | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 292.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | OEt             | 0      |
| 293.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | OEt             | 1      |
| 294.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me             | OEt             | 2      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|----------------|-----------------------------------|--------|
| 295.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 296.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 297.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 298.   | F              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 299.   | F              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 300.   | F              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 301.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 302.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 303.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 304.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 305.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 306.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 307.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 0      |
| 308.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 1      |
| 309.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 2      |
| 310.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 0      |
| 311.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 1      |
| 312.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 2      |
| 313.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 0      |
| 314.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 1      |
| 315.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 2      |
| 316.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Me                                | 0      |
| 317.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Me                                | 1      |
| 318.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Me                                | 2      |
| 319.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Et                                | 0      |
| 320.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Et                                | 1      |
| 321.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Et                                | 2      |
| 322.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 0      |
| 323.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 1      |
| 324.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 2      |
| 325.   | F              | H              | Cl                | Et             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 326.   | F              | H              | Cl                | Et             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 327.   | F              | H              | Cl                | Et             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-----------------|--------|
| 328.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl              | 0      |
| 329.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl              | 1      |
| 330.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl              | 2      |
| 331.   | F              | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 332.   | F              | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 333.   | F              | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 334.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl              | 0      |
| 335.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl              | 1      |
| 336.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl              | 2      |
| 337.   | F              | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 338.   | F              | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 339.   | F              | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 340.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 0      |
| 341.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 1      |
| 342.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 2      |
| 343.   | F              | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 344.   | F              | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 345.   | F              | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 346.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 0      |
| 347.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 1      |
| 348.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 2      |
| 349.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 350.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 351.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 352.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 0      |
| 353.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 1      |
| 354.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 2      |
| 355.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 356.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 357.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 358.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 0      |
| 359.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 1      |
| 360.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 2      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------|-----------------|--------|
| 361.   | F              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 362.   | F              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 363.   | F              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 364.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl              | 0      |
| 365.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl              | 1      |
| 366.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl              | 2      |
| 367.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 368.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 369.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 370.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe             | Cl              | 0      |
| 371.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe             | Cl              | 1      |
| 372.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe             | Cl              | 2      |
| 373.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe             | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 374.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe             | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 375.   | F              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe             | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 376.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN              | Cl              | 0      |
| 377.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN              | Cl              | 1      |
| 378.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN              | Cl              | 2      |
| 379.   | F              | H              | Me              | Ph                              | Me              | 0      |
| 380.   | F              | H              | Me              | Ph                              | Me              | 1      |
| 381.   | F              | H              | Me              | Ph                              | Me              | 2      |
| 382.   | F              | H              | Me              | Ph                              | Cl              | 0      |
| 383.   | F              | H              | Me              | Ph                              | Cl              | 1      |
| 384.   | F              | H              | Me              | Ph                              | Cl              | 2      |
| 385.   | F              | H              | Et              | Ph                              | Cl              | 0      |
| 386.   | F              | H              | Et              | Ph                              | Cl              | 1      |
| 387.   | F              | H              | Et              | Ph                              | Cl              | 2      |
| 388.   | F              | H              | Pr              | Ph                              | Cl              | 0      |
| 389.   | F              | H              | Pr              | Ph                              | Cl              | 1      |
| 390.   | F              | H              | Pr              | Ph                              | Cl              | 2      |
| 391.   | F              | H              | iPr             | Ph                              | Cl              | 0      |
| 392.   | F              | H              | iPr             | Ph                              | Cl              | 1      |
| 393.   | F              | H              | iPr             | Ph                              | Cl              | 2      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                        | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 394.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                                                                                    | 0      |
| 395.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                                                                                    | 1      |
| 396.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                                                                                    | 2      |
| 397.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me                                                                                    | 0      |
| 398.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me                                                                                    | 1      |
| 399.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me                                                                                    | 2      |
| 400.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub>                                                                       | 0      |
| 401.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub>                                                                       | 1      |
| 402.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub>                                                                       | 2      |
| 403.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F                                                                                     | 0      |
| 404.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F                                                                                     | 1      |
| 405.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F                                                                                     | 2      |
| 406.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe                                                                                   | 0      |
| 407.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe                                                                                   | 1      |
| 408.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe                                                                                   | 2      |
| 409.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                                                                                   | 0      |
| 410.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                                                                                   | 1      |
| 411.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                                                                                   | 2      |
| 412.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 0      |
| 413.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 1      |
| 414.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 2      |
| 415.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 0      |
| 416.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 1      |
| 417.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 2      |
| 418.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 0      |
| 419.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 1      |
| 420.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 2      |
| 421.   | F              | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 0      |
| 422.   | F              | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 1      |
| 423.   | F              | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 2      |
| 424.   | F              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 0      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                      | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 425.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             |  | 1      |
| 426.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             |  | 2      |
| 427.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | H                                                                                   | 0      |
| 428.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | H                                                                                   | 1      |
| 429.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | H                                                                                   | 2      |
| 430.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 0      |
| 431.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 1      |
| 432.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 2      |
| 433.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                                                 | 0      |
| 434.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                                                 | 1      |
| 435.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                                                 | 2      |
| 436.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 0      |
| 437.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 1      |
| 438.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 2      |
| 439.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 0      |
| 440.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 1      |
| 441.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 2      |
| 442.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 443.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 444.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 445.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 0      |
| 446.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 1      |
| 447.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 2      |
| 448.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 0      |
| 449.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 1      |
| 450.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 2      |
| 451.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            | 0      |
| 452.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            | 1      |
| 453.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            | 2      |
| 454.   | F              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                                                     | 0      |
| 455.   | F              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                                                     | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                   | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|----------------------------------|--------|
| 456.   | F              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 457.   | F              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 458.   | F              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 459.   | F              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 460.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 461.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 462.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 463.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 464.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 465.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 466.   | F              | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 467.   | F              | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 468.   | F              | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 469.   | F              | H              | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 470.   | F              | H              | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 471.   | F              | H              | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 472.   | F              | H              | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 473.   | F              | H              | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 474.   | F              | H              | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 475.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 476.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 477.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 478.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 479.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 480.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 481.   | F              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 482.   | F              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 483.   | F              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me             | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 484.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 485.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 486.   | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 487.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 0      |
| 488.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 1      |

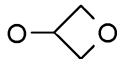
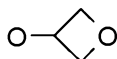
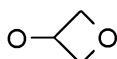
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                   | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|------------------|------------------|----------------------------------|--------|
| 489.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 2      |
| 490.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 491.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 492.   | F              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 493.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | Ph               | Cl                               | 0      |
| 494.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | Ph               | Cl                               | 1      |
| 495.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | Ph               | Cl                               | 2      |
| 496.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                               | 0      |
| 497.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                               | 1      |
| 498.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                               | 2      |
| 499.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 0      |
| 500.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 1      |
| 501.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 2      |
| 502.   | Cl             | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 503.   | Cl             | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 504.   | Cl             | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 505.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe                              | 0      |
| 506.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe                              | 1      |
| 507.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe                              | 2      |
| 508.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                               | 0      |
| 509.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                               | 1      |
| 510.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                               | 2      |
| 511.   | Cl             | H              | Cl               | Et               | Cl                               | 0      |
| 512.   | Cl             | H              | Cl               | Et               | Cl                               | 1      |
| 513.   | Cl             | H              | Cl               | Et               | Cl                               | 2      |
| 514.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                               | 0      |
| 515.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                               | 1      |
| 516.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                               | 2      |
| 517.   | Cl             | H              | Me               | Me               | Me                               | 0      |
| 518.   | Cl             | H              | Me               | Me               | Me                               | 1      |
| 519.   | Cl             | H              | Me               | Me               | Me                               | 2      |
| 520.   | Cl             | H              | Me               | Me               | Cl                               | 0      |
| 521.   | Cl             | H              | Me               | Me               | Cl                               | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|----------------|-----------------------------------|--------|
| 522.   | Cl             | H              | Me                | Me             | Cl                                | 2      |
| 523.   | Cl             | H              | Cl                | Me             | Cl                                | 0      |
| 524.   | Cl             | H              | Cl                | Me             | Cl                                | 1      |
| 525.   | Cl             | H              | Cl                | Me             | Cl                                | 2      |
| 526.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 0      |
| 527.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 1      |
| 528.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 2      |
| 529.   | Cl             | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 530.   | Cl             | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 531.   | Cl             | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 532.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 0      |
| 533.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 1      |
| 534.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 2      |
| 535.   | Cl             | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 536.   | Cl             | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 537.   | Cl             | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 538.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 0      |
| 539.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 1      |
| 540.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 2      |
| 541.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 542.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 543.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 544.   | Cl             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 545.   | Cl             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 546.   | Cl             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 547.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 548.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 549.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 550.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 551.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 552.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 553.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 0      |
| 554.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>      | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|---------------------|--------|
| 555.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CN | 2      |
| 556.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SO <sub>2</sub> Me  | 0      |
| 557.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SO <sub>2</sub> Me  | 1      |
| 558.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SO <sub>2</sub> Me  | 2      |
| 559.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SEt                 | 0      |
| 560.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SEt                 | 1      |
| 561.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SEt                 | 2      |
| 562.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Me                  | 0      |
| 563.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Me                  | 1      |
| 564.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Me                  | 2      |
| 565.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Et                  | 0      |
| 566.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Et                  | 1      |
| 567.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Et                  | 2      |
| 568.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Et             | Cl                  | 0      |
| 569.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Et             | Cl                  | 1      |
| 570.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Et             | Cl                  | 2      |
| 571.   | Cl             | H              | Cl              | Et             | CF <sub>3</sub>     | 0      |
| 572.   | Cl             | H              | Cl              | Et             | CF <sub>3</sub>     | 1      |
| 573.   | Cl             | H              | Cl              | Et             | CF <sub>3</sub>     | 2      |
| 574.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | iPr            | Cl                  | 0      |
| 575.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | iPr            | Cl                  | 1      |
| 576.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | iPr            | Cl                  | 2      |
| 577.   | Cl             | H              | Cl              | iPr            | CF <sub>3</sub>     | 0      |
| 578.   | Cl             | H              | Cl              | iPr            | CF <sub>3</sub>     | 1      |
| 579.   | Cl             | H              | Cl              | iPr            | CF <sub>3</sub>     | 2      |
| 580.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | tBu            | Cl                  | 0      |
| 581.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | tBu            | Cl                  | 1      |
| 582.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | tBu            | Cl                  | 2      |
| 583.   | Cl             | H              | Cl              | tBu            | CF <sub>3</sub>     | 0      |
| 584.   | Cl             | H              | Cl              | tBu            | CF <sub>3</sub>     | 1      |
| 585.   | Cl             | H              | Cl              | tBu            | CF <sub>3</sub>     | 2      |
| 586.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | cPen           | Cl                  | 0      |
| 587.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | cPen           | Cl                  | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-----------------|--------|
| 588.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 2      |
| 589.   | Cl             | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 590.   | Cl             | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 591.   | Cl             | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 592.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 0      |
| 593.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 1      |
| 594.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 2      |
| 595.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 596.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 597.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 598.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 0      |
| 599.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 1      |
| 600.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 2      |
| 601.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 602.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 603.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 604.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 0      |
| 605.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 1      |
| 606.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 2      |
| 607.   | Cl             | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 608.   | Cl             | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 609.   | Cl             | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 610.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 0      |
| 611.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 1      |
| 612.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 2      |
| 613.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 614.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 615.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 616.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 0      |
| 617.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 1      |
| 618.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 2      |
| 619.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 620.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub> | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>      | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|---------------------|-----------------|--------|
| 621.   | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 622.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN  | Cl              | 0      |
| 623.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN  | Cl              | 1      |
| 624.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN  | Cl              | 2      |
| 625.   | Cl             | H              | Me              | Ph                  | Me              | 0      |
| 626.   | Cl             | H              | Me              | Ph                  | Me              | 1      |
| 627.   | Cl             | H              | Me              | Ph                  | Me              | 2      |
| 628.   | Cl             | H              | Me              | Ph                  | Cl              | 0      |
| 629.   | Cl             | H              | Me              | Ph                  | Cl              | 1      |
| 630.   | Cl             | H              | Me              | Ph                  | Cl              | 2      |
| 631.   | Cl             | H              | Et              | Ph                  | Cl              | 0      |
| 632.   | Cl             | H              | Et              | Ph                  | Cl              | 1      |
| 633.   | Cl             | H              | Et              | Ph                  | Cl              | 2      |
| 634.   | Cl             | H              | Pr              | Ph                  | Cl              | 0      |
| 635.   | Cl             | H              | Pr              | Ph                  | Cl              | 1      |
| 636.   | Cl             | H              | Pr              | Ph                  | Cl              | 2      |
| 637.   | Cl             | H              | iPr             | Ph                  | Cl              | 0      |
| 638.   | Cl             | H              | iPr             | Ph                  | Cl              | 1      |
| 639.   | Cl             | H              | iPr             | Ph                  | Cl              | 2      |
| 640.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Cl              | 0      |
| 641.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Cl              | 1      |
| 642.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Cl              | 2      |
| 643.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Me              | 0      |
| 644.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Me              | 1      |
| 645.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Me              | 2      |
| 646.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 647.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 648.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 649.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | F               | 0      |
| 650.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | F               | 1      |
| 651.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | F               | 2      |
| 652.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | OMe             | 0      |
| 653.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | OMe             | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                        | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 654.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe                                                                                   | 2      |
| 655.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                                                                                   | 0      |
| 656.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                                                                                   | 1      |
| 657.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                                                                                   | 2      |
| 658.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 0      |
| 659.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 1      |
| 660.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 2      |
| 661.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 0      |
| 662.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 1      |
| 663.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 2      |
| 664.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 0      |
| 665.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 1      |
| 666.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 2      |
| 667.   | Cl             | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 0      |
| 668.   | Cl             | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 1      |
| 669.   | Cl             | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 2      |
| 670.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 0      |
| 671.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 1      |
| 672.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 2      |
| 673.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                     | 0      |
| 674.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                     | 1      |
| 675.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                     | 2      |
| 676.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 0      |
| 677.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 1      |
| 678.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 2      |
| 679.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                   | 0      |
| 680.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                   | 1      |
| 681.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                   | 2      |
| 682.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    | 0      |
| 683.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                     | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|----------------------------------------------------|--------|
| 684.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F | 2      |
| 685.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 0      |
| 686.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 1      |
| 687.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 2      |
| 688.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 0      |
| 689.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 1      |
| 690.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 2      |
| 691.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 0      |
| 692.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 1      |
| 693.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 2      |
| 694.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 0      |
| 695.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 1      |
| 696.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 2      |
| 697.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 0      |
| 698.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 1      |
| 699.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 2      |
| 700.   | Cl             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 0      |
| 701.   | Cl             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 1      |
| 702.   | Cl             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 2      |
| 703.   | Cl             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 704.   | Cl             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 705.   | Cl             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 706.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 707.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 708.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 709.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 710.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 711.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 712.   | Cl             | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 0      |
| 713.   | Cl             | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 1      |
| 714.   | Cl             | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 2      |
| 715.   | Cl             | H              | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 0      |
| 716.   | Cl             | H              | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                  | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                   | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|---------------------------------|------------------|----------------------------------|--------|
| 717.   | Cl             | H              | Br                              | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 718.   | Cl             | H              | Br                              | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 719.   | Cl             | H              | Br                              | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 720.   | Cl             | H              | Br                              | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 721.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 722.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 723.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 724.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 725.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 726.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 727.   | Cl             | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 728.   | Cl             | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 729.   | Cl             | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 730.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 731.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 732.   | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 733.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 0      |
| 734.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 1      |
| 735.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 2      |
| 736.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 737.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 738.   | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 739.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                               | 0      |
| 740.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                               | 1      |
| 741.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                               | 2      |
| 742.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                               | 0      |
| 743.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                               | 1      |
| 744.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                               | 2      |
| 745.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 0      |
| 746.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 1      |
| 747.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 2      |
| 748.   | Br             | H              | Cl                              | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 749.   | Br             | H              | Cl                              | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  | 1      |

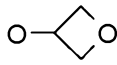
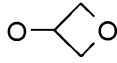
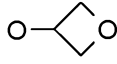
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|------------------|------------------|-----------------|--------|
| 750.   | Br             | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 751.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 0      |
| 752.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 1      |
| 753.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 2      |
| 754.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 0      |
| 755.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 1      |
| 756.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 2      |
| 757.   | Br             | H              | Cl               | Et               | Cl              | 0      |
| 758.   | Br             | H              | Cl               | Et               | Cl              | 1      |
| 759.   | Br             | H              | Cl               | Et               | Cl              | 2      |
| 760.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 0      |
| 761.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 1      |
| 762.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 2      |
| 763.   | Br             | H              | Me               | Me               | Me              | 0      |
| 764.   | Br             | H              | Me               | Me               | Me              | 1      |
| 765.   | Br             | H              | Me               | Me               | Me              | 2      |
| 766.   | Br             | H              | Me               | Me               | Cl              | 0      |
| 767.   | Br             | H              | Me               | Me               | Cl              | 1      |
| 768.   | Br             | H              | Me               | Me               | Cl              | 2      |
| 769.   | Br             | H              | Cl               | Me               | Cl              | 0      |
| 770.   | Br             | H              | Cl               | Me               | Cl              | 1      |
| 771.   | Br             | H              | Cl               | Me               | Cl              | 2      |
| 772.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl              | 0      |
| 773.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl              | 1      |
| 774.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl              | 2      |
| 775.   | Br             | H              | Cl               | Me               | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 776.   | Br             | H              | Cl               | Me               | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 777.   | Br             | H              | Cl               | Me               | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 778.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | F               | 0      |
| 779.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | F               | 1      |
| 780.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | F               | 2      |
| 781.   | Br             | H              | OMe              | Me               | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 782.   | Br             | H              | OMe              | Me               | CF <sub>3</sub> | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|----------------|-----------------------------------|--------|
| 783.   | Br             | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 784.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 0      |
| 785.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 1      |
| 786.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 2      |
| 787.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 788.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 789.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 790.   | Br             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 791.   | Br             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 792.   | Br             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 793.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 794.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 795.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 796.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 797.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 798.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 799.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 0      |
| 800.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 1      |
| 801.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 2      |
| 802.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 0      |
| 803.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 1      |
| 804.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 2      |
| 805.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 0      |
| 806.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 1      |
| 807.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 2      |
| 808.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Me                                | 0      |
| 809.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Me                                | 1      |
| 810.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Me                                | 2      |
| 811.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Et                                | 0      |
| 812.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Et                                | 1      |
| 813.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Et                                | 2      |
| 814.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 0      |
| 815.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-----------------|--------|
| 816.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Et                                 | Cl              | 2      |
| 817.   | Br             | H              | Cl              | Et                                 | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 818.   | Br             | H              | Cl              | Et                                 | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 819.   | Br             | H              | Cl              | Et                                 | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 820.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl              | 0      |
| 821.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl              | 1      |
| 822.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl              | 2      |
| 823.   | Br             | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 824.   | Br             | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 825.   | Br             | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 826.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl              | 0      |
| 827.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl              | 1      |
| 828.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl              | 2      |
| 829.   | Br             | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 830.   | Br             | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 831.   | Br             | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 832.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 0      |
| 833.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 1      |
| 834.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 2      |
| 835.   | Br             | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 836.   | Br             | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 837.   | Br             | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 838.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 0      |
| 839.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 1      |
| 840.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 2      |
| 841.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 842.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 843.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 844.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 0      |
| 845.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 1      |
| 846.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 2      |
| 847.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 848.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-----------------|--------|
| 849.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 850.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 0      |
| 851.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 1      |
| 852.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 2      |
| 853.   | Br             | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 854.   | Br             | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 855.   | Br             | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 856.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 0      |
| 857.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 1      |
| 858.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 2      |
| 859.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 860.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 861.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 862.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 0      |
| 863.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 1      |
| 864.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 2      |
| 865.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 866.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 867.   | Br             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 868.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl              | 0      |
| 869.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl              | 1      |
| 870.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl              | 2      |
| 871.   | Br             | H              | Me              | Ph                                 | Me              | 0      |
| 872.   | Br             | H              | Me              | Ph                                 | Me              | 1      |
| 873.   | Br             | H              | Me              | Ph                                 | Me              | 2      |
| 874.   | Br             | H              | Me              | Ph                                 | Cl              | 0      |
| 875.   | Br             | H              | Me              | Ph                                 | Cl              | 1      |
| 876.   | Br             | H              | Me              | Ph                                 | Cl              | 2      |
| 877.   | Br             | H              | Et              | Ph                                 | Cl              | 0      |
| 878.   | Br             | H              | Et              | Ph                                 | Cl              | 1      |
| 879.   | Br             | H              | Et              | Ph                                 | Cl              | 2      |
| 880.   | Br             | H              | Pr              | Ph                                 | Cl              | 0      |
| 881.   | Br             | H              | Pr              | Ph                                 | Cl              | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                   | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------------------------|--------|
| 882.   | Br             | H              | Pr              | Ph             | Cl                               | 2      |
| 883.   | Br             | H              | iPr             | Ph             | Cl                               | 0      |
| 884.   | Br             | H              | iPr             | Ph             | Cl                               | 1      |
| 885.   | Br             | H              | iPr             | Ph             | Cl                               | 2      |
| 886.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                               | 0      |
| 887.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                               | 1      |
| 888.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                               | 2      |
| 889.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me                               | 0      |
| 890.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me                               | 1      |
| 891.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me                               | 2      |
| 892.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 893.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 894.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 895.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F                                | 0      |
| 896.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F                                | 1      |
| 897.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F                                | 2      |
| 898.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe                              | 0      |
| 899.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe                              | 1      |
| 900.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe                              | 2      |
| 901.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                              | 0      |
| 902.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                              | 1      |
| 903.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                              | 2      |
| 904.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 905.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 906.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 907.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                               | 0      |
| 908.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                               | 1      |
| 909.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                               | 2      |
| 910.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                               | 0      |
| 911.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                               | 1      |
| 912.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                               | 2      |
| 913.   | Br             | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 0      |
| 914.   | Br             | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                      | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 915.   | Br             | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    | 2      |
| 916.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 0      |
| 917.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 1      |
| 918.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 2      |
| 919.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                   | 0      |
| 920.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                   | 1      |
| 921.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                   | 2      |
| 922.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 0      |
| 923.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 1      |
| 924.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 2      |
| 925.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                 | 0      |
| 926.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                 | 1      |
| 927.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                 | 2      |
| 928.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 0      |
| 929.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 1      |
| 930.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 2      |
| 931.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 0      |
| 932.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 1      |
| 933.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 2      |
| 934.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 935.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 936.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 937.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 0      |
| 938.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 1      |
| 939.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 2      |
| 940.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 0      |
| 941.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 1      |
| 942.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 2      |
| 943.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            | 0      |
| 944.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|---------------------------------|--------|
| 945.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F        | 2      |
| 946.   | Br             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 0      |
| 947.   | Br             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 1      |
| 948.   | Br             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 2      |
| 949.   | Br             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 950.   | Br             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 951.   | Br             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 952.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 953.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 954.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 955.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 956.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 957.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 958.   | Br             | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>               | 0      |
| 959.   | Br             | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>               | 1      |
| 960.   | Br             | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>               | 2      |
| 961.   | Br             | H              | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>               | 0      |
| 962.   | Br             | H              | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>               | 1      |
| 963.   | Br             | H              | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>               | 2      |
| 964.   | Br             | H              | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 0      |
| 965.   | Br             | H              | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 1      |
| 966.   | Br             | H              | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 2      |
| 967.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 0      |
| 968.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 1      |
| 969.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 2      |
| 970.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 0      |
| 971.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 1      |
| 972.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 2      |
| 973.   | Br             | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 0      |
| 974.   | Br             | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 1      |
| 975.   | Br             | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me             | CF <sub>3</sub>                 | 2      |
| 976.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 0      |
| 977.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 1      |

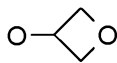
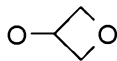
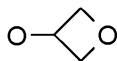
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                   | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|------------------|------------------|----------------------------------|--------|
| 978.   | Br             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 979.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 0      |
| 980.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 1      |
| 981.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 2      |
| 982.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 983.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 984.   | Br             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 985.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | Ph               | Cl                               | 0      |
| 986.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | Ph               | Cl                               | 1      |
| 987.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | Ph               | Cl                               | 2      |
| 988.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                               | 0      |
| 989.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                               | 1      |
| 990.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                               | 2      |
| 991.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 0      |
| 992.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 1      |
| 993.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 2      |
| 994.   | I              | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 995.   | I              | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 996.   | I              | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 997.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe                              | 0      |
| 998.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe                              | 1      |
| 999.   | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe                              | 2      |
| 1000.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                               | 0      |
| 1001.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                               | 1      |
| 1002.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                               | 2      |
| 1003.  | I              | H              | Cl               | Et               | Cl                               | 0      |
| 1004.  | I              | H              | Cl               | Et               | Cl                               | 1      |
| 1005.  | I              | H              | Cl               | Et               | Cl                               | 2      |
| 1006.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                               | 0      |
| 1007.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                               | 1      |
| 1008.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                               | 2      |
| 1009.  | I              | H              | Me               | Me               | Me                               | 0      |
| 1010.  | I              | H              | Me               | Me               | Me                               | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|----------------|-----------------------------------|--------|
| 1011.  | I              | H              | Me                | Me             | Me                                | 2      |
| 1012.  | I              | H              | Me                | Me             | Cl                                | 0      |
| 1013.  | I              | H              | Me                | Me             | Cl                                | 1      |
| 1014.  | I              | H              | Me                | Me             | Cl                                | 2      |
| 1015.  | I              | H              | Cl                | Me             | Cl                                | 0      |
| 1016.  | I              | H              | Cl                | Me             | Cl                                | 1      |
| 1017.  | I              | H              | Cl                | Me             | Cl                                | 2      |
| 1018.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 0      |
| 1019.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 1      |
| 1020.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 2      |
| 1021.  | I              | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1022.  | I              | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1023.  | I              | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1024.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 0      |
| 1025.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 1      |
| 1026.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 2      |
| 1027.  | I              | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1028.  | I              | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1029.  | I              | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1030.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 0      |
| 1031.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 1      |
| 1032.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 2      |
| 1033.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 1034.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 1035.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 1036.  | I              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1037.  | I              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1038.  | I              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1039.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1040.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1041.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1042.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 1043.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                   | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------------------------|--------|
| 1044.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1045.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CN              | 0      |
| 1046.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CN              | 1      |
| 1047.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CN              | 2      |
| 1048.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SO <sub>2</sub> Me               | 0      |
| 1049.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SO <sub>2</sub> Me               | 1      |
| 1050.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SO <sub>2</sub> Me               | 2      |
| 1051.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SEt                              | 0      |
| 1052.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SEt                              | 1      |
| 1053.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SEt                              | 2      |
| 1054.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Me                               | 0      |
| 1055.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Me                               | 1      |
| 1056.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Me                               | 2      |
| 1057.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Et                               | 0      |
| 1058.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Et                               | 1      |
| 1059.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | Et                               | 2      |
| 1060.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Et             | Cl                               | 0      |
| 1061.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Et             | Cl                               | 1      |
| 1062.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Et             | Cl                               | 2      |
| 1063.  | I              | H              | Cl              | Et             | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 1064.  | I              | H              | Cl              | Et             | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 1065.  | I              | H              | Cl              | Et             | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 1066.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr            | Cl                               | 0      |
| 1067.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr            | Cl                               | 1      |
| 1068.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr            | Cl                               | 2      |
| 1069.  | I              | H              | Cl              | iPr            | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 1070.  | I              | H              | Cl              | iPr            | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 1071.  | I              | H              | Cl              | iPr            | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 1072.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu            | Cl                               | 0      |
| 1073.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu            | Cl                               | 1      |
| 1074.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu            | Cl                               | 2      |
| 1075.  | I              | H              | Cl              | tBu            | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 1076.  | I              | H              | Cl              | tBu            | CF <sub>3</sub>                  | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-----------------|--------|
| 1077.  | I              | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1078.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 0      |
| 1079.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 1      |
| 1080.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 2      |
| 1081.  | I              | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1082.  | I              | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1083.  | I              | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1084.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 0      |
| 1085.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 1      |
| 1086.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 2      |
| 1087.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1088.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1089.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1090.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 0      |
| 1091.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 1      |
| 1092.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 2      |
| 1093.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1094.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1095.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1096.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 0      |
| 1097.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 1      |
| 1098.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 2      |
| 1099.  | I              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1100.  | I              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1101.  | I              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1102.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 0      |
| 1103.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 1      |
| 1104.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 2      |
| 1105.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1106.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1107.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1108.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 0      |
| 1109.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>      | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|---------------------|-----------------|--------|
| 1110.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe | Cl              | 2      |
| 1111.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1112.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1113.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1114.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN  | Cl              | 0      |
| 1115.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN  | Cl              | 1      |
| 1116.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN  | Cl              | 2      |
| 1117.  | I              | H              | Me              | Ph                  | Me              | 0      |
| 1118.  | I              | H              | Me              | Ph                  | Me              | 1      |
| 1119.  | I              | H              | Me              | Ph                  | Me              | 2      |
| 1120.  | I              | H              | Me              | Ph                  | Cl              | 0      |
| 1121.  | I              | H              | Me              | Ph                  | Cl              | 1      |
| 1122.  | I              | H              | Me              | Ph                  | Cl              | 2      |
| 1123.  | I              | H              | Et              | Ph                  | Cl              | 0      |
| 1124.  | I              | H              | Et              | Ph                  | Cl              | 1      |
| 1125.  | I              | H              | Et              | Ph                  | Cl              | 2      |
| 1126.  | I              | H              | Pr              | Ph                  | Cl              | 0      |
| 1127.  | I              | H              | Pr              | Ph                  | Cl              | 1      |
| 1128.  | I              | H              | Pr              | Ph                  | Cl              | 2      |
| 1129.  | I              | H              | iPr             | Ph                  | Cl              | 0      |
| 1130.  | I              | H              | iPr             | Ph                  | Cl              | 1      |
| 1131.  | I              | H              | iPr             | Ph                  | Cl              | 2      |
| 1132.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Cl              | 0      |
| 1133.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Cl              | 1      |
| 1134.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Cl              | 2      |
| 1135.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Me              | 0      |
| 1136.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Me              | 1      |
| 1137.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | Me              | 2      |
| 1138.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1139.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1140.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1141.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | F               | 0      |
| 1142.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                  | F               | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                        | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 1143.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F                                                                                     | 2      |
| 1144.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe                                                                                   | 0      |
| 1145.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe                                                                                   | 1      |
| 1146.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe                                                                                   | 2      |
| 1147.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                                                                                   | 0      |
| 1148.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                                                                                   | 1      |
| 1149.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt                                                                                   | 2      |
| 1150.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 0      |
| 1151.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 1      |
| 1152.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 2      |
| 1153.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 0      |
| 1154.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 1      |
| 1155.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                                                                                    | 2      |
| 1156.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 0      |
| 1157.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 1      |
| 1158.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                    | 2      |
| 1159.  | I              | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 0      |
| 1160.  | I              | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 1      |
| 1161.  | I              | H              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 2      |
| 1162.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 0      |
| 1163.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 1      |
| 1164.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 2      |
| 1165.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                     | 0      |
| 1166.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                     | 1      |
| 1167.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                     | 2      |
| 1168.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 0      |
| 1169.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 1      |
| 1170.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 2      |
| 1171.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                   | 0      |
| 1172.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                   | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                     | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|----------------------------------------------------|--------|
| 1173.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                | 2      |
| 1174.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F | 0      |
| 1175.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F | 1      |
| 1176.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F | 2      |
| 1177.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 0      |
| 1178.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 1      |
| 1179.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 2      |
| 1180.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 0      |
| 1181.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 1      |
| 1182.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 2      |
| 1183.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 0      |
| 1184.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 1      |
| 1185.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 2      |
| 1186.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 0      |
| 1187.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 1      |
| 1188.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 2      |
| 1189.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 0      |
| 1190.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 1      |
| 1191.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 2      |
| 1192.  | I              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 0      |
| 1193.  | I              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 1      |
| 1194.  | I              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 2      |
| 1195.  | I              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 1196.  | I              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 1197.  | I              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 1198.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 1199.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 1200.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 1201.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 1202.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 1203.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 1204.  | I              | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 0      |
| 1205.  | I              | H              | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                  | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                   | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|---------------------------------|------------------|----------------------------------|--------|
| 1206.  | I              | H              | Cl                              | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 1207.  | I              | H              | Br                              | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 1208.  | I              | H              | Br                              | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 1209.  | I              | H              | Br                              | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 1210.  | I              | H              | Br                              | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 1211.  | I              | H              | Br                              | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 1212.  | I              | H              | Br                              | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 1213.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 1214.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 1215.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 1216.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 1217.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 1218.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 1219.  | I              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 1220.  | I              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 1221.  | I              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 1222.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 1223.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 1224.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 1225.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1226.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1227.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1228.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 1229.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 1230.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 1231.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                               | 0      |
| 1232.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                               | 1      |
| 1233.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                               | 2      |
| 1234.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                               | 0      |
| 1235.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                               | 1      |
| 1236.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                               | 2      |
| 1237.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 0      |
| 1238.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                               | 1      |

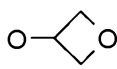
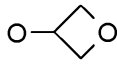
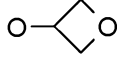
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|------------------|------------------|-----------------|--------|
| 1239.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl              | 2      |
| 1240.  | H              | F              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1241.  | H              | F              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1242.  | H              | F              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1243.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 0      |
| 1244.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 1      |
| 1245.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 2      |
| 1246.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 0      |
| 1247.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 1      |
| 1248.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 2      |
| 1249.  | H              | F              | Cl               | Et               | Cl              | 0      |
| 1250.  | H              | F              | Cl               | Et               | Cl              | 1      |
| 1251.  | H              | F              | Cl               | Et               | Cl              | 2      |
| 1252.  | H              | F              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 0      |
| 1253.  | H              | F              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 1      |
| 1254.  | H              | F              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 2      |
| 1255.  | H              | F              | Me               | Me               | Me              | 0      |
| 1256.  | H              | F              | Me               | Me               | Me              | 1      |
| 1257.  | H              | F              | Me               | Me               | Me              | 2      |
| 1258.  | H              | F              | Me               | Me               | Cl              | 0      |
| 1259.  | H              | F              | Me               | Me               | Cl              | 1      |
| 1260.  | H              | F              | Me               | Me               | Cl              | 2      |
| 1261.  | H              | F              | Cl               | Me               | Cl              | 0      |
| 1262.  | H              | F              | Cl               | Me               | Cl              | 1      |
| 1263.  | H              | F              | Cl               | Me               | Cl              | 2      |
| 1264.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl              | 0      |
| 1265.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl              | 1      |
| 1266.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl              | 2      |
| 1267.  | H              | F              | Cl               | Me               | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1268.  | H              | F              | Cl               | Me               | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1269.  | H              | F              | Cl               | Me               | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1270.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | Me               | F               | 0      |
| 1271.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>  | Me               | F               | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|----------------|-----------------------------------|--------|
| 1272.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 2      |
| 1273.  | H              | F              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1274.  | H              | F              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1275.  | H              | F              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1276.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 0      |
| 1277.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 1      |
| 1278.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OEt                               | 2      |
| 1279.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 1280.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 1281.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 1282.  | H              | F              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1283.  | H              | F              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1284.  | H              | F              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1285.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1286.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1287.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1288.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 1289.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 1290.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 1291.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 0      |
| 1292.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 1      |
| 1293.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CN               | 2      |
| 1294.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 0      |
| 1295.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 1      |
| 1296.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 2      |
| 1297.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 0      |
| 1298.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 1      |
| 1299.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 2      |
| 1300.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Me                                | 0      |
| 1301.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Me                                | 1      |
| 1302.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Me                                | 2      |
| 1303.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Et                                | 0      |
| 1304.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Et                                | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-----------------|--------|
| 1305.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me                                 | Et              | 2      |
| 1306.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Et                                 | Cl              | 0      |
| 1307.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Et                                 | Cl              | 1      |
| 1308.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Et                                 | Cl              | 2      |
| 1309.  | H              | F              | Cl              | Et                                 | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1310.  | H              | F              | Cl              | Et                                 | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1311.  | H              | F              | Cl              | Et                                 | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1312.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl              | 0      |
| 1313.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl              | 1      |
| 1314.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl              | 2      |
| 1315.  | H              | F              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1316.  | H              | F              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1317.  | H              | F              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1318.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl              | 0      |
| 1319.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl              | 1      |
| 1320.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl              | 2      |
| 1321.  | H              | F              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1322.  | H              | F              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1323.  | H              | F              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1324.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 0      |
| 1325.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 1      |
| 1326.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl              | 2      |
| 1327.  | H              | F              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1328.  | H              | F              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1329.  | H              | F              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1330.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 0      |
| 1331.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 1      |
| 1332.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl              | 2      |
| 1333.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1334.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1335.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1336.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 0      |
| 1337.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-----------------|--------|
| 1338.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl              | 2      |
| 1339.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1340.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1341.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1342.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 0      |
| 1343.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 1      |
| 1344.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe             | 2      |
| 1345.  | H              | F              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1346.  | H              | F              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1347.  | H              | F              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1348.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 0      |
| 1349.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 1      |
| 1350.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl              | 2      |
| 1351.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1352.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1353.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1354.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 0      |
| 1355.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 1      |
| 1356.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl              | 2      |
| 1357.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1358.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1359.  | H              | F              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1360.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl              | 0      |
| 1361.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl              | 1      |
| 1362.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl              | 2      |
| 1363.  | H              | F              | Me              | Ph                                 | Me              | 0      |
| 1364.  | H              | F              | Me              | Ph                                 | Me              | 1      |
| 1365.  | H              | F              | Me              | Ph                                 | Me              | 2      |
| 1366.  | H              | F              | Me              | Ph                                 | Cl              | 0      |
| 1367.  | H              | F              | Me              | Ph                                 | Cl              | 1      |
| 1368.  | H              | F              | Me              | Ph                                 | Cl              | 2      |
| 1369.  | H              | F              | Et              | Ph                                 | Cl              | 0      |
| 1370.  | H              | F              | Et              | Ph                                 | Cl              | 1      |

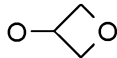
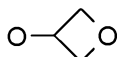
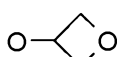
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|-------------------|--------|
| 1371.  | H              | F              | Et              | Ph             | Cl                | 2      |
| 1372.  | H              | F              | Pr              | Ph             | Cl                | 0      |
| 1373.  | H              | F              | Pr              | Ph             | Cl                | 1      |
| 1374.  | H              | F              | Pr              | Ph             | Cl                | 2      |
| 1375.  | H              | F              | iPr             | Ph             | Cl                | 0      |
| 1376.  | H              | F              | iPr             | Ph             | Cl                | 1      |
| 1377.  | H              | F              | iPr             | Ph             | Cl                | 2      |
| 1378.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                | 0      |
| 1379.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                | 1      |
| 1380.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                | 2      |
| 1381.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me                | 0      |
| 1382.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me                | 1      |
| 1383.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | Me                | 2      |
| 1384.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub>   | 0      |
| 1385.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub>   | 1      |
| 1386.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CF <sub>3</sub>   | 2      |
| 1387.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F                 | 0      |
| 1388.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F                 | 1      |
| 1389.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | F                 | 2      |
| 1390.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe               | 0      |
| 1391.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe               | 1      |
| 1392.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OMe               | 2      |
| 1393.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt               | 0      |
| 1394.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt               | 1      |
| 1395.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OEt               | 2      |
| 1396.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1397.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1398.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1399.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                | 0      |
| 1400.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                | 1      |
| 1401.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph             | CN                | 2      |
| 1402.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                | 0      |
| 1403.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                      | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 1404.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)       | Cl                                                                                  | 2      |
| 1405.  | H              | F              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    | 0      |
| 1406.  | H              | F              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    | 1      |
| 1407.  | H              | F              | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    | 2      |
| 1408.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 0      |
| 1409.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 1      |
| 1410.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 2      |
| 1411.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                   | 0      |
| 1412.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                   | 1      |
| 1413.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                   | 2      |
| 1414.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 0      |
| 1415.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 1      |
| 1416.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 2      |
| 1417.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                 | 0      |
| 1418.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                 | 1      |
| 1419.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                 | 2      |
| 1420.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 0      |
| 1421.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 1      |
| 1422.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 2      |
| 1423.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 0      |
| 1424.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 1      |
| 1425.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 2      |
| 1426.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 1427.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 1428.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 1429.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 0      |
| 1430.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 1      |
| 1431.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 2      |
| 1432.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 0      |
| 1433.  | H              | F              | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>           | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|--------------------------|--------|
| 1434.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CF <sub>3</sub>   | 2      |
| 1435.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F | 0      |
| 1436.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F | 1      |
| 1437.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F | 2      |
| 1438.  | H              | F              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>          | 0      |
| 1439.  | H              | F              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>          | 1      |
| 1440.  | H              | F              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>          | 2      |
| 1441.  | H              | F              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 0      |
| 1442.  | H              | F              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 1      |
| 1443.  | H              | F              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 2      |
| 1444.  | H              | F              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 0      |
| 1445.  | H              | F              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 1      |
| 1446.  | H              | F              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 2      |
| 1447.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 0      |
| 1448.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 1      |
| 1449.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 2      |
| 1450.  | H              | F              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 0      |
| 1451.  | H              | F              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 1      |
| 1452.  | H              | F              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 2      |
| 1453.  | H              | F              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 0      |
| 1454.  | H              | F              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 1      |
| 1455.  | H              | F              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 2      |
| 1456.  | H              | F              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>          | 0      |
| 1457.  | H              | F              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>          | 1      |
| 1458.  | H              | F              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>          | 2      |
| 1459.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                       | 0      |
| 1460.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                       | 1      |
| 1461.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                       | 2      |
| 1462.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                       | 0      |
| 1463.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                       | 1      |
| 1464.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                       | 2      |
| 1465.  | H              | Cl             | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>          | 0      |
| 1466.  | H              | Cl             | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>          | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|------------------|-------------------|--------|
| 1467.  | H              | Cl             | Cl                | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   | 2      |
| 1468.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | OMe               | 0      |
| 1469.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | OMe               | 1      |
| 1470.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | OMe               | 2      |
| 1471.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | CN                | 0      |
| 1472.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | CN                | 1      |
| 1473.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | CN                | 2      |
| 1474.  | H              | Cl             | CHF <sub>2</sub>  | Me               | Cl                | 0      |
| 1475.  | H              | Cl             | CHF <sub>2</sub>  | Me               | Cl                | 1      |
| 1476.  | H              | Cl             | CHF <sub>2</sub>  | Me               | Cl                | 2      |
| 1477.  | H              | Cl             | Me                | Me               | Me                | 0      |
| 1478.  | H              | Cl             | Me                | Me               | Me                | 1      |
| 1479.  | H              | Cl             | Me                | Me               | Me                | 2      |
| 1480.  | H              | Cl             | Me                | Me               | Cl                | 0      |
| 1481.  | H              | Cl             | Me                | Me               | Cl                | 1      |
| 1482.  | H              | Cl             | Me                | Me               | Cl                | 2      |
| 1483.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | Cl                | 0      |
| 1484.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | Cl                | 1      |
| 1485.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | Cl                | 2      |
| 1486.  | H              | Cl             | Cl                | Me               | CF <sub>3</sub>   | 0      |
| 1487.  | H              | Cl             | Cl                | Me               | CF <sub>3</sub>   | 1      |
| 1488.  | H              | Cl             | Cl                | Me               | CF <sub>3</sub>   | 2      |
| 1489.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | F                 | 0      |
| 1490.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | F                 | 1      |
| 1491.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | F                 | 2      |
| 1492.  | H              | Cl             | OMe               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 0      |
| 1493.  | H              | Cl             | OMe               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 1      |
| 1494.  | H              | Cl             | OMe               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 2      |
| 1495.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1496.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1497.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1498.  | H              | Cl             | OCHF <sub>2</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>   | 0      |
| 1499.  | H              | Cl             | OCHF <sub>2</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>   | 1      |

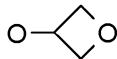
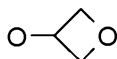
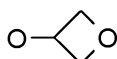
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|---------------------------------|-----------------------------------|--------|
| 1500.  | H              | Cl             | OCHF <sub>2</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1501.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1502.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1503.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1504.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 1505.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 1506.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 1507.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                | 0      |
| 1508.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                | 1      |
| 1509.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                | 2      |
| 1510.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SEt                               | 0      |
| 1511.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SEt                               | 1      |
| 1512.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SEt                               | 2      |
| 1513.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Et                              | Cl                                | 0      |
| 1514.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Et                              | Cl                                | 1      |
| 1515.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Et                              | Cl                                | 2      |
| 1516.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | iPr                             | Cl                                | 0      |
| 1517.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | iPr                             | Cl                                | 1      |
| 1518.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | iPr                             | Cl                                | 2      |
| 1519.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                | 0      |
| 1520.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                | 1      |
| 1521.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                | 2      |
| 1522.  | H              | Cl             | Cl                | tBu                             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1523.  | H              | Cl             | Cl                | tBu                             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1524.  | H              | Cl             | Cl                | tBu                             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1525.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | cPen                            | Cl                                | 0      |
| 1526.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | cPen                            | Cl                                | 1      |
| 1527.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | cPen                            | Cl                                | 2      |
| 1528.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | OMe                               | 0      |
| 1529.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | OMe                               | 1      |
| 1530.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | OMe                               | 2      |
| 1531.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                | 0      |
| 1532.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 1533.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    | 2      |
| 1534.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 0      |
| 1535.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 1      |
| 1536.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 2      |
| 1537.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 0      |
| 1538.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 1      |
| 1539.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 2      |
| 1540.  | H              | Cl             | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 0      |
| 1541.  | H              | Cl             | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 1      |
| 1542.  | H              | Cl             | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 2      |
| 1543.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              |    | 0      |
| 1544.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              |   | 1      |
| 1545.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              |  | 2      |
| 1546.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | H                                                                                     | 0      |
| 1547.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | H                                                                                     | 1      |
| 1548.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | H                                                                                     | 2      |
| 1549.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 0      |
| 1550.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 1      |
| 1551.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 2      |
| 1552.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SMe                                                                                   | 0      |
| 1553.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SMe                                                                                   | 1      |
| 1554.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SMe                                                                                   | 2      |
| 1555.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    | 0      |
| 1556.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    | 1      |
| 1557.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    | 2      |
| 1558.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   | 0      |
| 1559.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   | 1      |
| 1560.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   | 2      |
| 1561.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     | 0      |
| 1562.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|---------------------------------------------------|--------|
| 1563.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1564.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>               | 0      |
| 1565.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>               | 1      |
| 1566.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>               | 2      |
| 1567.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                            | 0      |
| 1568.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                            | 1      |
| 1569.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                            | 2      |
| 1570.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                          | 0      |
| 1571.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                          | 1      |
| 1572.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                          | 2      |
| 1573.  | H              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 0      |
| 1574.  | H              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 1      |
| 1575.  | H              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 2      |
| 1576.  | H              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 0      |
| 1577.  | H              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 1      |
| 1578.  | H              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 2      |
| 1579.  | H              | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 0      |
| 1580.  | H              | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 1      |
| 1581.  | H              | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 2      |
| 1582.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 0      |
| 1583.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 1      |
| 1584.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                  | 2      |
| 1585.  | H              | Cl             | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 0      |
| 1586.  | H              | Cl             | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 1      |
| 1587.  | H              | Cl             | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 2      |
| 1588.  | H              | Cl             | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 0      |
| 1589.  | H              | Cl             | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 1      |
| 1590.  | H              | Cl             | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                 | 2      |
| 1591.  | H              | Cl             | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 0      |
| 1592.  | H              | Cl             | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 1      |
| 1593.  | H              | Cl             | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                                   | 2      |
| 1594.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | tBu            | Cl                                                | 0      |
| 1595.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | tBu            | Cl                                                | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>  | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|------------------|------------------|-----------------|--------|
| 1596.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl              | 2      |
| 1597.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl              | 0      |
| 1598.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl              | 1      |
| 1599.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl              | 2      |
| 1600.  | H              | Br             | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1601.  | H              | Br             | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1602.  | H              | Br             | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1603.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 0      |
| 1604.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 1      |
| 1605.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe             | 2      |
| 1606.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 0      |
| 1607.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 1      |
| 1608.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN              | 2      |
| 1609.  | H              | Br             | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 0      |
| 1610.  | H              | Br             | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 1      |
| 1611.  | H              | Br             | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl              | 2      |
| 1612.  | H              | Br             | Me               | Me               | Me              | 0      |
| 1613.  | H              | Br             | Me               | Me               | Me              | 1      |
| 1614.  | H              | Br             | Me               | Me               | Me              | 2      |
| 1615.  | H              | Br             | Me               | Me               | Cl              | 0      |
| 1616.  | H              | Br             | Me               | Me               | Cl              | 1      |
| 1617.  | H              | Br             | Me               | Me               | Cl              | 2      |
| 1618.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl              | 0      |
| 1619.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl              | 1      |
| 1620.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl              | 2      |
| 1621.  | H              | Br             | Cl               | Me               | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1622.  | H              | Br             | Cl               | Me               | CF <sub>3</sub> | 1      |
| 1623.  | H              | Br             | Cl               | Me               | CF <sub>3</sub> | 2      |
| 1624.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | F               | 0      |
| 1625.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | F               | 1      |
| 1626.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>  | Me               | F               | 2      |
| 1627.  | H              | Br             | OMe              | Me               | CF <sub>3</sub> | 0      |
| 1628.  | H              | Br             | OMe              | Me               | CF <sub>3</sub> | 1      |

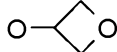
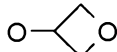
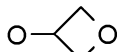
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|----------------|-----------------------------------|--------|
| 1629.  | H              | Br             | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1630.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 1631.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 1632.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 1633.  | H              | Br             | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1634.  | H              | Br             | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1635.  | H              | Br             | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1636.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1637.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1638.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1639.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 1640.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 1641.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 1642.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 0      |
| 1643.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 1      |
| 1644.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 2      |
| 1645.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 0      |
| 1646.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 1      |
| 1647.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 2      |
| 1648.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 0      |
| 1649.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 1      |
| 1650.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 2      |
| 1651.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | iPr            | Cl                                | 0      |
| 1652.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | iPr            | Cl                                | 1      |
| 1653.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | iPr            | Cl                                | 2      |
| 1654.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | tBu            | Cl                                | 0      |
| 1655.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | tBu            | Cl                                | 1      |
| 1656.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | tBu            | Cl                                | 2      |
| 1657.  | H              | Br             | Cl                | tBu            | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1658.  | H              | Br             | Cl                | tBu            | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1659.  | H              | Br             | Cl                | tBu            | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1660.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | cPen           | Cl                                | 0      |
| 1661.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>   | cPen           | Cl                                | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 1662.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                                                                                    | 2      |
| 1663.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   | 0      |
| 1664.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   | 1      |
| 1665.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   | 2      |
| 1666.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    | 0      |
| 1667.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    | 1      |
| 1668.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    | 2      |
| 1669.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 0      |
| 1670.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 1      |
| 1671.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 2      |
| 1672.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 0      |
| 1673.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 1      |
| 1674.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 2      |
| 1675.  | H              | Br             | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 0      |
| 1676.  | H              | Br             | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 1      |
| 1677.  | H              | Br             | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 2      |
| 1678.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              |  | 0      |
| 1679.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              |  | 1      |
| 1680.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              |  | 2      |
| 1681.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              | H                                                                                     | 0      |
| 1682.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              | H                                                                                     | 1      |
| 1683.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              | H                                                                                     | 2      |
| 1684.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 0      |
| 1685.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 1      |
| 1686.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 2      |
| 1687.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SMe                                                                                   | 0      |
| 1688.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SMe                                                                                   | 1      |
| 1689.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SMe                                                                                   | 2      |
| 1690.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    | 0      |
| 1691.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                     | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|----------------------------------------------------|--------|
| 1692.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F | 2      |
| 1693.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 0      |
| 1694.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 1      |
| 1695.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 2      |
| 1696.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 0      |
| 1697.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 1      |
| 1698.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 2      |
| 1699.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 0      |
| 1700.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 1      |
| 1701.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 2      |
| 1702.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 0      |
| 1703.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 1      |
| 1704.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 2      |
| 1705.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 0      |
| 1706.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 1      |
| 1707.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 2      |
| 1708.  | H              | Br             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 0      |
| 1709.  | H              | Br             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 1      |
| 1710.  | H              | Br             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 2      |
| 1711.  | H              | Br             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 1712.  | H              | Br             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 1713.  | H              | Br             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 1714.  | H              | Br             | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 1715.  | H              | Br             | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 1716.  | H              | Br             | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 1717.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 1718.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 1719.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 1720.  | H              | Br             | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 0      |
| 1721.  | H              | Br             | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 1      |
| 1722.  | H              | Br             | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 2      |
| 1723.  | H              | Br             | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 0      |
| 1724.  | H              | Br             | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                  | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|------------------|------------------|-------------------|--------|
| 1725.  | H              | Br             | Br               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1726.  | H              | Br             | Br               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 0      |
| 1727.  | H              | Br             | Br               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 1      |
| 1728.  | H              | Br             | Br               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 2      |
| 1729.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                | 0      |
| 1730.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                | 1      |
| 1731.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                | 2      |
| 1732.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                | 0      |
| 1733.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                | 1      |
| 1734.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                | 2      |
| 1735.  | Me             | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   | 0      |
| 1736.  | Me             | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   | 1      |
| 1737.  | Me             | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   | 2      |
| 1738.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe               | 0      |
| 1739.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe               | 1      |
| 1740.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe               | 2      |
| 1741.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                | 0      |
| 1742.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                | 1      |
| 1743.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                | 2      |
| 1744.  | Me             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                | 0      |
| 1745.  | Me             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                | 1      |
| 1746.  | Me             | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                | 2      |
| 1747.  | Me             | H              | Me               | Me               | Me                | 0      |
| 1748.  | Me             | H              | Me               | Me               | Me                | 1      |
| 1749.  | Me             | H              | Me               | Me               | Me                | 2      |
| 1750.  | Me             | H              | Me               | Me               | Cl                | 0      |
| 1751.  | Me             | H              | Me               | Me               | Cl                | 1      |
| 1752.  | Me             | H              | Me               | Me               | Cl                | 2      |
| 1753.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl                | 0      |
| 1754.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl                | 1      |
| 1755.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | Cl                | 2      |
| 1756.  | Me             | H              | Cl               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 0      |
| 1757.  | Me             | H              | Cl               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 1      |

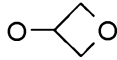
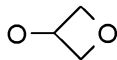
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|----------------|-----------------------------------|--------|
| 1758.  | Me             | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1759.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 0      |
| 1760.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 1      |
| 1761.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 2      |
| 1762.  | Me             | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1763.  | Me             | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1764.  | Me             | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1765.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 1766.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 1767.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 1768.  | Me             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1769.  | Me             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1770.  | Me             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1771.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1772.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1773.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1774.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 1775.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 1776.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 1777.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 0      |
| 1778.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 1      |
| 1779.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 2      |
| 1780.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 0      |
| 1781.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 1      |
| 1782.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 2      |
| 1783.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 0      |
| 1784.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 1      |
| 1785.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 2      |
| 1786.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | iPr            | Cl                                | 0      |
| 1787.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | iPr            | Cl                                | 1      |
| 1788.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | iPr            | Cl                                | 2      |
| 1789.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | tBu            | Cl                                | 0      |
| 1790.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | tBu            | Cl                                | 1      |

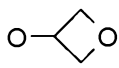
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 1791.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                             | Cl                                                                                    | 2      |
| 1792.  | Me             | H              | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       | 0      |
| 1793.  | Me             | H              | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       | 1      |
| 1794.  | Me             | H              | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       | 2      |
| 1795.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                                                                                    | 0      |
| 1796.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                                                                                    | 1      |
| 1797.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                                                                                    | 2      |
| 1798.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   | 0      |
| 1799.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   | 1      |
| 1800.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   | 2      |
| 1801.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    | 0      |
| 1802.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    | 1      |
| 1803.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    | 2      |
| 1804.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 0      |
| 1805.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 1      |
| 1806.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 2      |
| 1807.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 0      |
| 1808.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 1      |
| 1809.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 2      |
| 1810.  | Me             | H              | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 0      |
| 1811.  | Me             | H              | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 1      |
| 1812.  | Me             | H              | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 2      |
| 1813.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Me                              |  | 0      |
| 1814.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Me                              |  | 1      |
| 1815.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Me                              |  | 2      |
| 1816.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Me                              | H                                                                                     | 0      |
| 1817.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Me                              | H                                                                                     | 1      |
| 1818.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Me                              | H                                                                                     | 2      |
| 1819.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 0      |
| 1820.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                     | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|----------------------------------------------------|--------|
| 1821.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe               | 2      |
| 1822.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                | 0      |
| 1823.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                | 1      |
| 1824.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                | 2      |
| 1825.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F | 0      |
| 1826.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F | 1      |
| 1827.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F | 2      |
| 1828.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 0      |
| 1829.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 1      |
| 1830.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                | 2      |
| 1831.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 0      |
| 1832.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 1      |
| 1833.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>  | 2      |
| 1834.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 0      |
| 1835.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 1      |
| 1836.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                | 2      |
| 1837.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 0      |
| 1838.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 1      |
| 1839.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                             | 2      |
| 1840.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 0      |
| 1841.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 1      |
| 1842.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                           | 2      |
| 1843.  | Me             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 0      |
| 1844.  | Me             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 1      |
| 1845.  | Me             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                    | 2      |
| 1846.  | Me             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 1847.  | Me             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 1848.  | Me             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 1849.  | Me             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 1850.  | Me             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 1851.  | Me             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 1852.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 1853.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>    | $\eta$ |
|--------|-----------------|----------------|------------------|------------------|-------------------|--------|
| 1854.  | Me              | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CHF <sub>2</sub>  | 2      |
| 1855.  | Me              | H              | Cl               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1856.  | Me              | H              | Cl               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1857.  | Me              | H              | Cl               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1858.  | Me              | H              | Br               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1859.  | Me              | H              | Br               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1860.  | Me              | H              | Br               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1861.  | Me              | H              | Br               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 0      |
| 1862.  | Me              | H              | Br               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 1      |
| 1863.  | Me              | H              | Br               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 2      |
| 1864.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                | 0      |
| 1865.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                | 1      |
| 1866.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | tBu              | Cl                | 2      |
| 1867.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                | 0      |
| 1868.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                | 1      |
| 1869.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | CHF <sub>2</sub> | Cl                | 2      |
| 1870.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   | 0      |
| 1871.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   | 1      |
| 1872.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   | 2      |
| 1873.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe               | 0      |
| 1874.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe               | 1      |
| 1875.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | OMe               | 2      |
| 1876.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                | 0      |
| 1877.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                | 1      |
| 1878.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>  | Me               | CN                | 2      |
| 1879.  | NO <sub>2</sub> | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                | 0      |
| 1880.  | NO <sub>2</sub> | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                | 1      |
| 1881.  | NO <sub>2</sub> | H              | CHF <sub>2</sub> | Me               | Cl                | 2      |
| 1882.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me               | Me               | Me                | 0      |
| 1883.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me               | Me               | Me                | 1      |
| 1884.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me               | Me               | Me                | 2      |
| 1885.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me               | Me               | Cl                | 0      |
| 1886.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me               | Me               | Cl                | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|-----------------|----------------|-------------------|----------------|-----------------------------------|--------|
| 1887.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me                | Me             | Cl                                | 2      |
| 1888.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 0      |
| 1889.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 1      |
| 1890.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 2      |
| 1891.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1892.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1893.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1894.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 0      |
| 1895.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 1      |
| 1896.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 2      |
| 1897.  | NO <sub>2</sub> | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1898.  | NO <sub>2</sub> | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1899.  | NO <sub>2</sub> | H              | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1900.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 1901.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 1902.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 1903.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 1904.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 1905.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 1906.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1907.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1908.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1909.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 1910.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 1911.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 1912.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 0      |
| 1913.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 1      |
| 1914.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 2      |
| 1915.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 0      |
| 1916.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 1      |
| 1917.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Me             | SEt                               | 2      |
| 1918.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 0      |
| 1919.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>   | Et             | Cl                                | 1      |

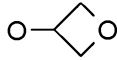
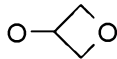
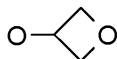
| Ex. N° | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        | $\eta$ |
|--------|-----------------|----------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 1920.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | Et                              | Cl                                                                                    | 2      |
| 1921.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                             | Cl                                                                                    | 0      |
| 1922.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                             | Cl                                                                                    | 1      |
| 1923.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                             | Cl                                                                                    | 2      |
| 1924.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                             | Cl                                                                                    | 0      |
| 1925.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                             | Cl                                                                                    | 1      |
| 1926.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                             | Cl                                                                                    | 2      |
| 1927.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       | 0      |
| 1928.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       | 1      |
| 1929.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       | 2      |
| 1930.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                                                                                    | 0      |
| 1931.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                                                                                    | 1      |
| 1932.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                                                                                    | 2      |
| 1933.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   | 0      |
| 1934.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   | 1      |
| 1935.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   | 2      |
| 1936.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    | 0      |
| 1937.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    | 1      |
| 1938.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    | 2      |
| 1939.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 0      |
| 1940.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 1      |
| 1941.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     | 2      |
| 1942.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 0      |
| 1943.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 1      |
| 1944.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                                                                                    | 2      |
| 1945.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 0      |
| 1946.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 1      |
| 1947.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      | 2      |
| 1948.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | Me                              |  | 0      |
| 1949.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub> | Me                              |  | 1      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                      | $\eta$ |
|--------|-----------------|----------------|----------------------------------|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 1950.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             |  | 2      |
| 1951.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | H                                                                                   | 0      |
| 1952.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | H                                                                                   | 1      |
| 1953.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | H                                                                                   | 2      |
| 1954.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 0      |
| 1955.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 1      |
| 1956.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 2      |
| 1957.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                                                 | 0      |
| 1958.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                                                 | 1      |
| 1959.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                                                 | 2      |
| 1960.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 0      |
| 1961.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 1      |
| 1962.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 2      |
| 1963.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 0      |
| 1964.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 1      |
| 1965.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 2      |
| 1966.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 1967.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 1968.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 1969.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 0      |
| 1970.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 1      |
| 1971.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 2      |
| 1972.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 0      |
| 1973.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 1      |
| 1974.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 2      |
| 1975.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            | 0      |
| 1976.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            | 1      |
| 1977.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            | 2      |
| 1978.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                                                     | 0      |
| 1979.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                                                     | 1      |
| 1980.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                                                     | 2      |
| 1981.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                                                    | 0      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>    | $\eta$ |
|--------|-----------------|----------------|----------------------------------|------------------|-------------------|--------|
| 1982.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>  | 1      |
| 1983.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>  | 2      |
| 1984.  | NO <sub>2</sub> | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>  | 0      |
| 1985.  | NO <sub>2</sub> | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>  | 1      |
| 1986.  | NO <sub>2</sub> | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>  | 2      |
| 1987.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>  | 0      |
| 1988.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>  | 1      |
| 1989.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>  | 2      |
| 1990.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1991.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1992.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1993.  | NO <sub>2</sub> | H              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 0      |
| 1994.  | NO <sub>2</sub> | H              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 1      |
| 1995.  | NO <sub>2</sub> | H              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub> | 2      |
| 1996.  | NO <sub>2</sub> | H              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 0      |
| 1997.  | NO <sub>2</sub> | H              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 1      |
| 1998.  | NO <sub>2</sub> | H              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>   | 2      |
| 1999.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                | 0      |
| 2000.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                | 1      |
| 2001.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                | 2      |
| 2002.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                | 0      |
| 2003.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                | 1      |
| 2004.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                | 2      |
| 2005.  | Cl              | Cl             | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   | 0      |
| 2006.  | Cl              | Cl             | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   | 1      |
| 2007.  | Cl              | Cl             | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   | 2      |
| 2008.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe               | 0      |
| 2009.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe               | 1      |
| 2010.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe               | 2      |
| 2011.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                | 0      |
| 2012.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                | 1      |
| 2013.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                | 2      |
| 2014.  | Cl              | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | Cl                | 0      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|----------------|-----------------------------------|--------|
| 2015.  | Cl             | Cl             | CHF <sub>2</sub>  | Me             | Cl                                | 1      |
| 2016.  | Cl             | Cl             | CHF <sub>2</sub>  | Me             | Cl                                | 2      |
| 2017.  | Cl             | Cl             | Me                | Me             | Me                                | 0      |
| 2018.  | Cl             | Cl             | Me                | Me             | Me                                | 1      |
| 2019.  | Cl             | Cl             | Me                | Me             | Me                                | 2      |
| 2020.  | Cl             | Cl             | Me                | Me             | Cl                                | 0      |
| 2021.  | Cl             | Cl             | Me                | Me             | Cl                                | 1      |
| 2022.  | Cl             | Cl             | Me                | Me             | Cl                                | 2      |
| 2023.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 0      |
| 2024.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 1      |
| 2025.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 2      |
| 2026.  | Cl             | Cl             | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 2027.  | Cl             | Cl             | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 2028.  | Cl             | Cl             | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 2029.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 0      |
| 2030.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 1      |
| 2031.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 2      |
| 2032.  | Cl             | Cl             | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 2033.  | Cl             | Cl             | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 2034.  | Cl             | Cl             | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 2035.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 2036.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 2037.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 2038.  | Cl             | Cl             | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 2039.  | Cl             | Cl             | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 2040.  | Cl             | Cl             | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 2041.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |
| 2042.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 2043.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 2044.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 2045.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 2046.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 2047.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me             | SO <sub>2</sub> Me                | 0      |

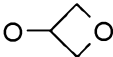
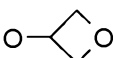
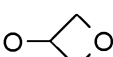
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                   | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------|----------------------------------|--------|
| 2048.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SO <sub>2</sub> Me               | 1      |
| 2049.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SO <sub>2</sub> Me               | 2      |
| 2050.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SEt                              | 0      |
| 2051.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SEt                              | 1      |
| 2052.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SEt                              | 2      |
| 2053.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Et                              | Cl                               | 0      |
| 2054.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Et                              | Cl                               | 1      |
| 2055.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Et                              | Cl                               | 2      |
| 2056.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | iPr                             | Cl                               | 0      |
| 2057.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | iPr                             | Cl                               | 1      |
| 2058.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | iPr                             | Cl                               | 2      |
| 2059.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | tBu                             | Cl                               | 0      |
| 2060.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | tBu                             | Cl                               | 1      |
| 2061.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | tBu                             | Cl                               | 2      |
| 2062.  | Cl             | Cl             | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                  | 0      |
| 2063.  | Cl             | Cl             | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                  | 1      |
| 2064.  | Cl             | Cl             | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                  | 2      |
| 2065.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                               | 0      |
| 2066.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                               | 1      |
| 2067.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                               | 2      |
| 2068.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                              | 0      |
| 2069.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                              | 1      |
| 2070.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                              | 2      |
| 2071.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                               | 0      |
| 2072.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                               | 1      |
| 2073.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                               | 2      |
| 2074.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                | 0      |
| 2075.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                | 1      |
| 2076.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                | 2      |
| 2077.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                               | 0      |
| 2078.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                               | 1      |
| 2079.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | Cl                               | 2      |
| 2080.  | Cl             | Cl             | Me              | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | 0      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                      | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 2081.  | Cl             | Cl             | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    | 1      |
| 2082.  | Cl             | Cl             | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    | 2      |
| 2083.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 0      |
| 2084.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 1      |
| 2085.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 2      |
| 2086.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                   | 0      |
| 2087.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                   | 1      |
| 2088.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                   | 2      |
| 2089.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 0      |
| 2090.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 1      |
| 2091.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                | 2      |
| 2092.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                 | 0      |
| 2093.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                 | 1      |
| 2094.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                 | 2      |
| 2095.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 0      |
| 2096.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 1      |
| 2097.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  | 2      |
| 2098.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 0      |
| 2099.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 1      |
| 2100.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 | 2      |
| 2101.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 0      |
| 2102.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 1      |
| 2103.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   | 2      |
| 2104.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 0      |
| 2105.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 1      |
| 2106.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 | 2      |
| 2107.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 0      |
| 2108.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 1      |
| 2109.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              | 2      |
| 2110.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            | 0      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>           | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|--------------------------|--------|
| 2111.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F | 1      |
| 2112.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F | 2      |
| 2113.  | Cl             | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>          | 0      |
| 2114.  | Cl             | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>          | 1      |
| 2115.  | Cl             | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>          | 2      |
| 2116.  | Cl             | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 0      |
| 2117.  | Cl             | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 1      |
| 2118.  | Cl             | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 2      |
| 2119.  | Cl             | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 0      |
| 2120.  | Cl             | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 1      |
| 2121.  | Cl             | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 2      |
| 2122.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 0      |
| 2123.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 1      |
| 2124.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>         | 2      |
| 2125.  | Cl             | Cl             | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 0      |
| 2126.  | Cl             | Cl             | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 1      |
| 2127.  | Cl             | Cl             | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 2      |
| 2128.  | Cl             | Cl             | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 0      |
| 2129.  | Cl             | Cl             | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 1      |
| 2130.  | Cl             | Cl             | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>        | 2      |
| 2131.  | Cl             | Cl             | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>          | 0      |
| 2132.  | Cl             | Cl             | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>          | 1      |
| 2133.  | Cl             | Cl             | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>          | 2      |
| 2134.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                       | 0      |
| 2135.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                       | 1      |
| 2136.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                       | 2      |
| 2137.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                       | 0      |
| 2138.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                       | 1      |
| 2139.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                       | 2      |
| 2140.  | Cl             | Me             | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>          | 0      |
| 2141.  | Cl             | Me             | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>          | 1      |
| 2142.  | Cl             | Me             | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>          | 2      |
| 2143.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe                      | 0      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-------------------|----------------|-----------------------------------|--------|
| 2144.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OMe                               | 1      |
| 2145.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OMe                               | 2      |
| 2146.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | CN                                | 0      |
| 2147.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | CN                                | 1      |
| 2148.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | CN                                | 2      |
| 2149.  | Cl             | Me             | CHF <sub>2</sub>  | Me             | Cl                                | 0      |
| 2150.  | Cl             | Me             | CHF <sub>2</sub>  | Me             | Cl                                | 1      |
| 2151.  | Cl             | Me             | CHF <sub>2</sub>  | Me             | Cl                                | 2      |
| 2152.  | Cl             | Me             | Me                | Me             | Me                                | 0      |
| 2153.  | Cl             | Me             | Me                | Me             | Me                                | 1      |
| 2154.  | Cl             | Me             | Me                | Me             | Me                                | 2      |
| 2155.  | Cl             | Me             | Me                | Me             | Cl                                | 0      |
| 2156.  | Cl             | Me             | Me                | Me             | Cl                                | 1      |
| 2157.  | Cl             | Me             | Me                | Me             | Cl                                | 2      |
| 2158.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 0      |
| 2159.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 1      |
| 2160.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | Cl                                | 2      |
| 2161.  | Cl             | Me             | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 2162.  | Cl             | Me             | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 2163.  | Cl             | Me             | Cl                | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 2164.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 0      |
| 2165.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 1      |
| 2166.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | F                                 | 2      |
| 2167.  | Cl             | Me             | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 2168.  | Cl             | Me             | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 2169.  | Cl             | Me             | OMe               | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 2170.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |
| 2171.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 1      |
| 2172.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCHF <sub>2</sub>                 | 2      |
| 2173.  | Cl             | Me             | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 2174.  | Cl             | Me             | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 2175.  | Cl             | Me             | OCHF <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 2176.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me             | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 0      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                    | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|---------------------------------|-----------------------------------|--------|
| 2177.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 1      |
| 2178.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> | 2      |
| 2179.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 0      |
| 2180.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 1      |
| 2181.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 2      |
| 2182.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                | 0      |
| 2183.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                | 1      |
| 2184.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                | 2      |
| 2185.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SEt                               | 0      |
| 2186.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SEt                               | 1      |
| 2187.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me                              | SEt                               | 2      |
| 2188.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Et                              | Cl                                | 0      |
| 2189.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Et                              | Cl                                | 1      |
| 2190.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Et                              | Cl                                | 2      |
| 2191.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | iPr                             | Cl                                | 0      |
| 2192.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | iPr                             | Cl                                | 1      |
| 2193.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | iPr                             | Cl                                | 2      |
| 2194.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | tBu                             | Cl                                | 0      |
| 2195.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | tBu                             | Cl                                | 1      |
| 2196.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | tBu                             | Cl                                | 2      |
| 2197.  | Cl             | Me             | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                   | 0      |
| 2198.  | Cl             | Me             | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                   | 1      |
| 2199.  | Cl             | Me             | Cl              | tBu                             | CF <sub>3</sub>                   | 2      |
| 2200.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                                | 0      |
| 2201.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                                | 1      |
| 2202.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | cPen                            | Cl                                | 2      |
| 2203.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                               | 0      |
| 2204.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                               | 1      |
| 2205.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                | OMe                               | 2      |
| 2206.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                | 0      |
| 2207.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                | 1      |
| 2208.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                | 2      |
| 2209.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                 | 0      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                       | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|-----------------|----------------|--------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| 2210.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                    | 1      |
| 2211.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Ph             | OCHF <sub>2</sub>                                                                    | 2      |
| 2212.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                                                                                   | 0      |
| 2213.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                                                                                   | 1      |
| 2214.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Ph             | Cl                                                                                   | 2      |
| 2215.  | Cl             | Me             | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                     | 0      |
| 2216.  | Cl             | Me             | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                     | 1      |
| 2217.  | Cl             | Me             | Me              | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                     | 2      |
| 2218.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             |   | 0      |
| 2219.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             |   | 1      |
| 2220.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             |  | 2      |
| 2221.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                    | 0      |
| 2222.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                    | 1      |
| 2223.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | H                                                                                    | 2      |
| 2224.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                 | 0      |
| 2225.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                 | 1      |
| 2226.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                 | 2      |
| 2227.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                  | 0      |
| 2228.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                  | 1      |
| 2229.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | SMe                                                                                  | 2      |
| 2230.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                   | 0      |
| 2231.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                   | 1      |
| 2232.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                   | 2      |
| 2233.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                  | 0      |
| 2234.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                  | 1      |
| 2235.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                  | 2      |
| 2236.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                    | 0      |
| 2237.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                    | 1      |
| 2238.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                    | 2      |
| 2239.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub> | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                  | 0      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                      | $\eta$ |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|-------------------------------------|--------|
| 2240.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub> | 1      |
| 2241.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub> | 2      |
| 2242.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>              | 0      |
| 2243.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>              | 1      |
| 2244.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>              | 2      |
| 2245.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F            | 0      |
| 2246.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F            | 1      |
| 2247.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F            | 2      |
| 2248.  | Cl             | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                     | 0      |
| 2249.  | Cl             | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                     | 1      |
| 2250.  | Cl             | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                     | 2      |
| 2251.  | Cl             | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                    | 0      |
| 2252.  | Cl             | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                    | 1      |
| 2253.  | Cl             | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                    | 2      |
| 2254.  | Cl             | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                    | 0      |
| 2255.  | Cl             | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                    | 1      |
| 2256.  | Cl             | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                    | 2      |
| 2257.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                    | 0      |
| 2258.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                    | 1      |
| 2259.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                    | 2      |
| 2260.  | Cl             | Me             | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                   | 0      |
| 2261.  | Cl             | Me             | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                   | 1      |
| 2262.  | Cl             | Me             | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                   | 2      |
| 2263.  | Cl             | Me             | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                   | 0      |
| 2264.  | Cl             | Me             | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                   | 1      |
| 2265.  | Cl             | Me             | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                   | 2      |
| 2266.  | Cl             | Me             | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                     | 0      |
| 2267.  | Cl             | Me             | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                     | 1      |
| 2268.  | Cl             | Me             | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                     | 2      |

[00387] Dados da ressonância magnética nuclear (RMN) de compostos selecionados da tabela 1:

[00388] 5-cloro-2-([5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfinil]-1,3-oxazol

[00389] composto n° 542: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,87 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,38 (d, 1H, S(O)CH<sub>2</sub>); 4,50 (d, 1H, S(O)CH<sub>2</sub>); 6,92 (dd, 1H, OCHF<sub>2</sub>); 7,16 (s, 1H).

[00390] 5-cloro-2-({[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfonil)-1,3-oxazol

[00391] composto n° 543: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,88 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,59 (s, 2H, S(O)<sub>2</sub>); 6,81 (t, 1H, OCHF<sub>2</sub>); 7,19 (s, 1H).

[00392] 5-bromo-2-({[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil)-1,3-oxazol

[00393] composto n° 788: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,85 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,38 (d, 1H, S(O)CH<sub>2</sub>); 4,49 (d, 1H, S(O)CH<sub>2</sub>); 6,91 (dd, 1H, OCHF<sub>2</sub>); 7,24 (s, 1H).

[00394] 5-bromo-2-({[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfonil)-1,3-oxazol

[00395] composto n° 789: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,88 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,59 (s, 2H, S(O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>); 6,81 (t, 1H, OCHF<sub>2</sub>); 7,28 (s, 1H).

[00396] 5-iodo-2-({[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil)-1,3-oxazol

[00397] composto n° 1034: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,85 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,37 (d, 1H, S(O)CH<sub>2</sub>); 4,48 (d, 1H, S(O)CH<sub>2</sub>); 6,92 (dd, 1H, OCHF<sub>2</sub>); 7,38 (s, 1H).

[00398] 5-iodo-2-({[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfonil)-1,3-oxazol

[00399] composto n° 1035: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,88 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,59 (s, 2H, S(O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>); 6,81 (t, 1H, OCHF<sub>2</sub>); 7,40 (s, 1H).

[00400] 2-({[5-(cloro)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil)-1,3-oxazol

[00401] composto n° 35: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 4,00 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,50 (br s, 2H, S(O)CH<sub>2</sub>); 7,36 (br d, 1H); 7,91 (br d, 1H).

[00402] 2-({[5-(cloro)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-

il]metil}sulfonil)-1,3-oxazol

[00403] composto n° 36: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,20 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,61 (s, 2H, S(O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>); 7,40 (br d, 1H); 7,89 (br d, 1H).

[00404] 2-([3-(difluormetil)-1-metil-5-(2,2,2-trifluoretóxi)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil)-1,3-oxazol

[00405] composto n° 242: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,75 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,41 (d, 1H, S(O) CH<sub>2</sub>); 4,51 (d, 1H, S(O) CH<sub>2</sub>); 4,74 (d x q, 1H); 4,78 (d x q, 1H); 6,57 (t, 1H); 7,39 (br d, 1H); 7,93 (br d, 1H).

[00406] 2-([1-metil-3,5-bis(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil)-1,3-oxazol

[00407] composto n° 230: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 4,09 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,55 (d, 1H, S(O) CH<sub>2</sub>); 4,66 (d, 1H, S(O) CH<sub>2</sub>); 7,36 (br d, 1H); 7,93 (br d, 1H).

[00408] 2-([3-(difluormetil)-1-metil-5-(2,2,2-trifluoretóxi)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfanil)-1,3-oxazol

[00409] composto n° 241: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,71 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,39 (s, 2H, SCH<sub>2</sub>); 4,63 (q, 2H); 5,60 (t, 1H); 7,11 (br d, 1H); 7,69 (br d, 1H).

[00410] 2-([3-(difluormetil)-1-metil-5-(2,2,2-trifluoretóxi)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfanil)-1,3-oxazol

[00411] composto n° 243: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,78 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,62 (s, 2H, S(O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>); 4,69 (q, 2H); 6,54 (t, 1H); 7,39 (br d, 1H); 7,89 (br d, 1H).

[00412] 2-([1-metil-3,5-bis(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfonil)-1,3-oxazol

[00413] composto n° 231: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 4,10 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,26 (s, 2H, S(O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>); 7,41 (br d, 1H); 7,89 (br d, 1H).

[00414] 2-([1-metil-3,5-bis(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfanil)-1,3-oxazol

[00415] composto n° 229: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 4,05 (s, 3H,

CH<sub>3</sub>); 4,43 (s, 2H, SCH<sub>2</sub>); 7,15 (br d, 1H); 7,69 (br d, 1H).

[00416] 2-([5-(difluormetil)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfanil)-1,3-oxazol

[00417] composto n° 217: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 4,02 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,33 (s, 2H, SCH<sub>2</sub>); 7,11 (br d, 1H); 7,31 (br d, 1H).

[00418] 2-([5-(difluormetil)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfinil)-1,3-oxazol

[00419] composto n° 218: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 4,10 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,51 (d, 1H, S(O)CH<sub>2</sub>); 4,56 (d, 1H, S(O)CH<sub>2</sub>); 6,97 (t, 1H); 7,38 (br d, 1H); 7,90 (br d, 1H).

[00420] 2-([5-(difluormetil)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfonil)-1,3-oxazol

[00421] composto n° 219: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 4,10 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,70 (s, 2H, S(O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>); 7,02 (t, 1H); 7,39 (br d, 1H); 7,88 (br d, 1H).

[00422] 2-([1-metil-5-(2,2,2-trifluoretóxi)-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfanil)-1,3-oxazol

[00423] composto n° 58: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,75 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,36 (s, 2H, SCH<sub>2</sub>); 4,67 (q, 2H); 7,12 (br d, 1H); 7,69 (br d, 1H).

[00424] 2-([1-metil-5-(2,2,2-trifluoretóxi)-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfinil)-1,3-oxazol

[00425] composto n° 59: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,80 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,31 (d, 1H, S(O)CH<sub>2</sub>); 4,52 (d, 1H, S(O)CH<sub>2</sub>); 4,76 (q, 1H); 4,78 (q, 1H); 7,40 (br d, 1H); 7,93 (br d, 1H).

[00426] 2-([1-metil-5-(2,2,2-trifluoretóxi)-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfonil)-1,3-oxazol

[00427] composto n° 60: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,82 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,60 (s, 2H, S(O)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>); 4,72 (q, 2H); 7,41 (br d, 1H); 7,90 (br d, 1H).

[00428] 4-cloro-2-([5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-

pirazol-4-il]metil}sulfanil)-1,3-oxazol

[00429] composto n° 1495: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,80 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,32 (s, 2H, SCH<sub>2</sub>); 6,76 (t, 1H); 7,61 (br d, 1H).

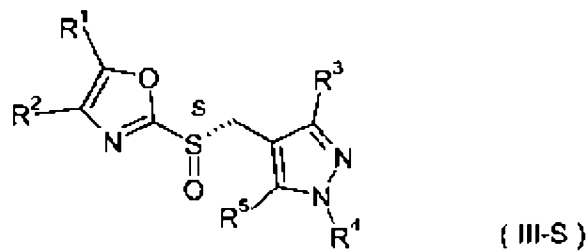
[00430] 4-cloro-2-({[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil)-1,3-oxazol

[00431] composto n° 1496: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 3,85 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,39 (d, 1H, S(O) CH<sub>2</sub>); 4,48 (d, 1H, S(O) CH<sub>2</sub>); 6,90 (dxt, 1H); 7,82 (br d, 1H).

[00432] 5-cloro-2-({[5-(difluormetóxi)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-il]metil}sulfinil)-4-metil-1,3-oxazol

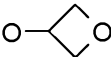
[00433] composto n° 2170: RMN (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 2,09 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 3,81 (s, 3H, CH<sub>3</sub>); 4,25 (s, 2H, SCH<sub>2</sub>); 6,74 (t, 1H).

Tabela 2: Compostos da Fórmula (III-S)

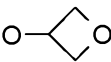


| Ex. Nº | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|------------------|-----------------------------------|
| 2269.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Ph               | Cl                                |
| 2270.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | tBu              | Cl                                |
| 2271.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub> | Cl                                |
| 2272.  | H              | H              | Cl                | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 2273.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OMe                               |
| 2274.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | CN                                |
| 2275.  | H              | H              | Cl                | Et               | Cl                                |
| 2276.  | H              | H              | CHF <sub>2</sub>  | Me               | Cl                                |
| 2277.  | H              | H              | Me                | Me               | Me                                |
| 2278.  | H              | H              | Me                | Me               | Cl                                |
| 2279.  | H              | H              | Cl                | Me               | Cl                                |
| 2280.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | Cl                                |
| 2281.  | H              | H              | Cl                | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2282.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | F                                 |
| 2283.  | H              | H              | OMe               | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2284.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OEt                               |
| 2285.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2286.  | H              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2287.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 2288.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 2289.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 2290.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | SO <sub>2</sub> Me                |
| 2291.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | SEt                               |
| 2292.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | Me                                |
| 2293.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | Et                                |
| 2294.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Et               | Cl                                |
| 2295.  | H              | H              | Cl                | Et               | CF <sub>3</sub>                   |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>                   |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|----------------------------------|
| 2296.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl                               |
| 2297.  | H              | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub>                  |
| 2298.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl                               |
| 2299.  | H              | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub>                  |
| 2300.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl                               |
| 2301.  | H              | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub>                  |
| 2302.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                               |
| 2303.  | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>                  |
| 2304.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                               |
| 2305.  | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  |
| 2306.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe                              |
| 2307.  | H              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>                  |
| 2308.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                               |
| 2309.  | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub>                  |
| 2310.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl                               |
| 2311.  | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub>                  |
| 2312.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl                               |
| 2313.  | H              | H              | Me              | Ph                                 | Me                               |
| 2314.  | H              | H              | Me              | Ph                                 | Cl                               |
| 2315.  | H              | H              | Et              | Ph                                 | Cl                               |
| 2316.  | H              | H              | Pr              | Ph                                 | Cl                               |
| 2317.  | H              | H              | iPr             | Ph                                 | Cl                               |
| 2318.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Cl                               |
| 2319.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Me                               |
| 2320.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CF <sub>3</sub>                  |
| 2321.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | F                                |
| 2322.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OMe                              |
| 2323.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OEt                              |
| 2324.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OCHF <sub>2</sub>                |
| 2325.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CN                               |
| 2326.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)                           | Cl                               |
| 2327.  | H              | H              | Me              | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> |

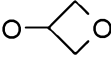
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 2328.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               |  |
| 2329.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | H                                                                                   |
| 2330.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 2331.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SMe                                                                                 |
| 2332.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 2333.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 2334.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 2335.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 2336.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 2337.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 2338.  | H              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2339.  | H              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2340.  | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2341.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2342.  | H              | H              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2343.  | H              | H              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2344.  | H              | H              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2345.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2346.  | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2347.  | H              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2348.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                     |
| 2349.  | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 2350.  | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2351.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph               | Cl                                                                                  |
| 2352.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                                                  |
| 2353.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                                                                                  |
| 2354.  | F              | H              | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2355.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe                                                                                 |
| 2356.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                                                                                  |
| 2357.  | F              | H              | Cl                               | Et               | Cl                                                                                  |
| 2358.  | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | Cl                                                                                  |
| 2359.  | F              | H              | Me                               | Me               | Me                                                                                  |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|------------------------------------|-----------------------------------|
| 2360.  | F              | H              | Me                | Me                                 | Cl                                |
| 2361.  | F              | H              | Cl                | Me                                 | Cl                                |
| 2362.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Cl                                |
| 2363.  | F              | H              | Cl                | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2364.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | F                                 |
| 2365.  | F              | H              | OMe               | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2366.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OEt                               |
| 2367.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2368.  | F              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2369.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 2370.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 2371.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 2372.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SO <sub>2</sub> Me                |
| 2373.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SEt                               |
| 2374.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Me                                |
| 2375.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Et                                |
| 2376.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Et                                 | Cl                                |
| 2377.  | F              | H              | Cl                | Et                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2378.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | iPr                                | Cl                                |
| 2379.  | F              | H              | Cl                | iPr                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 2380.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | tBu                                | Cl                                |
| 2381.  | F              | H              | Cl                | tBu                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 2382.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | cPen                               | Cl                                |
| 2383.  | F              | H              | Cl                | cPen                               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2384.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                                |
| 2385.  | F              | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>                   |
| 2386.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                                |
| 2387.  | F              | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 2388.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                   | OMe                               |
| 2389.  | F              | H              | OMe               | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>                   |
| 2390.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                                |
| 2391.  | F              | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub>                   |
| 2392.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl                                |

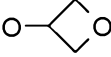
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>      | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|---------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 2393.  | F              | H              | Cl                               | CH <sub>2</sub> OMe | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2394.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CN  | Cl                                                                                    |
| 2395.  | F              | H              | Me                               | Ph                  | Me                                                                                    |
| 2396.  | F              | H              | Me                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 2397.  | F              | H              | Et                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 2398.  | F              | H              | Pr                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 2399.  | F              | H              | iPr                              | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 2400.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 2401.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | Me                                                                                    |
| 2402.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2403.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | F                                                                                     |
| 2404.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OMe                                                                                   |
| 2405.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OEt                                                                                   |
| 2406.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 2407.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | CN                                                                                    |
| 2408.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph(4-Cl)            | Cl                                                                                    |
| 2409.  | F              | H              | Me                               | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 2410.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  |  |
| 2411.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | H                                                                                     |
| 2412.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 2413.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | SMe                                                                                   |
| 2414.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 2415.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |
| 2416.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     |
| 2417.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                   |
| 2418.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                                |
| 2419.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                              |
| 2420.  | F              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                  | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2421.  | F              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 2422.  | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 2423.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 2424.  | F              | H              | Cl                               | Me                  | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                  | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|---------------------------------|------------------|-----------------------------------|
| 2425.  | F              | H              | Br                              | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2426.  | F              | H              | Br                              | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2427.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2428.  | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2429.  | F              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2430.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   |
| 2431.  | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 2432.  | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2433.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                                |
| 2434.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                                |
| 2435.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                                |
| 2436.  | Cl             | H              | Cl                              | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 2437.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OMe                               |
| 2438.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CN                                |
| 2439.  | Cl             | H              | Cl                              | Et               | Cl                                |
| 2440.  | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | Cl                                |
| 2441.  | Cl             | H              | Me                              | Me               | Me                                |
| 2442.  | Cl             | H              | Me                              | Me               | Cl                                |
| 2443.  | Cl             | H              | Cl                              | Me               | Cl                                |
| 2444.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | Cl                                |
| 2445.  | Cl             | H              | Cl                              | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2446.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | F                                 |
| 2447.  | Cl             | H              | OMe                             | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2448.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OEt                               |
| 2449.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2450.  | Cl             | H              | OCHF <sub>2</sub>               | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2451.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 2452.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 2453.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 2454.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | SO <sub>2</sub> Me                |
| 2455.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | SEt                               |
| 2456.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | Me                                |
| 2457.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | Et                                |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>    |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-------------------|
| 2458.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Et                                 | Cl                |
| 2459.  | Cl             | H              | Cl              | Et                                 | CF <sub>3</sub>   |
| 2460.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl                |
| 2461.  | Cl             | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub>   |
| 2462.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl                |
| 2463.  | Cl             | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub>   |
| 2464.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl                |
| 2465.  | Cl             | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub>   |
| 2466.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                |
| 2467.  | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>   |
| 2468.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                |
| 2469.  | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   |
| 2470.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe               |
| 2471.  | Cl             | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>   |
| 2472.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                |
| 2473.  | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub>   |
| 2474.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl                |
| 2475.  | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub>   |
| 2476.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl                |
| 2477.  | Cl             | H              | Me              | Ph                                 | Me                |
| 2478.  | Cl             | H              | Me              | Ph                                 | Cl                |
| 2479.  | Cl             | H              | Et              | Ph                                 | Cl                |
| 2480.  | Cl             | H              | Pr              | Ph                                 | Cl                |
| 2481.  | Cl             | H              | iPr             | Ph                                 | Cl                |
| 2482.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Cl                |
| 2483.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Me                |
| 2484.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CF <sub>3</sub>   |
| 2485.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | F                 |
| 2486.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OMe               |
| 2487.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OEt               |
| 2488.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OCHF <sub>2</sub> |
| 2489.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CN                |
| 2490.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)                           | Cl                |

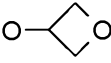
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 2491.  | Cl             | H              | Me                               | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 2492.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               |  |
| 2493.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | H                                                                                   |
| 2494.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 2495.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SMe                                                                                 |
| 2496.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 2497.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 2498.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 2499.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 2500.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 2501.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 2502.  | Cl             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2503.  | Cl             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2504.  | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2505.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2506.  | Cl             | H              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2507.  | Cl             | H              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2508.  | Cl             | H              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2509.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2510.  | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2511.  | Cl             | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2512.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                     |
| 2513.  | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 2514.  | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2515.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph               | Cl                                                                                  |
| 2516.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                                                  |
| 2517.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                                                                                  |
| 2518.  | Br             | H              | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2519.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe                                                                                 |
| 2520.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                                                                                  |
| 2521.  | Br             | H              | Cl                               | Et               | Cl                                                                                  |
| 2522.  | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | Cl                                                                                  |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|------------------------------------|-----------------------------------|
| 2523.  | Br             | H              | Me                | Me                                 | Me                                |
| 2524.  | Br             | H              | Me                | Me                                 | Cl                                |
| 2525.  | Br             | H              | Cl                | Me                                 | Cl                                |
| 2526.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Cl                                |
| 2527.  | Br             | H              | Cl                | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2528.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | F                                 |
| 2529.  | Br             | H              | OMe               | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2530.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OEt                               |
| 2531.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2532.  | Br             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2533.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 2534.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 2535.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 2536.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SO <sub>2</sub> Me                |
| 2537.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SEt                               |
| 2538.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Me                                |
| 2539.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Et                                |
| 2540.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Et                                 | Cl                                |
| 2541.  | Br             | H              | Cl                | Et                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2542.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | iPr                                | Cl                                |
| 2543.  | Br             | H              | Cl                | iPr                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 2544.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | tBu                                | Cl                                |
| 2545.  | Br             | H              | Cl                | tBu                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 2546.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | cPen                               | Cl                                |
| 2547.  | Br             | H              | Cl                | cPen                               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2548.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                                |
| 2549.  | Br             | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>                   |
| 2550.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                                |
| 2551.  | Br             | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 2552.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                   | OMe                               |
| 2553.  | Br             | H              | OMe               | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>                   |
| 2554.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                                |
| 2555.  | Br             | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub>                   |

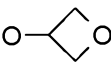
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>      | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|---------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 2556.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> OMe | Cl                                                                                    |
| 2557.  | Br             | H              | Cl                               | CH <sub>2</sub> OMe | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2558.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CN  | Cl                                                                                    |
| 2559.  | Br             | H              | Me                               | Ph                  | Me                                                                                    |
| 2560.  | Br             | H              | Me                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 2561.  | Br             | H              | Et                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 2562.  | Br             | H              | Pr                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 2563.  | Br             | H              | iPr                              | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 2564.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 2565.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | Me                                                                                    |
| 2566.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2567.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | F                                                                                     |
| 2568.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OMe                                                                                   |
| 2569.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OEt                                                                                   |
| 2570.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 2571.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | CN                                                                                    |
| 2572.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph(4-Cl)            | Cl                                                                                    |
| 2573.  | Br             | H              | Me                               | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 2574.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  |  |
| 2575.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | H                                                                                     |
| 2576.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 2577.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | SMe                                                                                   |
| 2578.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 2579.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |
| 2580.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     |
| 2581.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                   |
| 2582.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                                |
| 2583.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                              |
| 2584.  | Br             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                  | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2585.  | Br             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 2586.  | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 2587.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                  | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|---------------------------------|------------------|-----------------------------------|
| 2588.  | Br             | H              | Cl                              | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2589.  | Br             | H              | Br                              | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2590.  | Br             | H              | Br                              | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2591.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2592.  | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2593.  | Br             | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2594.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   |
| 2595.  | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 2596.  | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2597.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                                |
| 2598.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                                |
| 2599.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                                |
| 2600.  | I              | H              | Cl                              | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 2601.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OMe                               |
| 2602.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CN                                |
| 2603.  | I              | H              | Cl                              | Et               | Cl                                |
| 2604.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | Cl                                |
| 2605.  | I              | H              | Me                              | Me               | Me                                |
| 2606.  | I              | H              | Me                              | Me               | Cl                                |
| 2607.  | I              | H              | Cl                              | Me               | Cl                                |
| 2608.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | Cl                                |
| 2609.  | I              | H              | Cl                              | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2610.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | F                                 |
| 2611.  | I              | H              | OMe                             | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2612.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OEt                               |
| 2613.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2614.  | I              | H              | OCHF <sub>2</sub>               | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2615.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 2616.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 2617.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 2618.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | SO <sub>2</sub> Me                |
| 2619.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | SEt                               |
| 2620.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | Me                                |

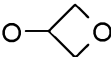
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>    |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-------------------|
| 2621.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me                                 | Et                |
| 2622.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Et                                 | Cl                |
| 2623.  | I              | H              | Cl              | Et                                 | CF <sub>3</sub>   |
| 2624.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl                |
| 2625.  | I              | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub>   |
| 2626.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl                |
| 2627.  | I              | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub>   |
| 2628.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl                |
| 2629.  | I              | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub>   |
| 2630.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                |
| 2631.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>   |
| 2632.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                |
| 2633.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   |
| 2634.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe               |
| 2635.  | I              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>   |
| 2636.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                |
| 2637.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub>   |
| 2638.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl                |
| 2639.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub>   |
| 2640.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl                |
| 2641.  | I              | H              | Me              | Ph                                 | Me                |
| 2642.  | I              | H              | Me              | Ph                                 | Cl                |
| 2643.  | I              | H              | Et              | Ph                                 | Cl                |
| 2644.  | I              | H              | Pr              | Ph                                 | Cl                |
| 2645.  | I              | H              | iPr             | Ph                                 | Cl                |
| 2646.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Cl                |
| 2647.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Me                |
| 2648.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CF <sub>3</sub>   |
| 2649.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | F                 |
| 2650.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OMe               |
| 2651.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OEt               |
| 2652.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OCHF <sub>2</sub> |
| 2653.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CN                |

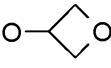
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 2654.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph(4-Cl)         | Cl                                                                                  |
| 2655.  | I              | H              | Me                               | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 2656.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               |  |
| 2657.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | H                                                                                   |
| 2658.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 2659.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SMe                                                                                 |
| 2660.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 2661.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 2662.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 2663.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 2664.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 2665.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 2666.  | I              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2667.  | I              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2668.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2669.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2670.  | I              | H              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2671.  | I              | H              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2672.  | I              | H              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2673.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2674.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2675.  | I              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2676.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                     |
| 2677.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 2678.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2679.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph               | Cl                                                                                  |
| 2680.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                                                  |
| 2681.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                                                                                  |
| 2682.  | H              | F              | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2683.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe                                                                                 |
| 2684.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                                                                                  |
| 2685.  | H              | F              | Cl                               | Et               | Cl                                                                                  |

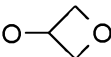
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|------------------------------------|-----------------------------------|
| 2686.  | H              | F              | CHF <sub>2</sub>  | Me                                 | Cl                                |
| 2687.  | H              | F              | Me                | Me                                 | Me                                |
| 2688.  | H              | F              | Me                | Me                                 | Cl                                |
| 2689.  | H              | F              | Cl                | Me                                 | Cl                                |
| 2690.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Cl                                |
| 2691.  | H              | F              | Cl                | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2692.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | F                                 |
| 2693.  | H              | F              | OMe               | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2694.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OEt                               |
| 2695.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2696.  | H              | F              | OCHF <sub>2</sub> | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2697.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 2698.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 2699.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 2700.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SO <sub>2</sub> Me                |
| 2701.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SEt                               |
| 2702.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Me                                |
| 2703.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Et                                |
| 2704.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Et                                 | Cl                                |
| 2705.  | H              | F              | Cl                | Et                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 2706.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | iPr                                | Cl                                |
| 2707.  | H              | F              | Cl                | iPr                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 2708.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | tBu                                | Cl                                |
| 2709.  | H              | F              | Cl                | tBu                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 2710.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | cPen                               | Cl                                |
| 2711.  | H              | F              | Cl                | cPen                               | CF <sub>3</sub>                   |
| 2712.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                                |
| 2713.  | H              | F              | Cl                | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>                   |
| 2714.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                                |
| 2715.  | H              | F              | Cl                | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 2716.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                   | OMe                               |
| 2717.  | H              | F              | OMe               | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>                   |
| 2718.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                                |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 2719.  | H              | F              | Cl                               | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2720.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> OMe             | Cl                                                                                    |
| 2721.  | H              | F              | Cl                               | CH <sub>2</sub> OMe             | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2722.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CN              | Cl                                                                                    |
| 2723.  | H              | F              | Me                               | Ph                              | Me                                                                                    |
| 2724.  | H              | F              | Me                               | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 2725.  | H              | F              | Et                               | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 2726.  | H              | F              | Pr                               | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 2727.  | H              | F              | iPr                              | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 2728.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 2729.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | Me                                                                                    |
| 2730.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2731.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | F                                                                                     |
| 2732.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OMe                                                                                   |
| 2733.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OEt                                                                                   |
| 2734.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 2735.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | CN                                                                                    |
| 2736.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph(4-Cl)                        | Cl                                                                                    |
| 2737.  | H              | F              | Me                               | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 2738.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              |  |
| 2739.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | H                                                                                     |
| 2740.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 2741.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SMe                                                                                   |
| 2742.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 2743.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |
| 2744.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     |
| 2745.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                   |
| 2746.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                                |
| 2747.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                              |
| 2748.  | H              | F              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2749.  | H              | F              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 2750.  | H              | F              | CHF <sub>2</sub>                 | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |

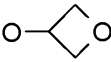
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|---------------------------------|-----------------------------------|
| 2751.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | CHF <sub>2</sub>                  |
| 2752.  | H              | F              | Cl                | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2753.  | H              | F              | Br                | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2754.  | H              | F              | Br                | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 2755.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                |
| 2756.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | Cl                                |
| 2757.  | H              | Cl             | Cl                | CHF <sub>2</sub>                | CF <sub>3</sub>                   |
| 2758.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OMe                               |
| 2759.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | CN                                |
| 2760.  | H              | Cl             | CHF <sub>2</sub>  | Me                              | Cl                                |
| 2761.  | H              | Cl             | Me                | Me                              | Me                                |
| 2762.  | H              | Cl             | Me                | Me                              | Cl                                |
| 2763.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | Cl                                |
| 2764.  | H              | Cl             | Cl                | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 2765.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | F                                 |
| 2766.  | H              | Cl             | OMe               | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 2767.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2768.  | H              | Cl             | OCHF <sub>2</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 2769.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 2770.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 2771.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                |
| 2772.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SEt                               |
| 2773.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Et                              | Cl                                |
| 2774.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | iPr                             | Cl                                |
| 2775.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                |
| 2776.  | H              | Cl             | Cl                | tBu                             | CF <sub>3</sub>                   |
| 2777.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | cPen                            | Cl                                |
| 2778.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | OMe                               |
| 2779.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                |
| 2780.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2781.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | Cl                                |
| 2782.  | H              | Cl             | Me                | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |

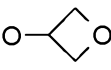
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 2783.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               |  |
| 2784.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | H                                                                                   |
| 2785.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 2786.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SMe                                                                                 |
| 2787.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 2788.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 2789.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 2790.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 2791.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 2792.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 2793.  | H              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2794.  | H              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2795.  | H              | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2796.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2797.  | H              | Cl             | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2798.  | H              | Cl             | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2799.  | H              | Cl             | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2800.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                                                  |
| 2801.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                                                                                  |
| 2802.  | H              | Br             | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2803.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe                                                                                 |
| 2804.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                                                                                  |
| 2805.  | H              | Br             | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | Cl                                                                                  |
| 2806.  | H              | Br             | Me                               | Me               | Me                                                                                  |
| 2807.  | H              | Br             | Me                               | Me               | Cl                                                                                  |
| 2808.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | Cl                                                                                  |
| 2809.  | H              | Br             | Cl                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2810.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | F                                                                                   |
| 2811.  | H              | Br             | OMe                              | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2812.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2813.  | H              | Br             | OCHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2814.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                                   |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 2815.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 2816.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                                                                    |
| 2817.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SEt                                                                                   |
| 2818.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Et                              | Cl                                                                                    |
| 2819.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | iPr                             | Cl                                                                                    |
| 2820.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | tBu                             | Cl                                                                                    |
| 2821.  | H              | Br             | Cl                               | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2822.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | cPen                            | Cl                                                                                    |
| 2823.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   |
| 2824.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    |
| 2825.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 2826.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 2827.  | H              | Br             | Me                               | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 2828.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              |  |
| 2829.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | H                                                                                     |
| 2830.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 2831.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SMe                                                                                   |
| 2832.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 2833.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |
| 2834.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     |
| 2835.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                   |
| 2836.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                                |
| 2837.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                              |
| 2838.  | H              | Br             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2839.  | H              | Br             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 2840.  | H              | Br             | CHF <sub>2</sub>                 | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 2841.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 2842.  | H              | Br             | Cl                               | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 2843.  | H              | Br             | Br                               | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 2844.  | H              | Br             | Br                               | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2845.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | tBu                             | Cl                                                                                    |
| 2846.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub>                | Cl                                                                                    |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|-------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 2847.  | Me             | H              | Cl                | CHF <sub>2</sub>                | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2848.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OMe                                                                                   |
| 2849.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | CN                                                                                    |
| 2850.  | Me             | H              | CHF <sub>2</sub>  | Me                              | Cl                                                                                    |
| 2851.  | Me             | H              | Me                | Me                              | Me                                                                                    |
| 2852.  | Me             | H              | Me                | Me                              | Cl                                                                                    |
| 2853.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | Cl                                                                                    |
| 2854.  | Me             | H              | Cl                | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2855.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | F                                                                                     |
| 2856.  | Me             | H              | OMe               | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2857.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 2858.  | Me             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2859.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                                     |
| 2860.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 2861.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                                                                    |
| 2862.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SEt                                                                                   |
| 2863.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Et                              | Cl                                                                                    |
| 2864.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | iPr                             | Cl                                                                                    |
| 2865.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                                                                    |
| 2866.  | Me             | H              | Cl                | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2867.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | cPen                            | Cl                                                                                    |
| 2868.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   |
| 2869.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    |
| 2870.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 2871.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 2872.  | Me             | H              | Me                | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 2873.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              |  |
| 2874.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | H                                                                                     |
| 2875.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 2876.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SMe                                                                                   |
| 2877.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 2878.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |

| Ex. N° | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                    |
|--------|-----------------|----------------|----------------------------------|------------------|---------------------------------------------------|
| 2879.  | Me              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 2880.  | Me              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>               |
| 2881.  | Me              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                            |
| 2882.  | Me              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                          |
| 2883.  | Me              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                                   |
| 2884.  | Me              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>                                  |
| 2885.  | Me              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>                                  |
| 2886.  | Me              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>                                  |
| 2887.  | Me              | H              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                 |
| 2888.  | Me              | H              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                 |
| 2889.  | Me              | H              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                   |
| 2890.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                |
| 2891.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                                                |
| 2892.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                                   |
| 2893.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe                                               |
| 2894.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                                                |
| 2895.  | NO <sub>2</sub> | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | Cl                                                |
| 2896.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me                               | Me               | Me                                                |
| 2897.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me                               | Me               | Cl                                                |
| 2898.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | Cl                                                |
| 2899.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                   |
| 2900.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | F                                                 |
| 2901.  | NO <sub>2</sub> | H              | OMe                              | Me               | CF <sub>3</sub>                                   |
| 2902.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                 |
| 2903.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                                   |
| 2904.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                 |
| 2905.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                  |
| 2906.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SO <sub>2</sub> Me                                |
| 2907.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SEt                                               |
| 2908.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Et               | Cl                                                |
| 2909.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | iPr              | Cl                                                |
| 2910.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                |
| 2911.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                               | tBu              | CF <sub>3</sub>                                   |

| Ex. N° | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|-----------------|----------------|----------------------------------|---------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 2912.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | cPen                            | Cl                                                                                  |
| 2913.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                 |
| 2914.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                  |
| 2915.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2916.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | Cl                                                                                  |
| 2917.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me                               | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 2918.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              |  |
| 2919.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | H                                                                                   |
| 2920.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 2921.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SMe                                                                                 |
| 2922.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 2923.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 2924.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 2925.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 2926.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 2927.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 2928.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2929.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2930.  | NO <sub>2</sub> | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2931.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 2932.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                               | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2933.  | NO <sub>2</sub> | H              | Br                               | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 2934.  | NO <sub>2</sub> | H              | Br                               | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2935.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | tBu                             | Cl                                                                                  |
| 2936.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub>                | Cl                                                                                  |
| 2937.  | Cl              | Cl             | Cl                               | CHF <sub>2</sub>                | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 2938.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OMe                                                                                 |
| 2939.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | CN                                                                                  |
| 2940.  | Cl              | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me                              | Cl                                                                                  |
| 2941.  | Cl              | Cl             | Me                               | Me                              | Me                                                                                  |
| 2942.  | Cl              | Cl             | Me                               | Me                              | Cl                                                                                  |
| 2943.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | Cl                                                                                  |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 2944.  | Cl             | Cl             | Cl                               | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2945.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | F                                                                                     |
| 2946.  | Cl             | Cl             | OMe                              | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2947.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 2948.  | Cl             | Cl             | OCHF <sub>2</sub>                | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2949.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                                     |
| 2950.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 2951.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                                                                    |
| 2952.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SEt                                                                                   |
| 2953.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Et                              | Cl                                                                                    |
| 2954.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | iPr                             | Cl                                                                                    |
| 2955.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | tBu                             | Cl                                                                                    |
| 2956.  | Cl             | Cl             | Cl                               | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2957.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | cPen                            | Cl                                                                                    |
| 2958.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   |
| 2959.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    |
| 2960.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 2961.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 2962.  | Cl             | Cl             | Me                               | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 2963.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              |  |
| 2964.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | H                                                                                     |
| 2965.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 2966.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SMe                                                                                   |
| 2967.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 2968.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |
| 2969.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     |
| 2970.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                   |
| 2971.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                                |
| 2972.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                              |
| 2973.  | Cl             | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 2974.  | Cl             | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 2975.  | Cl             | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|---------------------------------|-----------------------------------|
| 2976.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | CHF <sub>2</sub>                  |
| 2977.  | Cl             | Cl             | Cl                | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2978.  | Cl             | Cl             | Br                | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2979.  | Cl             | Cl             | Br                | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 2980.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                |
| 2981.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | Cl                                |
| 2982.  | Cl             | Me             | Cl                | CHF <sub>2</sub>                | CF <sub>3</sub>                   |
| 2983.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OMe                               |
| 2984.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | CN                                |
| 2985.  | Cl             | Me             | CHF <sub>2</sub>  | Me                              | Cl                                |
| 2986.  | Cl             | Me             | Me                | Me                              | Me                                |
| 2987.  | Cl             | Me             | Me                | Me                              | Cl                                |
| 2988.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | Cl                                |
| 2989.  | Cl             | Me             | Cl                | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 2990.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | F                                 |
| 2991.  | Cl             | Me             | OMe               | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 2992.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 2993.  | Cl             | Me             | OCHF <sub>2</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 2994.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 2995.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 2996.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                |
| 2997.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SEt                               |
| 2998.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Et                              | Cl                                |
| 2999.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | iPr                             | Cl                                |
| 3000.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                |
| 3001.  | Cl             | Me             | Cl                | tBu                             | CF <sub>3</sub>                   |
| 3002.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | cPen                            | Cl                                |
| 3003.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | OMe                               |
| 3004.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                |
| 3005.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3006.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | Cl                                |
| 3007.  | Cl             | Me             | Me                | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |

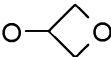
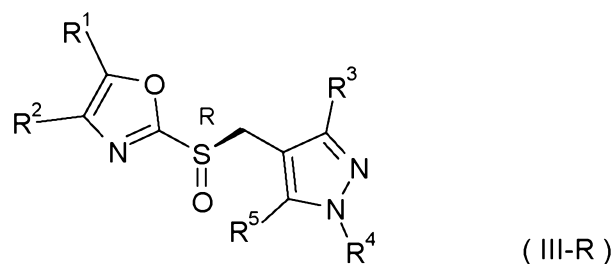
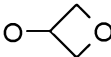
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 3008.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             |  |
| 3009.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | H                                                                                   |
| 3010.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 3011.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                                                 |
| 3012.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 3013.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 3014.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 3015.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 3016.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 3017.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 3018.  | Cl             | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3019.  | Cl             | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3020.  | Cl             | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3021.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3022.  | Cl             | Me             | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3023.  | Cl             | Me             | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3024.  | Cl             | Me             | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                                                                     |

Tabela 3: Compostos da Fórmula (III-R)

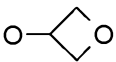


| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|------------------|-----------------------------------|
| 3025.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Ph               | Cl                                |
| 3026.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | tBu              | Cl                                |
| 3027.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub> | Cl                                |
| 3028.  | H              | H              | Cl                | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 3029.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OMe                               |
| 3030.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | CN                                |
| 3031.  | H              | H              | Cl                | Et               | Cl                                |
| 3032.  | H              | H              | CHF <sub>2</sub>  | Me               | Cl                                |
| 3033.  | H              | H              | Me                | Me               | Me                                |
| 3034.  | H              | H              | Me                | Me               | Cl                                |
| 3035.  | H              | H              | Cl                | Me               | Cl                                |
| 3036.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | Cl                                |
| 3037.  | H              | H              | Cl                | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3038.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | F                                 |
| 3039.  | H              | H              | OMe               | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3040.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OEt                               |
| 3041.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3042.  | H              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3043.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 3044.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 3045.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 3046.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | SO <sub>2</sub> Me                |
| 3047.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | SEt                               |
| 3048.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | Me                                |
| 3049.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me               | Et                                |
| 3050.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>   | Et               | Cl                                |
| 3051.  | H              | H              | Cl                | Et               | CF <sub>3</sub>                   |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>                   |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|----------------------------------|
| 3052.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl                               |
| 3053.  | H              | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub>                  |
| 3054.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl                               |
| 3055.  | H              | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub>                  |
| 3056.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl                               |
| 3057.  | H              | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub>                  |
| 3058.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                               |
| 3059.  | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>                  |
| 3060.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                               |
| 3061.  | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                  |
| 3062.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe                              |
| 3063.  | H              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>                  |
| 3064.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                               |
| 3065.  | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub>                  |
| 3066.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl                               |
| 3067.  | H              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub>                  |
| 3068.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl                               |
| 3069.  | H              | H              | Me              | Ph                                 | Me                               |
| 3070.  | H              | H              | Me              | Ph                                 | Cl                               |
| 3071.  | H              | H              | Et              | Ph                                 | Cl                               |
| 3072.  | H              | H              | Pr              | Ph                                 | Cl                               |
| 3073.  | H              | H              | iPr             | Ph                                 | Cl                               |
| 3074.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Cl                               |
| 3075.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Me                               |
| 3076.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CF <sub>3</sub>                  |
| 3077.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | F                                |
| 3078.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OMe                              |
| 3079.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OEt                              |
| 3080.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OCHF <sub>2</sub>                |
| 3081.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CN                               |
| 3082.  | H              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)                           | Cl                               |
| 3083.  | H              | H              | Me              | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> |

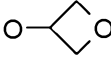
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 3084.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               |  |
| 3085.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | H                                                                                   |
| 3086.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 3087.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SMe                                                                                 |
| 3088.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 3089.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 3090.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 3091.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 3092.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 3093.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 3094.  | H              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3095.  | H              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3096.  | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3097.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3098.  | H              | H              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3099.  | H              | H              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3100.  | H              | H              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3101.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3102.  | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3103.  | H              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3104.  | H              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                     |
| 3105.  | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 3106.  | H              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3107.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph               | Cl                                                                                  |
| 3108.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                                                  |
| 3109.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                                                                                  |
| 3110.  | F              | H              | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3111.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe                                                                                 |
| 3112.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                                                                                  |
| 3113.  | F              | H              | Cl                               | Et               | Cl                                                                                  |
| 3114.  | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | Cl                                                                                  |
| 3115.  | F              | H              | Me                               | Me               | Me                                                                                  |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|------------------------------------|-----------------------------------|
| 3116.  | F              | H              | Me                | Me                                 | Cl                                |
| 3117.  | F              | H              | Cl                | Me                                 | Cl                                |
| 3118.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Cl                                |
| 3119.  | F              | H              | Cl                | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3120.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | F                                 |
| 3121.  | F              | H              | OMe               | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3122.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OEt                               |
| 3123.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3124.  | F              | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3125.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 3126.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 3127.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 3128.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SO <sub>2</sub> Me                |
| 3129.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SEt                               |
| 3130.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Me                                |
| 3131.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Et                                |
| 3132.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | Et                                 | Cl                                |
| 3133.  | F              | H              | Cl                | Et                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3134.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | iPr                                | Cl                                |
| 3135.  | F              | H              | Cl                | iPr                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 3136.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | tBu                                | Cl                                |
| 3137.  | F              | H              | Cl                | tBu                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 3138.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | cPen                               | Cl                                |
| 3139.  | F              | H              | Cl                | cPen                               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3140.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                                |
| 3141.  | F              | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>                   |
| 3142.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                                |
| 3143.  | F              | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 3144.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                   | OMe                               |
| 3145.  | F              | H              | OMe               | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>                   |
| 3146.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                                |
| 3147.  | F              | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub>                   |
| 3148.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl                                |

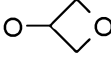
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>      | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|---------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 3149.  | F              | H              | Cl                               | CH <sub>2</sub> OMe | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3150.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CN  | Cl                                                                                    |
| 3151.  | F              | H              | Me                               | Ph                  | Me                                                                                    |
| 3152.  | F              | H              | Me                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 3153.  | F              | H              | Et                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 3154.  | F              | H              | Pr                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 3155.  | F              | H              | iPr                              | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 3156.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 3157.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | Me                                                                                    |
| 3158.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3159.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | F                                                                                     |
| 3160.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OMe                                                                                   |
| 3161.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OEt                                                                                   |
| 3162.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 3163.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | CN                                                                                    |
| 3164.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph(4-Cl)            | Cl                                                                                    |
| 3165.  | F              | H              | Me                               | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 3166.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  |  |
| 3167.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | H                                                                                     |
| 3168.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 3169.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | SMe                                                                                   |
| 3170.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 3171.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |
| 3172.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     |
| 3173.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                   |
| 3174.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                                |
| 3175.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                              |
| 3176.  | F              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                  | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3177.  | F              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 3178.  | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 3179.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 3180.  | F              | H              | Cl                               | Me                  | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                  | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|---------------------------------|------------------|-----------------------------------|
| 3181.  | F              | H              | Br                              | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3182.  | F              | H              | Br                              | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3183.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3184.  | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3185.  | F              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3186.  | F              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   |
| 3187.  | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 3188.  | F              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3189.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                                |
| 3190.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                                |
| 3191.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                                |
| 3192.  | Cl             | H              | Cl                              | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 3193.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OMe                               |
| 3194.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CN                                |
| 3195.  | Cl             | H              | Cl                              | Et               | Cl                                |
| 3196.  | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | Cl                                |
| 3197.  | Cl             | H              | Me                              | Me               | Me                                |
| 3198.  | Cl             | H              | Me                              | Me               | Cl                                |
| 3199.  | Cl             | H              | Cl                              | Me               | Cl                                |
| 3200.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | Cl                                |
| 3201.  | Cl             | H              | Cl                              | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3202.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | F                                 |
| 3203.  | Cl             | H              | OMe                             | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3204.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OEt                               |
| 3205.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3206.  | Cl             | H              | OCHF <sub>2</sub>               | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3207.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 3208.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 3209.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 3210.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | SO <sub>2</sub> Me                |
| 3211.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | SEt                               |
| 3212.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | Me                                |
| 3213.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | Et                                |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>    |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-------------------|
| 3214.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Et                                 | Cl                |
| 3215.  | Cl             | H              | Cl              | Et                                 | CF <sub>3</sub>   |
| 3216.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl                |
| 3217.  | Cl             | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub>   |
| 3218.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl                |
| 3219.  | Cl             | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub>   |
| 3220.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl                |
| 3221.  | Cl             | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub>   |
| 3222.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                |
| 3223.  | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>   |
| 3224.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                |
| 3225.  | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   |
| 3226.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe               |
| 3227.  | Cl             | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>   |
| 3228.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                |
| 3229.  | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub>   |
| 3230.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl                |
| 3231.  | Cl             | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub>   |
| 3232.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl                |
| 3233.  | Cl             | H              | Me              | Ph                                 | Me                |
| 3234.  | Cl             | H              | Me              | Ph                                 | Cl                |
| 3235.  | Cl             | H              | Et              | Ph                                 | Cl                |
| 3236.  | Cl             | H              | Pr              | Ph                                 | Cl                |
| 3237.  | Cl             | H              | iPr             | Ph                                 | Cl                |
| 3238.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Cl                |
| 3239.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Me                |
| 3240.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CF <sub>3</sub>   |
| 3241.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | F                 |
| 3242.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OMe               |
| 3243.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OEt               |
| 3244.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OCHF <sub>2</sub> |
| 3245.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CN                |
| 3246.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub> | Ph(4-Cl)                           | Cl                |

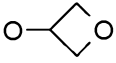
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 3247.  | Cl             | H              | Me                               | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 3248.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               |  |
| 3249.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | H                                                                                   |
| 3250.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 3251.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SMe                                                                                 |
| 3252.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 3253.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 3254.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 3255.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 3256.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 3257.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 3258.  | Cl             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3259.  | Cl             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3260.  | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3261.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3262.  | Cl             | H              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3263.  | Cl             | H              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3264.  | Cl             | H              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3265.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3266.  | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3267.  | Cl             | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3268.  | Cl             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                     |
| 3269.  | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 3270.  | Cl             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3271.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph               | Cl                                                                                  |
| 3272.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                                                  |
| 3273.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                                                                                  |
| 3274.  | Br             | H              | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3275.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe                                                                                 |
| 3276.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                                                                                  |
| 3277.  | Br             | H              | Cl                               | Et               | Cl                                                                                  |
| 3278.  | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | Cl                                                                                  |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|------------------------------------|-----------------------------------|
| 3279.  | Br             | H              | Me                | Me                                 | Me                                |
| 3280.  | Br             | H              | Me                | Me                                 | Cl                                |
| 3281.  | Br             | H              | Cl                | Me                                 | Cl                                |
| 3282.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Cl                                |
| 3283.  | Br             | H              | Cl                | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3284.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | F                                 |
| 3285.  | Br             | H              | OMe               | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3286.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OEt                               |
| 3287.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3288.  | Br             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3289.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 3290.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 3291.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 3292.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SO <sub>2</sub> Me                |
| 3293.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SEt                               |
| 3294.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Me                                |
| 3295.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Et                                |
| 3296.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | Et                                 | Cl                                |
| 3297.  | Br             | H              | Cl                | Et                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3298.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | iPr                                | Cl                                |
| 3299.  | Br             | H              | Cl                | iPr                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 3300.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | tBu                                | Cl                                |
| 3301.  | Br             | H              | Cl                | tBu                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 3302.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | cPen                               | Cl                                |
| 3303.  | Br             | H              | Cl                | cPen                               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3304.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                                |
| 3305.  | Br             | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>                   |
| 3306.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                                |
| 3307.  | Br             | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 3308.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                   | OMe                               |
| 3309.  | Br             | H              | OMe               | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>                   |
| 3310.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                                |
| 3311.  | Br             | H              | Cl                | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub>                   |

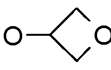
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>      | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|---------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 3312.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> OMe | Cl                                                                                    |
| 3313.  | Br             | H              | Cl                               | CH <sub>2</sub> OMe | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3314.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CN  | Cl                                                                                    |
| 3315.  | Br             | H              | Me                               | Ph                  | Me                                                                                    |
| 3316.  | Br             | H              | Me                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 3317.  | Br             | H              | Et                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 3318.  | Br             | H              | Pr                               | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 3319.  | Br             | H              | iPr                              | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 3320.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | Cl                                                                                    |
| 3321.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | Me                                                                                    |
| 3322.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3323.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | F                                                                                     |
| 3324.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OMe                                                                                   |
| 3325.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OEt                                                                                   |
| 3326.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 3327.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                  | CN                                                                                    |
| 3328.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph(4-Cl)            | Cl                                                                                    |
| 3329.  | Br             | H              | Me                               | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 3330.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  |  |
| 3331.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | H                                                                                     |
| 3332.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 3333.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | SMe                                                                                   |
| 3334.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 3335.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |
| 3336.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     |
| 3337.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                   |
| 3338.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                                |
| 3339.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                              |
| 3340.  | Br             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                  | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3341.  | Br             | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 3342.  | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 3343.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                  | CHF <sub>2</sub>                                                                      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                  | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|---------------------------------|------------------|-----------------------------------|
| 3344.  | Br             | H              | Cl                              | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3345.  | Br             | H              | Br                              | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3346.  | Br             | H              | Br                              | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3347.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3348.  | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3349.  | Br             | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3350.  | Br             | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   |
| 3351.  | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 3352.  | Br             | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3353.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Ph               | Cl                                |
| 3354.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | tBu              | Cl                                |
| 3355.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | CHF <sub>2</sub> | Cl                                |
| 3356.  | I              | H              | Cl                              | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 3357.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OMe                               |
| 3358.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | CN                                |
| 3359.  | I              | H              | Cl                              | Et               | Cl                                |
| 3360.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                | Me               | Cl                                |
| 3361.  | I              | H              | Me                              | Me               | Me                                |
| 3362.  | I              | H              | Me                              | Me               | Cl                                |
| 3363.  | I              | H              | Cl                              | Me               | Cl                                |
| 3364.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | Cl                                |
| 3365.  | I              | H              | Cl                              | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3366.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | F                                 |
| 3367.  | I              | H              | OMe                             | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3368.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OEt                               |
| 3369.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3370.  | I              | H              | OCHF <sub>2</sub>               | Me               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3371.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 3372.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 3373.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 3374.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | SO <sub>2</sub> Me                |
| 3375.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | SEt                               |
| 3376.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                 | Me               | Me                                |

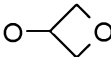
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>    |
|--------|----------------|----------------|-----------------|------------------------------------|-------------------|
| 3377.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Me                                 | Et                |
| 3378.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Et                                 | Cl                |
| 3379.  | I              | H              | Cl              | Et                                 | CF <sub>3</sub>   |
| 3380.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | iPr                                | Cl                |
| 3381.  | I              | H              | Cl              | iPr                                | CF <sub>3</sub>   |
| 3382.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | tBu                                | Cl                |
| 3383.  | I              | H              | Cl              | tBu                                | CF <sub>3</sub>   |
| 3384.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | cPen                               | Cl                |
| 3385.  | I              | H              | Cl              | cPen                               | CF <sub>3</sub>   |
| 3386.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                |
| 3387.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>   |
| 3388.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                |
| 3389.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>   |
| 3390.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CHF <sub>2</sub>                   | OMe               |
| 3391.  | I              | H              | OMe             | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>   |
| 3392.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                |
| 3393.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | CF <sub>3</sub>   |
| 3394.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> OMe                | Cl                |
| 3395.  | I              | H              | Cl              | CH <sub>2</sub> OMe                | CF <sub>3</sub>   |
| 3396.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CN                 | Cl                |
| 3397.  | I              | H              | Me              | Ph                                 | Me                |
| 3398.  | I              | H              | Me              | Ph                                 | Cl                |
| 3399.  | I              | H              | Et              | Ph                                 | Cl                |
| 3400.  | I              | H              | Pr              | Ph                                 | Cl                |
| 3401.  | I              | H              | iPr             | Ph                                 | Cl                |
| 3402.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Cl                |
| 3403.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | Me                |
| 3404.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CF <sub>3</sub>   |
| 3405.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | F                 |
| 3406.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OMe               |
| 3407.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OEt               |
| 3408.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | OCHF <sub>2</sub> |
| 3409.  | I              | H              | CF <sub>3</sub> | Ph                                 | CN                |

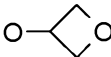
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 3410.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph(4-Cl)         | Cl                                                                                  |
| 3411.  | I              | H              | Me                               | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 3412.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               |  |
| 3413.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | H                                                                                   |
| 3414.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 3415.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SMe                                                                                 |
| 3416.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 3417.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 3418.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 3419.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 3420.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 3421.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 3422.  | I              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3423.  | I              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3424.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3425.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3426.  | I              | H              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3427.  | I              | H              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3428.  | I              | H              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3429.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3430.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3431.  | I              | H              | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3432.  | I              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                     |
| 3433.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 3434.  | I              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3435.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph               | Cl                                                                                  |
| 3436.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                                                  |
| 3437.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                                                                                  |
| 3438.  | H              | F              | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3439.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe                                                                                 |
| 3440.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                                                                                  |
| 3441.  | H              | F              | Cl                               | Et               | Cl                                                                                  |

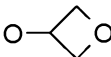
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                     | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|------------------------------------|-----------------------------------|
| 3442.  | H              | F              | CHF <sub>2</sub>  | Me                                 | Cl                                |
| 3443.  | H              | F              | Me                | Me                                 | Me                                |
| 3444.  | H              | F              | Me                | Me                                 | Cl                                |
| 3445.  | H              | F              | Cl                | Me                                 | Cl                                |
| 3446.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Cl                                |
| 3447.  | H              | F              | Cl                | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3448.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | F                                 |
| 3449.  | H              | F              | OMe               | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3450.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OEt                               |
| 3451.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3452.  | H              | F              | OCHF <sub>2</sub> | Me                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3453.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 3454.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 3455.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | OCH <sub>2</sub> CN               |
| 3456.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SO <sub>2</sub> Me                |
| 3457.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | SEt                               |
| 3458.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Me                                |
| 3459.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                                 | Et                                |
| 3460.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Et                                 | Cl                                |
| 3461.  | H              | F              | Cl                | Et                                 | CF <sub>3</sub>                   |
| 3462.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | iPr                                | Cl                                |
| 3463.  | H              | F              | Cl                | iPr                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 3464.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | tBu                                | Cl                                |
| 3465.  | H              | F              | Cl                | tBu                                | CF <sub>3</sub>                   |
| 3466.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | cPen                               | Cl                                |
| 3467.  | H              | F              | Cl                | cPen                               | CF <sub>3</sub>                   |
| 3468.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> cPr                | Cl                                |
| 3469.  | H              | F              | Cl                | CH <sub>2</sub> cPr                | CF <sub>3</sub>                   |
| 3470.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | Cl                                |
| 3471.  | H              | F              | Cl                | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                   |
| 3472.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                   | OMe                               |
| 3473.  | H              | F              | OMe               | CHF <sub>2</sub>                   | CF <sub>3</sub>                   |
| 3474.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>    | Cl                                |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 3475.  | H              | F              | Cl                               | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3476.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> OMe             | Cl                                                                                    |
| 3477.  | H              | F              | Cl                               | CH <sub>2</sub> OMe             | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3478.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CN              | Cl                                                                                    |
| 3479.  | H              | F              | Me                               | Ph                              | Me                                                                                    |
| 3480.  | H              | F              | Me                               | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 3481.  | H              | F              | Et                               | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 3482.  | H              | F              | Pr                               | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 3483.  | H              | F              | iPr                              | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 3484.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 3485.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | Me                                                                                    |
| 3486.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3487.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | F                                                                                     |
| 3488.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OMe                                                                                   |
| 3489.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OEt                                                                                   |
| 3490.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 3491.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | CN                                                                                    |
| 3492.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Ph(4-Cl)                        | Cl                                                                                    |
| 3493.  | H              | F              | Me                               | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 3494.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              |  |
| 3495.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | H                                                                                     |
| 3496.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 3497.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SMe                                                                                   |
| 3498.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 3499.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |
| 3500.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     |
| 3501.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                   |
| 3502.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                                |
| 3503.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                              |
| 3504.  | H              | F              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3505.  | H              | F              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 3506.  | H              | F              | CHF <sub>2</sub>                 | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |

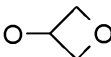
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|---------------------------------|-----------------------------------|
| 3507.  | H              | F              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | CHF <sub>2</sub>                  |
| 3508.  | H              | F              | Cl                | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3509.  | H              | F              | Br                | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3510.  | H              | F              | Br                | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 3511.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                |
| 3512.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | Cl                                |
| 3513.  | H              | Cl             | Cl                | CHF <sub>2</sub>                | CF <sub>3</sub>                   |
| 3514.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OMe                               |
| 3515.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | CN                                |
| 3516.  | H              | Cl             | CHF <sub>2</sub>  | Me                              | Cl                                |
| 3517.  | H              | Cl             | Me                | Me                              | Me                                |
| 3518.  | H              | Cl             | Me                | Me                              | Cl                                |
| 3519.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | Cl                                |
| 3520.  | H              | Cl             | Cl                | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 3521.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | F                                 |
| 3522.  | H              | Cl             | OMe               | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 3523.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3524.  | H              | Cl             | OCHF <sub>2</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 3525.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 3526.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 3527.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                |
| 3528.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SEt                               |
| 3529.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Et                              | Cl                                |
| 3530.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | iPr                             | Cl                                |
| 3531.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                |
| 3532.  | H              | Cl             | Cl                | tBu                             | CF <sub>3</sub>                   |
| 3533.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | cPen                            | Cl                                |
| 3534.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | OMe                               |
| 3535.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                |
| 3536.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3537.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | Cl                                |
| 3538.  | H              | Cl             | Me                | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |

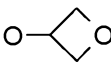
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 3539.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               |  |
| 3540.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | H                                                                                   |
| 3541.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 3542.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SMe                                                                                 |
| 3543.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 3544.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 3545.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 3546.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 3547.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 3548.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 3549.  | H              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3550.  | H              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3551.  | H              | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3552.  | H              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3553.  | H              | Cl             | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3554.  | H              | Cl             | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3555.  | H              | Cl             | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3556.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                                                  |
| 3557.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                                                                                  |
| 3558.  | H              | Br             | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3559.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe                                                                                 |
| 3560.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                                                                                  |
| 3561.  | H              | Br             | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | Cl                                                                                  |
| 3562.  | H              | Br             | Me                               | Me               | Me                                                                                  |
| 3563.  | H              | Br             | Me                               | Me               | Cl                                                                                  |
| 3564.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | Cl                                                                                  |
| 3565.  | H              | Br             | Cl                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3566.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | F                                                                                   |
| 3567.  | H              | Br             | OMe                              | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3568.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3569.  | H              | Br             | OCHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3570.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                                   |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 3571.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 3572.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                                                                    |
| 3573.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SEt                                                                                   |
| 3574.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Et                              | Cl                                                                                    |
| 3575.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | iPr                             | Cl                                                                                    |
| 3576.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | tBu                             | Cl                                                                                    |
| 3577.  | H              | Br             | Cl                               | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3578.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | cPen                            | Cl                                                                                    |
| 3579.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   |
| 3580.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    |
| 3581.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 3582.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 3583.  | H              | Br             | Me                               | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 3584.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              |  |
| 3585.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | H                                                                                     |
| 3586.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 3587.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SMe                                                                                   |
| 3588.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 3589.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |
| 3590.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     |
| 3591.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                   |
| 3592.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                                |
| 3593.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                              |
| 3594.  | H              | Br             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3595.  | H              | Br             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 3596.  | H              | Br             | CHF <sub>2</sub>                 | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 3597.  | H              | Br             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 3598.  | H              | Br             | Cl                               | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 3599.  | H              | Br             | Br                               | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 3600.  | H              | Br             | Br                               | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3601.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | tBu                             | Cl                                                                                    |
| 3602.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub>                | Cl                                                                                    |

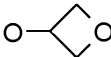
| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|-------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 3603.  | Me             | H              | Cl                | CHF <sub>2</sub>                | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3604.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OMe                                                                                   |
| 3605.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | CN                                                                                    |
| 3606.  | Me             | H              | CHF <sub>2</sub>  | Me                              | Cl                                                                                    |
| 3607.  | Me             | H              | Me                | Me                              | Me                                                                                    |
| 3608.  | Me             | H              | Me                | Me                              | Cl                                                                                    |
| 3609.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | Cl                                                                                    |
| 3610.  | Me             | H              | Cl                | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3611.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | F                                                                                     |
| 3612.  | Me             | H              | OMe               | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3613.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 3614.  | Me             | H              | OCHF <sub>2</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3615.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                                     |
| 3616.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 3617.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                                                                    |
| 3618.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SEt                                                                                   |
| 3619.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Et                              | Cl                                                                                    |
| 3620.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | iPr                             | Cl                                                                                    |
| 3621.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                                                                    |
| 3622.  | Me             | H              | Cl                | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3623.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | cPen                            | Cl                                                                                    |
| 3624.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   |
| 3625.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    |
| 3626.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 3627.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 3628.  | Me             | H              | Me                | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 3629.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              |  |
| 3630.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | H                                                                                     |
| 3631.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 3632.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SMe                                                                                   |
| 3633.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 3634.  | Me             | H              | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |

| Ex. N° | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>   | R <sup>5</sup>                                    |
|--------|-----------------|----------------|----------------------------------|------------------|---------------------------------------------------|
| 3635.  | Me              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 3636.  | Me              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>               |
| 3637.  | Me              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                            |
| 3638.  | Me              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                          |
| 3639.  | Me              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CF <sub>3</sub>                                   |
| 3640.  | Me              | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me               | CHF <sub>2</sub>                                  |
| 3641.  | Me              | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | CHF <sub>2</sub>                                  |
| 3642.  | Me              | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CHF <sub>2</sub>                                  |
| 3643.  | Me              | H              | Cl                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                 |
| 3644.  | Me              | H              | Br                               | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                 |
| 3645.  | Me              | H              | Br                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                   |
| 3646.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                |
| 3647.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub> | Cl                                                |
| 3648.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                               | CHF <sub>2</sub> | CF <sub>3</sub>                                   |
| 3649.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OMe                                               |
| 3650.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | CN                                                |
| 3651.  | NO <sub>2</sub> | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me               | Cl                                                |
| 3652.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me                               | Me               | Me                                                |
| 3653.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me                               | Me               | Cl                                                |
| 3654.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | Cl                                                |
| 3655.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                               | Me               | CF <sub>3</sub>                                   |
| 3656.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | F                                                 |
| 3657.  | NO <sub>2</sub> | H              | OMe                              | Me               | CF <sub>3</sub>                                   |
| 3658.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCHF <sub>2</sub>                                 |
| 3659.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCHF <sub>2</sub>                | Me               | CF <sub>3</sub>                                   |
| 3660.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                 |
| 3661.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                  |
| 3662.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SO <sub>2</sub> Me                                |
| 3663.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me               | SEt                                               |
| 3664.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Et               | Cl                                                |
| 3665.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | iPr              | Cl                                                |
| 3666.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | tBu              | Cl                                                |
| 3667.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                               | tBu              | CF <sub>3</sub>                                   |

| Ex. N° | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|-----------------|----------------|----------------------------------|---------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 3668.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | cPen                            | Cl                                                                                  |
| 3669.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                 |
| 3670.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                  |
| 3671.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3672.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | Cl                                                                                  |
| 3673.  | NO <sub>2</sub> | H              | Me                               | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                    |
| 3674.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              |  |
| 3675.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | H                                                                                   |
| 3676.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 3677.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SMe                                                                                 |
| 3678.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 3679.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 3680.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 3681.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 3682.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 3683.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 3684.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3685.  | NO <sub>2</sub> | H              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3686.  | NO <sub>2</sub> | H              | CHF <sub>2</sub>                 | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3687.  | NO <sub>2</sub> | H              | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3688.  | NO <sub>2</sub> | H              | Cl                               | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3689.  | NO <sub>2</sub> | H              | Br                               | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3690.  | NO <sub>2</sub> | H              | Br                               | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3691.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | tBu                             | Cl                                                                                  |
| 3692.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub>                | Cl                                                                                  |
| 3693.  | Cl              | Cl             | Cl                               | CHF <sub>2</sub>                | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3694.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OMe                                                                                 |
| 3695.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | CN                                                                                  |
| 3696.  | Cl              | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me                              | Cl                                                                                  |
| 3697.  | Cl              | Cl             | Me                               | Me                              | Me                                                                                  |
| 3698.  | Cl              | Cl             | Me                               | Me                              | Cl                                                                                  |
| 3699.  | Cl              | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | Cl                                                                                  |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                                                                        |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|---------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
| 3700.  | Cl             | Cl             | Cl                               | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3701.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | F                                                                                     |
| 3702.  | Cl             | Cl             | OMe                              | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3703.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 3704.  | Cl             | Cl             | OCHF <sub>2</sub>                | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3705.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                                     |
| 3706.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 3707.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                                                                    |
| 3708.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SEt                                                                                   |
| 3709.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Et                              | Cl                                                                                    |
| 3710.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | iPr                             | Cl                                                                                    |
| 3711.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | tBu                             | Cl                                                                                    |
| 3712.  | Cl             | Cl             | Cl                               | tBu                             | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3713.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | cPen                            | Cl                                                                                    |
| 3714.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CHF <sub>2</sub>                | OMe                                                                                   |
| 3715.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                                                                    |
| 3716.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                                                                     |
| 3717.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Ph                              | Cl                                                                                    |
| 3718.  | Cl             | Cl             | Me                               | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                                      |
| 3719.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              |  |
| 3720.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | H                                                                                     |
| 3721.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                  |
| 3722.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | SMe                                                                                   |
| 3723.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                    |
| 3724.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                   |
| 3725.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                     |
| 3726.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                   |
| 3727.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                                |
| 3728.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>                  | Me                              | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                              |
| 3729.  | Cl             | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                                                                       |
| 3730.  | Cl             | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |
| 3731.  | Cl             | Cl             | CHF <sub>2</sub>                 | Me                              | CHF <sub>2</sub>                                                                      |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                    |
|--------|----------------|----------------|-------------------|---------------------------------|-----------------------------------|
| 3732.  | Cl             | Cl             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | CHF <sub>2</sub>                  |
| 3733.  | Cl             | Cl             | Cl                | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3734.  | Cl             | Cl             | Br                | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3735.  | Cl             | Cl             | Br                | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 3736.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                |
| 3737.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | Cl                                |
| 3738.  | Cl             | Me             | Cl                | CHF <sub>2</sub>                | CF <sub>3</sub>                   |
| 3739.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OMe                               |
| 3740.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | CN                                |
| 3741.  | Cl             | Me             | CHF <sub>2</sub>  | Me                              | Cl                                |
| 3742.  | Cl             | Me             | Me                | Me                              | Me                                |
| 3743.  | Cl             | Me             | Me                | Me                              | Cl                                |
| 3744.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | Cl                                |
| 3745.  | Cl             | Me             | Cl                | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 3746.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | F                                 |
| 3747.  | Cl             | Me             | OMe               | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 3748.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3749.  | Cl             | Me             | OCHF <sub>2</sub> | Me                              | CF <sub>3</sub>                   |
| 3750.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub> |
| 3751.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |
| 3752.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SO <sub>2</sub> Me                |
| 3753.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Me                              | SEt                               |
| 3754.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Et                              | Cl                                |
| 3755.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | iPr                             | Cl                                |
| 3756.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | tBu                             | Cl                                |
| 3757.  | Cl             | Me             | Cl                | tBu                             | CF <sub>3</sub>                   |
| 3758.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | cPen                            | Cl                                |
| 3759.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | CHF <sub>2</sub>                | OMe                               |
| 3760.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Cl                                |
| 3761.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | OCHF <sub>2</sub>                 |
| 3762.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>   | Ph                              | Cl                                |
| 3763.  | Cl             | Me             | Me                | Me                              | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  |

| Ex. N° | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>                   | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup>                                                                      |
|--------|----------------|----------------|----------------------------------|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 3764.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             |  |
| 3765.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | H                                                                                   |
| 3766.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe                                                |
| 3767.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | SMe                                                                                 |
| 3768.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F                                  |
| 3769.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                 |
| 3770.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>                                   |
| 3771.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH <sub>2</sub> CF=CH <sub>2</sub>                                                 |
| 3772.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CF <sub>3</sub>                                                              |
| 3773.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | OCH(Me)CH <sub>2</sub> F                                                            |
| 3774.  | Cl             | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CF <sub>3</sub>                                                                     |
| 3775.  | Cl             | Me             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | Me             | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3776.  | Cl             | Me             | CHF <sub>2</sub>                 | Me             | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3777.  | Cl             | Me             | CF <sub>3</sub>                  | Me             | CHF <sub>2</sub>                                                                    |
| 3778.  | Cl             | Me             | Cl                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3779.  | Cl             | Me             | Br                               | Me             | OCHF <sub>2</sub>                                                                   |
| 3780.  | Cl             | Me             | Br                               | Me             | CF <sub>3</sub>                                                                     |

[00434] Os dados da RMN foram medidos a 400 MHz e em CDCl<sub>3</sub> como solvente. O deslocamento químico  $\delta$  é indicado em ppm (padrão TMS).

[00435] Tempos de retenção ( $T_r$  em minutos) e relações enantioméricas (ee) de compostos quirais foram determinados por meio de HPLC quiral analítica [coluna Chiralpak® IC (250 x 4,6 mm, tamanho do grão 10  $\mu$ m), temperatura 25°C, vazão 1 ml/min, n-heptano / 2-propanol 80:20 v/v].

Dados para a tabela 2:

[00436] composto n° 2449:  $T_r$  = 6,254 min.

[00437] composto n° 2531:  $T_r$  = 6,585 min.

[00438] composto n° 2341:  $T_r$  = 29,201 min [coluna Chiralpak® IC (250 x 4,6 mm, tamanho do grão 10  $\mu$ m), temperatura 25°C, vazão 0,6 ml/min, n-heptano / 2-propanol 90:10 v/v].

[00439] composto nº 2288:  $T_r = 6,912$  min.

Dados para a tabela 3:

[00440] composto nº 3205:  $T_r = 7,873$  min.

[00441] composto nº 3287:  $T_r = 8,217$  min.

[00442] composto nº 3097:  $T_r = 32,132$  min [coluna Chiralpak® IC (250 x 4,6 mm, tamanho do grão 10 µm), temperatura 25°C, vazão 0,6 ml/min, n-heptano / 2-propanol 90:10 v/v].

[00443] composto nº 3044:  $T_r = 13,384$  min.

### B. Exemplos de formulações

a) Um pó de polvilhamento é obtido, em que 10 partes em peso, de um composto da Fórmula (I) e/ou seus sais e 90 partes em peso, de talco como substância inerte são misturados e triturados em um moinho de percussão.

b) Um pó umedecível, facilmente dispersível em água é obtido, em que 25 partes em peso, de um composto da Fórmula (I) e/ou seus sais, 64 partes em peso, de quartzo contendo caulim como substância inerte, 10 partes em peso, de ligninossulfonato de potássio e 1 parte em peso, de oleoilmetiltaurinato de sódio como umectante e agente de dispersão são misturados e moídos em um moinho de pinos.

c) Um concentrado de dispersão facilmente dispersível em água é obtido, em que 20 partes em peso, de um composto da Fórmula (I) e/ou seus sais são misturados com 6 partes em peso, de éter alquilfenolpoliglicólico (®Triton X 207), 3 partes em peso, de éter isotri-decanolpoliglicólico (8 EO) e 71 partes em peso, de óleo mineral para-fínico (faixa de ebulição, por exemplo, cerca de 255 até acima de 277°C) e moídos em um moinho de atrito de bolas para uma finura inferior a 5 microns.

d) Um concentrado emulsificável é obtido a partir de 15 partes em peso, de um composto da Fórmula (I) e/ou seus sais, 75 partes

em peso, de ciclo-hexanona como solvente e 10 partes em peso, de nonilfenol oxetilado como emulsificante.

e) Um granulado dispersível em água é obtido, em que

[00444] 75 partes em peso de um composto da Fórmula (I) e/ou seus sais,

[00445] 10 partes em peso de ligninossulfonato de cálcio,

[00446] 5 partes em peso de laurilsulfato de sódio,

[00447] 3 partes em peso de álcool polivinílico e

[00448] 7 partes em peso de caulim,

[00449] são misturadas, moídas em um moinho de pinos e o pó é granulado em um leito fluidizante aspergindo água como líquido de granulação.

f) Um granulado dispersível em água também é obtido, em que

[00450] 25 partes em peso de um composto da Fórmula (I) e/ou seus sais,

[00451] 5 partes em peso de 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-dissulfonato de sódio

[00452] 2 partes em peso de oleoilmetiltaurinato de sódio,

[00453] 1 parte em peso de álcool polivinílico,

[00454] 17 partes em peso de carbonato de cálcio e

[00455] 50 partes em peso de água

[00456] são homogeneizadas em um moinho coloidal e previamente trituradas, em seguida, são moídas em um moinho de pérolas e a suspensão obtida dessa maneira é pulverizada em uma torre de atomização por meio de um bocal único e secada.

### C. Exemplos biológicos

[00457] Os compostos da Fórmula (I) (e/ou seus sais) de acordo com a invenção, a seguir designados juntos como "compostos de acordo com a invenção", apresentam uma excelente eficácia herbicida

contra um amplo espectro de plantas daninhas mono- e dicotiledôneas anuais economicamente importantes. Plantas daninhas perenes também de difícil combate, que brotam de rizomas, sistema de raízes ou de outros órgãos perenes, também são bem abrangidas pelas substâncias ativas.

[00458] Por conseguinte, o objeto da presente invenção é também um processo para combater plantas indesejadas ou para regular o crescimento de plantas, preferivelmente em culturas de plantas, nas quais um ou vários compostos de acordo com a invenção, são aplicados sobre as plantas (por exemplo, plantas daninhas, tais como ervas daninhas mono- ou dicotiledôneas ou plantas cultivadas indesejadas), sobre a semente (por exemplo, grãos, sementes ou órgãos de propagação vegetativos, tais como tubérculos ou partes do broto com botões) ou na área, sobre a qual as plantas crescem (por exemplo, a área de cultivo). Nesse caso, os compostos de acordo com a invenção, podem ser aplicados, por exemplo, no processo de pré-semeação (eventualmente também através de incorporação no solo), processo de pré-emergência ou de pós-emergência. Individualmente, sejam mencionados, por exemplo, alguns representantes da flora de ervas daninhas mono- e dicotiledôneas, que podem ser controladas pelos compostos de acordo com a invenção, sem que através da menção haja uma restrição a certas espécies.

[00459] Plantas daninhas monocotiledôneas dos gêneros: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

[00460] Ervas daninhas dicotiledôneas dos gêneros: Abutilon,

Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

[00461] Se os compostos de acordo com a invenção são aplicados na superfície da terra antes da germinação, então ou a emergência das mudas de ervas daninhas é inteiramente impedida ou as ervas daninhas crescem até o estágio de germinação da folha, contudo, depois ajustam seu crescimento e finalmente, morrem inteiramente após o decurso de três a quatro semanas.

[00462] Se as substâncias ativas são aplicadas sobre as partes verdes das plantas no processo de pós-emergência, ocorre uma parada do crescimento após o tratamento e as plantas daninhas permanecem no estágio de crescimento presente no momento da aplicação ou morrem completamente após um certo tempo, assim que dessa maneira, a competição pelas ervas daninhas nociva para as plantas cultivadas, é eliminada muito cedo e permanentemente.

[00463] Embora os compostos, de acordo com a invenção, apresentem uma excelente atividade herbicida contra ervas daninhas mono- e dicotiledôneas, plantas cultivadas de culturas economicamente importantes, por exemplo, culturas dicotiledôneas dos gêneros Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia ou culturas monocotiledôneas dos gêneros Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Pani-

cum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea, especialmente Zea e Triticum, são apenas insignificamente danificadas ou nem o são, dependendo da estrutura do respectivo composto de acordo com a invenção e de sua quantidade de aplicação. Por esses motivos, os presentes compostos são muito bem adequados para o combate seletivo do crescimento de plantas indesejadas em culturas de plantas, tais como plantações agrícolas úteis ou plantações ornamentais.

[00464] Além disso, os compostos de acordo com a invenção (dependendo de sua respectiva estrutura e da quantidade aplicada) apresentam excelentes propriedades reguladoras de crescimento em plantas cultivadas. Eles penetram regulando o metabolismo próprio das plantas e, com isso, podem ser empregados para influenciar visadamente as substâncias constitutivas das plantas e para facilitar a colheita, tal como, por exemplo, causando a dissecação e encalque do crescimento. Além disso, eles também são adequados para o controle e a inibição geral do crescimento vegetativo indesejado, sem, com isso, matar as plantas. A inibição do crescimento vegetativo apresenta um papel importante em muitas culturas mono- e dicotiledôneas, visto que, por exemplo, por esse meio a formação de depósito pode ser reduzida ou completamente evitada.

[00465] Com base em suas propriedades herbicidas e reguladoras do crescimento de plantas, as substâncias ativas também podem ser empregadas para combater plantas daninhas em culturas de plantas modificadas geneticamente ou por mutagênese convencional. Via de regra, as plantas transgênicas destacam-se por propriedades vantajosas particulares, por exemplo, através de resistências contra certos pesticidas, principalmente certos herbicidas, resistências contra doenças de plantas ou patógenos de doenças de plantas, tais como certos insetos ou micro-organismos, tais como fungos, bactérias ou vírus. Ou-

tras propriedades particulares referem-se, por exemplo, ao material colhido com respeito à quantidade, qualidade, armazenabilidade, composição e substâncias constitutivas especiais. Dessa maneira, as plantas transgênicas com alto teor de amido ou qualidade modificada do amido ou aquelas com diferente composição de ácido graxo do material colhido são conhecidas.

[00466] Com respeito às culturas transgênicas, é preferível aplicar os compostos de acordo com a invenção, em culturas transgênicas economicamente importantes de plantas úteis e ornamentais, por exemplo, de cereais, tais como trigo, cevada, centeio, aveia, painço, arroz e milho ou também em culturas de beterraba, algodão, soja, colza, batata, tomate, ervilha e outras variedades de legumes. Preferivelmente, os compostos, de acordo com a invenção, podem ser empregados como herbicidas em culturas de plantas úteis, as quais são resistentes contra os efeitos fitotóxicos dos herbicidas ou foram tornadas geneticamente resistentes.

#### 1. Efeito herbicida ou compatibilidade pelas plantas cultivadas

[00467] Sementes de plantas de ervas daninhas ou plantas cultivadas mono- e dicotiledôneas são colocadas em barro arenoso em vasos de fibra de madeira e cobertas com terra. Os compostos de acordo com a invenção, formulados em forma de pós umedecíveis (WP) são aplicados então, na superfície da terra coberta como suspensão aquosa com uma quantidade de aplicação de água convertida de 600 l/ha com adição de 0,2% de umectante.

[00468] Após o tratamento, os vasos são colocados na estufa e mantidos em boas condições de crescimento para as plantas do experimento. Depois de cerca de 3 semanas, o efeito dos preparados é avaliado visualmente em comparação com os controles não tratados (efeito herbicida em por cento (%): efeito de 100% = as plantas morre-

ram, efeito de 0% = tal como as plantas de controle).

[00469] Tal como mostram os resultados, os compostos, de acordo com a invenção, apresentam uma boa eficácia herbicida na pré-emergência contra um amplo espectro de gramas daninhas e ervas daninhas. Por exemplo, os compostos nº 35, 50, 51, 230, 542, 788, 789, 1034, 2285, 2449, 2531 e outros compostos das tabelas 1 - 3 apresentam um efeito herbicida muito bom contra plantas daninhas, tais como, por exemplo, *Avena fatua*, *Stellaria media*, *Echinochloa crus galli*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis*, *Amaranthus retroflexus*, *Veronica persica*, *Matricaria inodora*, *Fallopia convolvulus* e *Alopecurus myosuroides* no processo de pré-emergência com uma quantidade de aplicação de 0,32 kg e menos substância ativa por hectare.

[00470] Ao mesmo tempo, os compostos, de acordo com a invenção, não danificam as culturas germinadas com duas folhas, tal como colza no processo de pré-emergência mesmo com altas dosagens de substância ativa. Algumas substâncias protegem, além disso, também culturas de gramíneas, tal como milho. Os compostos de acordo com a invenção mostram, em parte, uma alta seletividade e por isso, são adequados para combater o crescimento de plantas indesejadas em culturas agrícolas no processo de pré-emergência.

## 2. Efeito herbicida ou compatibilidade pelas plantas cultivadas na pós-emergência

[00471] Sementes de plantas de ervas daninhas ou plantas cultivadas mono- e dicotiledôneas são colocadas em barro arenoso em vasos de fibra de madeira, cobertas com terra e cultivadas na estufa em boas condições de crescimento. 2 a 3 semanas após a semeadura, as plantas do experimento são tratadas no estágio de uma folha. Os compostos de acordo com a invenção, formulados em forma de pós umedecíveis (WP) são aplicados então, nas partes verdes das plantas como suspensão aquosa com uma quantidade de aplicação de água

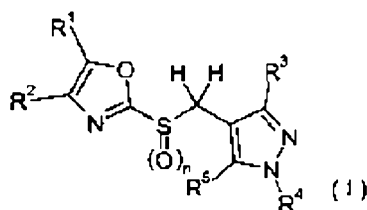
convertida de 600 l/ha com adição de 0,2% de umectante. Depois de um tempo de repouso das plantas do experimento na estufa por cerca de 3 semanas em ótimas condições de crescimento, o efeito dos preparados é visualmente avaliado em comparação com os controles não tratados (efeito herbicida em por cento (%): efeito de 100% = as plantas morreram, efeito de 0% = tal como as plantas de controle).

[00472] Tal como mostram os resultados, os compostos, de acordo com a invenção, apresentam uma boa eficácia na pós-emergência contra várias gramas daninhas ou ervas daninhas. Por exemplo, os compostos nº 35, 50, 51, 542, 230, 2285 e outros compostos das tabelas 1 – 3, apresentam efeito herbicida muito bom contra plantas daninhas, tais como, por exemplo, *Echinochloa crus galli*, *Lolium multiflorum*, e *Setaria viridis* no processo de pós-emergência com uma quantidade de aplicação de 0,32 kg e menos substância ativa por hectare.

[00473] Ao mesmo tempo, os compostos de acordo com a invenção, não danificam as culturas germinadas com duas folhas, tal como colza no processo de pré-emergência mesmo com altas dosagens de substância ativa. Algumas substâncias protegem, além disso, também culturas de gramíneas, tal como milho. Os compostos, de acordo com a invenção mostram, em parte, uma alta seletividade e por isso, são adequados para combater o crescimento de plantas indesejadas em culturas agrícolas no processo de pós-emergência.

## REIVINDICAÇÕES

1. Compostos, caracterizados pelo fato de que apresentam a Fórmula (I)



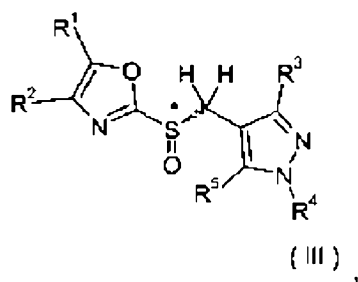
e seus sais agroquimicamente aceitáveis,  
na qual os radicais e índice apresentam o seguinte significado:

- n = 0, 1 ou 2;
- R<sup>1</sup> = H ou halogênio;
- R<sup>2</sup> = H, halogênio ou (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila não substituída;
- R<sup>3</sup> = (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquila não substituída;
- R<sup>4</sup> = (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquila não substituída;
- R<sup>5</sup> = halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)haloalquila não substituída, OCHF<sub>2</sub> ou OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>.

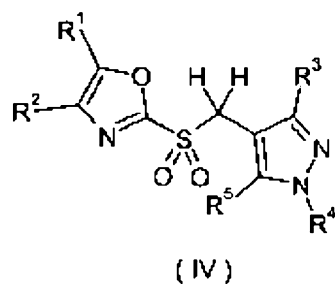
2. Compostos, de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de que, na Fórmula (I), n = 1.

3. Compostos, de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de que o composto da Fórmula (I) com n = 1 está presente com uma configuração (R) ou (S) com uma pureza estereoquímica acima de 50% até 100%.

4. Processo para preparação de um composto da Fórmula Geral (III),



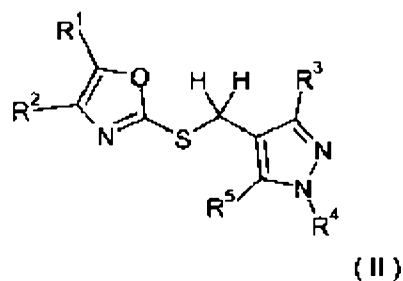
ou de um composto da Fórmula Geral (IV),



nas quais

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  e  $R^5$  são como definidos na reivindicação 1,

o referido processo sendo caracterizado pelo fato de que é através da oxidação de um tioéter da Fórmula Geral (II) por meio de um agente de oxidação,

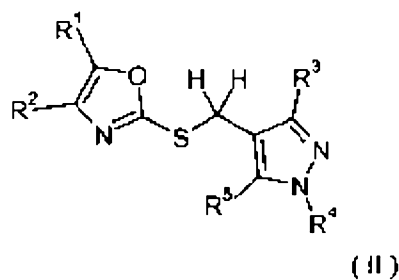


na qual

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  e  $R^5$  são como definidos na reivindicação 1,

sendo que com um equivalente do agente de oxidação se obtêm os sulfóxidos da Fórmula Geral (III) ou com dois equivalentes do agente de oxidação obtêm-se as sulfonas da Fórmula Geral (IV).

5. Processo para preparação de um tioéter da Fórmula Geral (II)

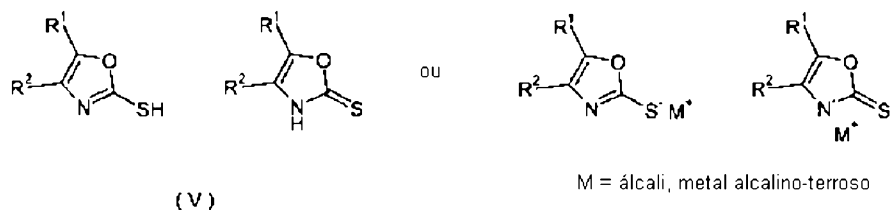


na qual

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  são como definidos na reivindicação 1,

o referido processo sendo caracterizado pelo fato de que compreende as seguintes etapas:

(a) reação de 2-mercapto-oxazol ou de uma oxazol-2(3H)-tiona ou de um sal do mesmo

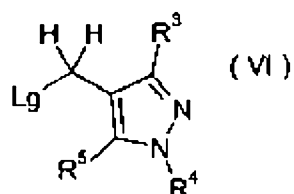


na qual

$R^1$ ,  $R^2$  são como definidos na reivindicação 1,

com um derivado de (1H-pirazol-4-ilmetila) da Fórmula

Geral (VI)



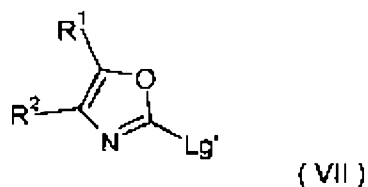
na qual

$R^3$ ,  $R^4$  e  $R^5$  são como definidos na reivindicação 1, e

$Lg$  representa um grupo de partida,

na presença de uma base de metal alcalino ou de metal alcalinoterroso ou de uma base orgânica em um solvente;

(b) reação de um derivado de oxazol da Fórmula Geral (VII)

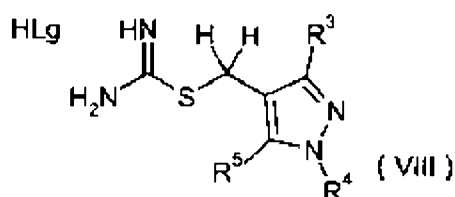


na qual

$R^1$  e  $R^2$  são como definidos na reivindicação 1, e

$Lg'$  representa um grupo de partida,

com um sal de [(1H-pirazol-4-il-metil)]-imidotiocarbamato da Fórmula Geral (VIII)



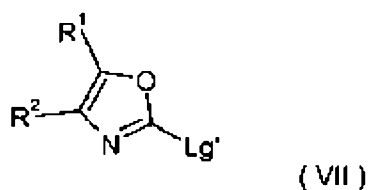
na qual

$R^3$ ,  $R^4$  e  $R^5$  são como definidos na reivindicação 1, e

Lg representa um grupo de partida,

em um processo de etapa única na presença de uma base de metal alcalino ou metal alcalinoterroso ou de uma base de carbonato de metal alcalino ou metal alcalinoterroso e de um solvente;

(c) reação de um derivado de oxazol da Fórmula Geral (VII)



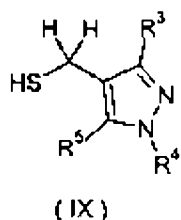
na qual

$R^1$  e  $R^2$  são como definidos na reivindicação 1, e

Lg' representa um grupo de partida,

com um (1H-pirazol-4-ilmetil)-mercaptano da Fórmula Geral

(IX)

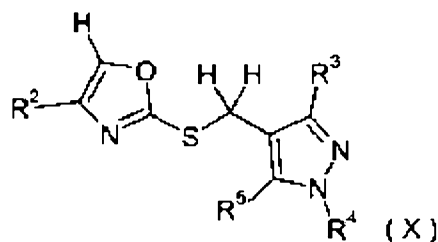


na qual

$R^3$ ,  $R^4$  e  $R^5$  são como definidos na reivindicação 1,

na presença de uma base de metal alcalino ou de metal alcalinoterroso;

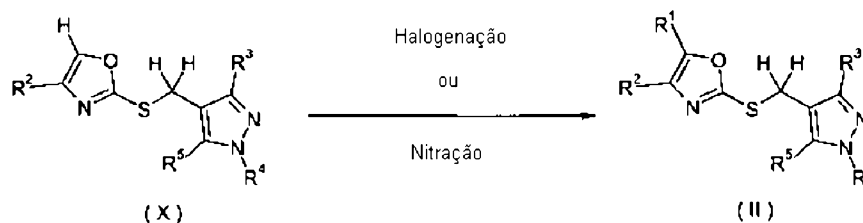
(d) reação de um derivado de oxazol da Fórmula Geral (X)



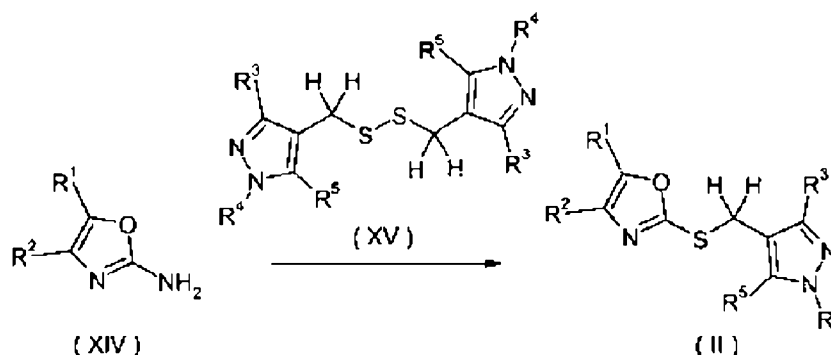
na qual

$R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  e  $R^5$  são como definidos na reivindicação 1, e

$R^1$  corresponde a um halogênio ou  $\text{NO}_2$  de acordo com o seguinte esquema de reação:



(e) reação de um derivado de dissulfeto de (1H-pirazol-4-ilmetila) da Fórmula Geral (XV) com 2-amino-oxazóis da Fórmula (XIV) e com um agente de diazotação, tal como representado no seguinte esquema:



no qual  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  são como definidos na reivindicação 1.

6. Processo, de acordo com a reivindicação 5, caracterizado pelo fato de que o composto da Fórmula Geral (II), o qual é obtido de acordo com o processo, como definido na reivindicação 5, é empregado como composto de partida no processo, como definido na reivindicação 4.

7. Composições, caracterizadas pelo fato de que contêm pelo menos um composto da Fórmula (I), como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 3.

8. Composições, de acordo com a reivindicação 7, caracterizadas pelo fato de que compreendem pelo menos uma outra substância ativa, a qual é selecionada do grupo, consistindo em pelo menos um outro herbicida e pelo menos um protetor.

9. Uso dos compostos da Fórmula (I), como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 3, caracterizado pelo fato de que é para regular o crescimento de plantas.

10. Uso das composições, como definidas na reivindicação 7 ou 8, caracterizado pelo fato de que é para regular o crescimento de plantas.

11. Uso, de acordo com a reivindicação 9 ou 10, caracterizado pelo fato de que é para combater plantas em culturas de plantas especiais ou como regulador de proteção de plantas.