



República Federativa do Brasil
Ministério da Indústria, Comércio Exterior
e Serviços
Instituto Nacional da Propriedade Industrial

(11) PI 0806307-9 B1

(22) Data do Depósito: 10/01/2008

(45) Data de Concessão: 06/02/2018



(54) Título: COMPOSTOS SERINAMIDAS SUBSTITUÍDAS POR HETEROAROILA, PROCESSO PARA PREPARAR OS MESMOS, E, COMPOSIÇÃO COMPREENDENDO COMPOSTOS SERINAMIDAS SUBSTITUÍDAS POR HETEROAROILA

(51) Int.Cl.: C07C 237/00; C07D 231/14; C07D 277/56; C07D 307/68; C07D 333/38; C07D 401/12; C07D 403/12; C07D 405/12; C07D 409/12; C07F 7/18; A01N 43/56; A01N 47/12; A01N 47/16; A01N 47/38; A01N 55/00

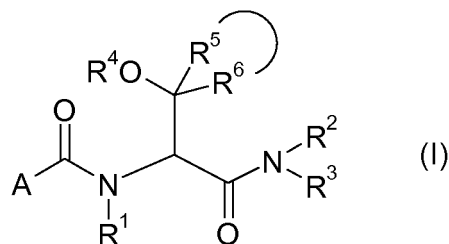
(30) Prioridade Unionista: 11/01/2007 EP 07100427.9

(73) Titular(es): BASF SE

(72) Inventor(es): MATTHIAS WITSCHEL; DSCHUN SONG; EIKE HUPE; TREVOR WILLIAM NEWTON; WILLIAM KARL MOBERG; LILIANA PARRA RAPADO; FRANK STELZER; ANDREA VESCOVI; ROBERT REINHARD; BERND SIEVERNICH; KLAUS GROSSMANN; THOMAS EHRHARDT

“COMPOSTOS SERINAMIDAS SUBSTITUÍDAS POR HETEROAROILA,
 PROCESSO PARA PREPARAR OS MESMOS, E, COMPOSIÇÃO
 COMPREENDENDO COMPOSTOS SERINAMIDAS SUBSTITUÍDAS POR
 HETEROAROILA”

5 A invenção diz respeito a serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I)



em que as variáveis são da forma definida a seguir:

A é heteroarila de 5 ou 6 membros tendo um a quatro átomos de nitrogênio ou um a três átomos de nitrogênio e um átomo de oxigênio ou enxofre ou um átomo de oxigênio ou enxofre, cujo heteroarila pode ser
 10 parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em ciano, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ e alcóxi C₁-C₆-alquila C₁-C₄;

R¹, R² são hidrogênio, hidroxila ou alcóxi C₁-C₆;

15 R³ é alquila C₁-C₆, cianoalquila C₁-C₄ ou haloalquila C₁-C₆;

R⁴ é hidrogênio, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquenila C₃-C₆, alquinila C₃-C₆, haloalquenila C₃-C₆, haloalquinila C₃-C₆, formila, alquilcarbonila C₁-C₆, cicloalquilcarbonila C₃-C₆, alquenilcarbonila C₂-C₆, alquinilcarbonila C₂-C₆, alcóxicarbonila C₁-C₆, alqueniloxicarbonila C₃-C₆, alquiniloxicarbonila C₃-C₆,
 20 aminocarbonila, alquilaminocarbonila C₁-C₆, alquenilaminocarbonila C₃-C₆, alquinilaminocarbonila C₃-C₆, alquilsulfonilaminocarbonila C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, N-(alquenil C₃-C₆)-N-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, N-alquinil C₃-C₆-N-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, N-(alcóxi C₁-C₆)-N-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, N-(alquenil C₃-C₆)-N-(alcóxi C₁-C₆)aminocarbonila, N-alquinil
 25 C₃-C₆-N-(alcóxi C₁-C₆)aminocarbonila, alquilaminotiocarbonila (C₁-C₆), di-(alquil C₁-

C₆)aminotiocarbonila, (alquil C₁-C₆)-cianoimino, (amino)cianoimino, [(alquil C₁-C₆)amino]cianoimino, [di(alquil C₁-C₆)-amino]cianoimino, alquilcarbonil C₁-C₆-alquila C₁-C₆, alcoxiimino C₁-C₆-alquila C₁-C₆, N-(alquilamino C₁-C₆)imino-alquila C₁-C₆, N-(di-alquilamino C₁-C₆)imino-alquila C₁-C₆ ou tri-alquilsilila C₁-C₄,

onde os radicais alquila, cicloalquila e alcóxi mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, hidroxila, cicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₆-alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄-alcóxi C₁-C₄-alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-amino, alquil C₁-C₄-alcoxicarbonilamino C₁-C₄, alquilcarbonila C₁-C₄, hidroxicarbonila, alcóxicarbonila C₁-C₄, aminocarbonila, alquilaminocarbonila C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)aminocarbonila ou alquilcarbonilóxi C₁-C₄;

fenila, fenil-alquila C₁-C₆, fenilcarbonila, fenilcarbonil-alquila C₁-C₆, fenoxicarbonila, fenilaminocarbonila, fenilsulfonilaminocarbonila, N-(alquil C₁-C₆)-N-(fenil)aminocarbonila, fenil-alquilcarbonila C₁-C₆,

onde o radical fenila pode ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar 1 a 3 dos seguintes grupos: nitro, ciano, alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄ ou haloalcóxi C₁-C₄; ou

SO₂R⁷;

R⁵ e R⁶ junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3-12 membros que é carbocíclico ou contém 1 a 3 átomos de nitrogênio, 0 a 3 átomos de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou enxofre, 0 a 2 átomos de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 3 átomos de oxigênio ou enxofre, 2 átomos de oxigênio e 1 átomo de enxofre, ou 1 átomo de oxigênio e 2 átomos de enxofre, onde o anel é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio,

ciano, nitro, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquenila C₃-C₆, alquinila C₃-C₆, haloalquenila C₃-C₆, haloalquinila C₃-C₆, hidroxila, alcóxi C₁-C₆, alquenilóxi C₃-C₆, alquinilóxi C₃-C₆, trialquilsililóxi, formila, alquil C₁-C₆-carbonila, cicloalquilcarbonila C₃-C₆, alquenilcarbonila C₂-C₆, alquinilcarbonila C₂-C₆, alcoxycarbonila C₁-C₆, alqueniloxicarbonila C₃-C₆, alquiniloxicarbonila C₃-C₆, aminocarbonila, alquilaminocarbonila C₁-C₆, alquenilamino C₃-C₆-carbonila, alquinilaminocarbonila C₃-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-aminocarbonila, N-(alquenil C₃-C₆)-N-(alquil C₁-C₆)-aminocarbonila, N-alquinil C₃-C₆-N-(alquil C₁-C₆)-aminocarbonila, N-(alcóxi C₁-C₆)-N-(alquil C₁-C₆)-amino-carbonila, N-(alquenil C₃-C₆)-N-(alcóxi C₁-C₆)-aminocarbonila, N-alquinil C₃-C₆-N-(alcóxi C₁-C₆)-aminocarbonila, di-(alquil C₁-C₆)-amino-tiocarbonila, alcoxiiimino C₁-C₆-alquila C₁-C₆, N-(alquilamino C₁-C₆)-imino-alquila C₁-C₆ ou N-(di-alquilamino C₁-C₆)-imino-alquila C₁-C₆, amino, formilamino, alquilcarbonilamino C₁-C₆, alcoxycarbonilamino C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, formil-alquilamino C₁-C₆, alquilcarbonil C₁-C₆-alquilamino C₁-C₆, alcoxycarbonil C₁-C₆-alquilamino C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)amino, amino-carbonilamino, alquilamino C₁-C₆-carbonilamino, di(C₁-C₆)-alquilamino-carbonilamino, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, alquilsulfonilóxi, alquilsulfonilamino, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfamino C₁-C₆, alquil C₁-C₆-alquilsulfimino C₁-C₆, carbonila, tiocarbonila, imino, alquilimino, hidróxi-imino, alcoxiiimino, aminoimino, alquilaminoimino, di-(alquil)aminoimino, alquilcarbonilaminoimino, alquilsulfonilaminoimino, vinilidenila C₁-C₆, alcoxivinilideno C₁-C₆, di-alquilaminovinilideno C₁-C₆, onde os radicais alquila, cicloalquila e alcóxi mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, hidroxila, cicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-amino, alquilcarbonila C₁-C₄, hidróxi-carbonila, alcóxicarbonila C₁-C₄, aminocarbonila, alquilamino C₁-C₄-carbonila, di-(alquil C₁-C₄)-aminocarbonila ou alquilcarbonilóxi C₁-C₄, fenila,

fenil-alquila C_1-C_6 , fenilcarbonila, fenilcarbonil-alquila C_1-C_6 ,
 fenoxicarbonila, fenilaminocarbonila, fenilsulfonilaminocarbonila, N-(alquil
 C_1-C_6)-N-(fenil)-aminocarbonila, fenil-alquilcarbonila C_1-C_6 , heterociclila,
 heterociclil-alquila C_1-C_6 , heterociclilcarbonila, heterociclil-
 5 sulfonilaminocarbonila; heterociclilcarbonil-alquila C_1-C_6 , heterociclilóxi-
 carbonila, heterociclilaminocarbonila, N-(alquil C_1-C_6)-N-
 (heterociclil)-aminocarbonila, ou heterociclil-alquilcarbonila C_1-C_6 , onde o
 radical fenila e o heterociclila dos 17 últimos substituintes mencionados
 podem ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três
 10 dos seguintes grupos: nitro, ciano, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alcóxi C_1-
 C_4 ou haloalcóxi C_1-C_4 ;

e onde o anel é monocíclico ou fundido a um outro anel
 saturado, parcialmente insaturado ou completamente insaturado de 3 a 7
 membros que é carbocíclico ou contém 1 a 3 átomos de nitrogênio, 0 a 2
 15 átomos de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 ou 1
 átomo de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou átomos de enxofre, 0 ou 1
 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre, 2 átomos de
 oxigênio e 1 átomo de enxofre, ou 1 átomo de oxigênio e 2 átomos de
 enxofre,

20 onde o anel fundido é não substituído ou substituído por 1 a 3,
 no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do
 grupo que consiste em halogênio, ciano, nitro, alquila C_1-C_6 , alquenila C_3-C_6 ,
 haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_3-C_6 , haloalquinila C_3-C_6 , hidroxila, alcóxi
 C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 e alquilsulfonila C_1-C_6 ,

25 e onde o anel não é ligado ou ligado por uma cadeia saturada
 ou insaturada de 1 a 4 membros que não contém nenhum heteroátomo ou
 contém 1 a 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de
 oxigênio ou 1 átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 2 átomos de
 oxigênio ou 2 átomos de enxofre, ou 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de

oxigênio e 1 átomo de enxofre,

onde a ponte é não substituída ou substituída por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, ciano, nitro, alquila C₁-C₆, alquenila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquinila C₃-C₆, haloalquinila C₃-C₆, hidroxila, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ e alquilsulfonila C₁-C₆;

R⁷ é alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆ ou fenila,

onde o radical fenila pode ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆ ou alcóxi C₁-C₆;

e seus sais agricolamente usados.

Além disso, a invenção diz respeito a processos e intermediários para preparar compostos da fórmula (I), a agentes compreendendo-os e ao uso destes compostos ou dos agentes compreendendo-os para combater plantas nocivas.

Derivados de aminoácido substituído por tienila ativo fungicidamente que carregam, na posição A, um radical alquila que pode opcionalmente ser substituído por hidróxi ou alcóxi são descritos, inter alia, em EP 450 355.

Também conhecidos da literatura, por exemplo, da US 5.346.907, WO 96/012499 e WO 021069905, são derivados de serina tendo atividade farmacêutica que, na posição A, podem inter alia, carregar um radical alquila que pode opcionalmente ser substituído por hidroxila ou alcóxi.

Derivados de serina herbicidamente ativos são conhecidos, por exemplo, de WO 03/45878, WO 03/66576, WO 05/061464, WO 051061443, WO 06/29829 e WO 06/29828.

Entretanto, em muitos casos os compostos conhecidos não são completamente satisfatórios, por exemplo, com relação à taxa de aplicação,

espectro de atividade, duração da atividade, compatibilidade com plantas da lavoura, tendência a desenvolver resistência ou aspectos econômicos do processo de preparação.

5 Desta forma, é um objetivo da presente invenção fornecer compostos inéditos, em particular herbicidamente ativos tendo melhores propriedades.

Observou-se que este objetivo é alcançado pelas serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) e sua ação herbicida.

10 Além do mais, observou-se agentes herbicidas que compreendem os compostos (I) e têm muito boa ação herbicida. Além disso, observou-se processos para preparar estes agentes e processos para combater vegetação indesejada usando os compostos (I).

15 Dependendo do padrão de substituição, os compostos da fórmula (I) compreendem dois ou mais centros de quiralidade, em cujo caso eles estão presentes como enantiômeros ou mistura de diastereômeros. A invenção fornece tanto enantiômeros puros quanto diastereômeros e suas misturas.

20 Os compostos da fórmula (I) também podem estar presentes na forma de seus sais agricolamente usados, a natureza do sal sendo não material. Sais adequados são, no geral, os cátions ou os sais de adição de ácido dos ácidos cujos cátions e ânions, respectivamente, não têm nenhum efeito adverso na ação herbicida dos compostos (I).

25 Cátions adequados são, em particular, os íons dos metais alcalinos, preferivelmente lítio, sódio e potássio, dos metais alcalinos terrosos, preferivelmente cálcio e magnésio, e dos metais de transição, preferivelmente manganês, cobre, zinco e ferro, e também amônio, onde, se desejado, um a quatro átomos de hidrogênio podem ser substituídos por alquila C₁-C₄, hidróxi-alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄-alquila C₁-C₄, hidróxi-alcóxi C₁-C₄-alquila C₁-C₄, fenila ou benzila, preferivelmente amônio, dimetilamônio,

diisopropilamônio, tetrametilamônio, tetrabutilamônio, 2-(2-hidroxiet-1-óxi)et-1-ilamônio, di-(2-hidroxiet-1-il)amônio, trimetilbenzilamônio, além de íons fosfônio, íons sulfônio, preferivelmente tri(alquil C₁-C₄)sulfônio, e íons sulfoxônio, preferivelmente tri(alquil C₁-C₄)sulfoxônio.

5 Ânions de sais de adição de ácido usados são principalmente cloreto, brometo, fluoreto, hidrogenossulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorossilicato, hexafluorofosfato, benzoato, e os ânions dos ácidos alcanóicos C₁-C₄, preferivelmente formiato, acetato, propionato e butirato.

10 “Fundido” no sentido da invenção significa que dois anéis compartilham pelo menos um átomo. Assim, além dos sistemas condensados, a definição também inclui sistemas que são espirociclicamente ligados.

 As frações orgânicas mencionadas para os substituinte R¹-R⁷ ou como radicais em anéis de fenila, arila, heteroarila ou heterociclila são
 15 termos coletivos para enumerações individuais dos membros do grupo específicos. Todas as cadeias de hidrocarboneto, isto é, todas as frações alquila, alquilsilila, alquenila, alquinila, cianoalquila, haloalquila, haloalquenila, haloalquinila, alcóxi, haloalcóxi, alcóxi-alquila, alcóxi-alcóxi-alquila, alquilcarbonila, alquenilcarbonila, alquinilcarbonila,
 20 alcóxi-carbonila, alqueniloxycarbonila, alquiniloxycarbonila, alquilamino, alquilsulfonilamino, haloalquilsulfonilamino, alquilalcoxicarbonilamino, alquilaminocarbonila, alquenilaminocarbonila, alquinilaminocarbonila, alquilsulfonilaminocarbonila, dialquilaminocarbonila, N-alquenil-N-alquilaminocarbonila, N-alquinil-N-alquilamino-carbonila, N-alcóxi-N-alquilamina-carbonila,
 25 alquenil-N-alcóxi-aminocarbonila, N-alquinil-N-alcóxi-aminocarbonila, dialquilaminotiocarbonila, alquilcarbonilalquila, alcóxi-iminoalquila, N-(alquilamino)iminoalquila, N-(dialquilamino)iminoalquila, alquilcianoimino, alquilaminocianoimino, dialquilaminocianoimino, formilaminoalquila, alcóxi-carbonilaminoalquila,

(alquilamino)carboniloxialquila, (alquilamino)carbonilaminoalquila,
 (dialquilamino)carbonilaminoalquila, fenilcarbonil-aminoalquila, fenilalquila,
 fenilcarbonilalquila, N-alquil-N-fenilaminocarbonila, fenilalquilcarbonila,
 arilalquila, heterociclilalquila, heterociclilcarbonilalquila, N-alquil-N-
 5 heterociclilaminocarbonila, heterociclilalquilcarbonila, alquiltio e
 alquilcarbonilóxi podem ser de cadeia reta ou ramificada.

A menos que de outra forma indicado, substituintes
 halogenados preferivelmente carregam um a cinco átomos de halogênio
 idênticos ou diferentes. O termo halogênio denota, em cada caso, flúor, cloro,
 10 bromo ou iodo.

Exemplos de outros significados são:

- alquila C_1-C_4 e as frações alquila de tri-alquilsilila C_1-C_4 ,
 alquilcarbonilóxi C_1-C_4 , alquil C_1-C_4 -alcoxicarbonilamino C_1-C_4 ,
 alquiliminoóxi C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 -alcóxi C_1-C_4 -alquila C_1-C_4 ,
 15 alcóxi C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , alquenilóxi C_2-C_6 -alquila C_1-C_4 , alquinilóxi C_2-
 C_6 -alquila C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , haloalquenilóxi C_2-C_6-
 alquila C_1-C_4 , haloalquinilóxi C_2-C_6 -alquila C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_6 -alcóxi C_1-C_4-
 alquila C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 alquila C_1-C_6 , alqueniltio C_2-C_6 -alquila C_1-C_4 ,
 alquiniltio C_2-C_6 -alquila C_1-C_4 , alquilsulfinil C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 ,
 20 haloalquilsulfinil C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , alquilsulfonyl C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 ,
 haloalquilsulfonyl C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , amino-alquila C_1-C_4 , alquilamino C_1-
 C_6 -alquila C_1-C_4 , di(alquil C_1-C_6)amino-alquila C_1-C_4 , formil-amino-alquila
 C_1-C_4 , alcoxicarbonilamino C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , alquilsulfonyl C_1-C_6 -amino-
 alquila C_1-C_4 , alquilsulfonyl C_1-C_6 -(alquilamino C_1-C_6)-alquila C_1-C_4 ,
 25 hidroxicarbonil-alquila C_1-C_4 , alcoxicarbonil C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 ,
 haloalcoxicarbonil C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , alquilcarbonilóxi C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 ,
 aminocarbonil-alquila C_1-C_4 , alquilaminocarbonil C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 ,
 di(alquil C_1-C_6)aminocarbonil-alquila C_1-C_4 , [(alquil C_1-
 C_6)aminocarbonilamino]-alquila C_1-C_4 , [di(alquil C_1-

C_6)aminocarbonilamino]-alquila C_1-C_4 , alquilcarbonilamino C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , alquilcarbonil C_1-C_6 -(alquilamino C_1-C_6)-alquila C_1-C_4 , [(alquil C_1-C_6)aminocarbonilóxi]-alquila C_1-C_4 , [di(alquil C_1-C_6)amino-carbonilóxi]alquila C_1-C_4 , (di[di(alquil C_1-C_6)amino]carbonilóxi)-alquila C_1-C_4 , hetero-ciclil-alquila C_1-C_4 , fenil-alquila C_1-C_4 , fenilcarbonilamino-alquila C_1-C_4 , fenil-alquila C_1-C_4 , fenilcarbonil-alquila C_1-C_4 , heteroarilcarbonil-alquila C_1-C_4 , heteroarilcarbonilóxi-alquila C_1-C_4 , heteroariloxicarbonil-alquila C_1-C_4 , heteroarilóxi-alquila C_1-C_4 , heteroariltio-alquila C_1-C_4 , heteroarilsulfinil-alquila C_1-C_4 , heteroarilsulfonil-alquila C_1-C_4 , e aril(alquil C_1-C_4): por exemplo, metila, etila, n-propila, 1-metiletila, n-butila, 1-metilpropila, 2-metilpropila e 1,1-dimetiletila;

- alquila C_1-C_6 e as frações alquila de cianoalquila C_1-C_6 , alcoxicarbonil C_1-C_6 -alquila C_1-C_6 , alquilsulfonilamino C_1-C_6 , alquilsulfonilaminocarbonila C_1-C_6 , N-(alquenil C_3-C_6)-N-(alquil C_1-C_6)aminocarbonila, N-alquinil C_3-C_6 -N-(alquil C_1-C_6)amino-carbonila, N-(alcóxi C_1-C_6)-N-(alquil C_1-C_6)aminocarbonila, alquilcarbonil C_1-C_6 -alquila C_1-C_6 , alcoxiimino C_1-C_6 -alquila C_1-C_6 , N-(alquilamino C_1-C_6)imino-alquila C_1-C_6 , N-(di-alquilamino C_1-C_6)imino-alquila C_1-C_6 , (alquil C_1-C_6)cianoimino, fenil-alquila C_1-C_6 , fenilcarbonil-alquila C_1-C_6 , N-(alquil C_1-C_6)-N-fenilaminocarbonila, heterociclil-alquila C_1-C_6 , heterociclilcarbonil- C_1-C_6 -alquila e N-(alquil C_1-C_6)-N-heterociclilaminocarbonila e alquilaminotiocarbonila (C_1-C_6):

alquila C_1-C_4 da forma mencionada anteriormente, e também, por exemplo, n-pentila, 1-metil-butila, 2-metilbutila, 3-metilbutila, 2,2-dimetilpropila, 1-etilpropila, n-hexila, 1,1-dimetilpropila, 1,2-dimetilpropila, 1-metilpentila, 2-metilpentila, 3-metilpentila, 4-metilpentila, 1,1-dimetilbutila, 1,2-dimetilbutila, 1,3-di-metilbutila, 2,2-dimetilbutila, 2,3-dimetilbutila, 3,3-dimetilbutila, 1-etil-butila, 2-etilbutila, 1,1,2-trimetilpropila, 1-etil-1 - metilpropila e 1-etil-3-metilpropila;

- alquilcarbonila C_1-C_4 : por exemplo, metilcarbonila, etilcarbonila, propilcarbonila, 1-metiletilcarbonila, butilcarbonila, 1-metilpropilcarbonila, 2-metilpropilcarbonila ou 1,1-dimetiletilcarbonila;

5 - alquilcarbonila C_1-C_6 , e os radicais alquilcarbonila de alquilcarbonil C_1-C_6 -alquila C_1-C_6 , alquilcarbonilóxi C_1-C_6 -alquila C_1-C_6 , alquilcarbonilamino C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , fenil-alquilcarbonil C_1-C_6 heterociclil-alquilcarbonila C_1-C_6 , alquilcarbonil C_1-C_6 -(alquilamino C_1-C_6)-alquila C_1-C_4 :

10 - alquilcarbonila C_1-C_4 da forma mencionada anteriormente, e também, por exemplo, pentilcarbonila, 1-metilbutilcarbonila, 2-metilbutilcarbonila, 3-metilbutilcarbonila, 2,2-dimetilpropilcarbonila, 1-etilpropilcarbonila, hexilcarbonila, 1,1-dimetilpropilcarbonila, 1,2-dimetilpropilcarbonila, 1-metilpentilcarbonila, 2-metilpentilcarbonila, 3-metilpentilcarbonila, 4-metilpentilcarbonila, 1,1-dimetilbutilcarbonila, 1,2-dimetilbutilcarbonila, 1,3-dimetilbutilcarbonila, 2,2-dimetilbutilcarbonila, 2,3-dimetilbutilcarbonila, 3,3-dimetilbutilcarbonila, 1-etilbutilcarbonila, 2-etilbutilcarbonila, 1,1,2-trimetilpropilcarbonila, 1,2,2-trimetilpropilcarbonila, 1-etil-1-metilpropilcarbonila ou 1-etil-2-metilpropilcarbonila;

20 - cicloalquila C_3-C_6 e as frações cicloalquila de cicloalquilcarbonila C_3-C_6 : hidrocarboneto saturado monocíclico tendo 3 a 6 membros do anel, tais como ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila e cicloexila;

25 - cicloalquenila C_3-C_6 : por exemplo, 1-ciclopropenila, 2-ciclopropenila, 1-ciclobutenila, 2-ciclobutenila, 1-ciclopentenila, 2-ciclopentenila, 1,3-ciclopentadienila, 1,4-ciclopentadienila, 2,4-ciclopentadienila, 1-cicloexenila, 2-cicloexenila, 3-cicloexenila, 1,3-cicloexadienila, 1,4-cicloexadienila, 2,5-cicloexadienila, alquenila C_3-C_6 e as frações alquenila de alqueniloxicarbonila C_3-C_6 , alquenilaminocarbonila C_3-C_6 , N-(alquenil C_3-C_6)-N-(alquil C_1-C_6)aminocarbonila e N-(alquenil C_3-C_6)-N-(alcóxi C_1-C_6)aminocarbonila: por exemplo, 1-propenila, 2-propenila, 1-

metil-1-propenila, 1-butenila, 2-butenila, 3-butenila, 1-metil-1-propenila, 2-metil-1-propenila, 1-metil-2-propenila, 2-metil-2-propenila, 1-pentenila, 2-pentenila, 3-pentenila, 4-pentenila, 1-metil-1-butenila, 2-metil-1-butenila, 3-metil-1-butenila, 1-metil-2-butenila, 2-metil-2-butenila, 3-metil-2-butenila, 1-metil-3-butenila, 2-metil-3-butenila, 3-metil-3-butenila, 1,1-dimetil-2-propenila, 1,2-dimetil-1-propenila, 1,2-dimetil-2-propenila, 1-etil-1-propenila, 1-etil-2-propenila, 1-hexenila, 2-hexenila, 3-hexenila, 4-hexenila, 5-hexenila, 1-metil-1-pentenila, 2-metil-1-pentenila, 3-metil-1-pentenila, 4-metil-1-pentenila, 1-metil-2-pentenila, 2-metil-2-pentenila, 3-metil-2-pentenila, 4-metil-2-pentenila, 1-etil-3-pentenila, 2-metil-3-pentenila, 3-metil-3-pentenila, 4-metil-3-pentenila, 1-metil-4-pentenila, 2-metil-4-pentenila, 3-metil-4-pentenila, 4-metil-4-pentenila, 1,1-dimetil-2-butenila, 1,1-dimetil-3-butenila, 1,2-dimetil-1-butenila, 1,2-dimetil-2-butenila, 1,2-dimetil-3-butenila, 1,3-dimetil-1-butenila, 1,3-dimetil-2-butenila, 1,3-dimetil-3-butenila, 2,2-dimetil-3-butenila, 2,3-dimetil-1-butenila, 2,3-dimetil-2-butenila, 2,3-dimetil-3-butenila, 3,3-dimetil-1-butenila, 3,3-dimetil-2-butenila, 1-etil-1-butenila, 1-etil-2-butenila, 1-etil-3-butenila, 2-etil-1-butenila, 2-etil-2-butenila, 2-etil-3-butenila, 1,1,2-trimetil-2-propenila, 1-etil-1-metil-2-propenila, 1-etil-2-metil-1-propenila e 1-etil-2-metil-2-propenila;

20 - alquenila C_2-C_6 e as frações alquenila de alquenilcarbonila C_2-C_6 , alquenilóxi C_2-C_6 -alquila C_1-C_4 , alqueniltio C_2-C_6 -alquila C_1-C_4 , fenilalquenila C_2-C_4 , heteroarilalquenila C_2-C_4 : alquenila C_3-C_6 da forma mencionada anteriormente, e também etenila;

25 - alquinila C_3-C_6 e as frações alquinila de alquiniloxicarbonila C_3-C_6 , alquinilaminocarbonila C_3-C_6 , N-alquinil C_3-C_6 -N-(alquil C_1-C_6)aminocarbonila, N-alquinil C_3-C_6 -N-(alcóxi C_1-C_6)aminocarbonila: por exemplo, 1-propinila, 2-propinila, 1-butinila, 2-butinila, 3-butinila, 1-metil-2-propinila, 1-pentinila, 2-pentinila, 3-pentinila, 4-pentinila, 1-metil-2-butinila, 1-metil-3-butinila, 2-metil-3-butinila, 3-metil-1-butinila, 1,1-dimetil-2-

propinila, 1 -etil-2-propinila, 1 -hexinila, 2-hexinila, 3-hexinila, 4-hexinila, 5-hexinila, 1-metil-2-pentinila, 1-metil-3-pentinila, 1-metil-4-pentinila, 2-metil-3-pentinila, 2-metil-4-pentinila, 3-metil-1 -pentinila, 3-metil-4-pentinila, 4-metil-1-pentinila, 4-metil-2-pentinila, 1,1-dimetil-2-butinila, 1,1-dimetil-3-butinila, 1,2-dimetil-3-butinila, 2,2-dimetil-3-butinila, 3,3-dimetil-1-butinila, 1-etil-2-butinila, 1-etil-3-butinila, 2-etil-3-butynila e 1-etil-1 -metil-2-propinila;

- alquinila C_2-C_6 e as frações alquinila de alquinilcarbonila C_2-C_6 , alquinilóxi C_2-C_2 -alquila C_1-C_4 , alquiniltio C_2-C_6 -alquila C_1-C_4 , fenilalquinila C_2-C_4 , heteroaril- alquinila C_2-C_4 : alquinila C_3-C_6 da forma mencionada anteriormente, e também etinila;

- cianoalquila C_1-C_4 : por exemplo, cianometila, 1-cianoet- 1 -ila, 2-cianoet- 1 -ila, 1-cianoprop-1-ila, 2-cianoprop-1-ila, 3-cianoprop-1-ila, 1-cianoprop-2-ila, 2-cianoprop-2-ila, 1-cianobut-1 -ila, 2-cianobut- 1 -ila, 3-cianobut-1 -ila, 4-cianobut-1-ila, 1-cianobut-2-ila, 2-cianobut-2-ila, 1-cianobut-3-ila, 2-cianobut-3-ila, 1-ciano-2-metilprop-3-ila, 2-ciano-2-metilprop-3-ila, 3-ciano-2-metilprop-3-ila e 2-cianometilprop-2-ila;

- hidroxialquila C_1-C_4 e as frações hidroxialquila C_1-C_4 de fenil- hidroxialquila C_1-C_4 , heteroaril- hidroxialquila C_1-C_4 : por exemplo, hidroximetila, 1-hidroxiet-1-ila, 2-hidroxibut-1-ila, 1 -hidroxiprop-1 -ila, 2-hidroxiprop- 1 -ila, 3-hidroxiprop- 1 -ila, 1 -hidroxiprop-2-ila, 2-hidroxiprop-2-ila, 1-hidroxibut-1-ila, 2-hidroxibut-1 -ila, 3-hidroxibut-1-ila, 4-hidroxibut-1 -ila, 1-hidroxibut-2-ila, 2-hidroxibut-2-ila, 1 -hidroxibut-3-ila, 2-hidroxibut-3-ila, 1-hidróxi-2-metilprop-3-ila, 2-hidróxi-2-metilprop-3-ila, 3-hidróxi-2-metilprop-3-ila e 2-hidroximetilprop-2-ila, 1,2-diidroxietila, 1,2-diidroxiprop-3-ila, 2,3-diidroxiprop-3-ila, 1,2-diidroxiprop-2-ila, 1,2-diidroxibut-4-ila, 2,3-diidroxibut-4-ila, 3,4-diidroxibut-4-ila, 1,2-diidroxibut-2-ila, 1,2-diidroxibut-3-ila, 2,3-diidroxibut-3-ila, 1,2-diidróxi-2-metilprop-3-ila, 2,3-diidróxi-2-metilprop-3-ila;

- hidroxialquila C₁-C₆: hidroxialquila C₁-C₄ da forma mencionada anteriormente, e também, por exemplo, 1-hidroxipent-5-ila, 2-hidroxipent-5-ila, 3-hidroxipent-5-ila, 4-hidroxipent-5-ila, 5-hidroxipent-5-ila, 1-hidroxipent-4-ila, 2-hidroxipent-4-ila, 3-hidroxipent-4-ila, 4-hidroxipent-4-ila, 1-hidroxipent-3-ila, 2-hidroxipent-3-ila, 3-hidroxipent-3-ila, 1-hidróxi-2-metilbut-3-ila, 2-hidróxi-2-metilbut-3-ila, 3-hidróxi-2-metilbut-3-ila, 1-hidróxi-2-metilbut-4-ila, 2-hidróxi-2-metilbut-4-ila, 3-hidróxi-2-metilbut-4-ila, 4-hidróxi-2-metilbut-4-ila, 1-hidróxi-3-metilbut-4-ila, 2-hidróxi-3-metilbut-4-ila, 3-hidróxi-3-metilbut-4-ila, 4-hidróxi-3-metilbut-4-ila, 1-hidroxihex-6-ila, 2-hidroxihex-6-ila, 3-hidroxihex-6-ila, 4-hidroxihex-6-ila, 5-hidroxihex-6-ila, 6-hidroxihex-6-ila, 1-hidróxi-2-metilpent-5-ila, 2-hidróxi-2-metilpent-5-ila, 3-hidróxi-2-metilpent-5-ila, 4-hidróxi-2-metilpent-5-ila, 5-hidróxi-2-metilpent-5-ila, 1-hidróxi-3-metilpent-5-ila, 2-hidróxi-3-metilpent-5-ila, 3-hidróxi-3-metilpent-5-ila, 4-hidróxi-3-metilpent-5-ila, 5-hidróxi-3-metilpent-5-ila, 1-hidróxi-4-metilpent-5-ila, 2-hidróxi-4-metilpent-5-ila, 3-hidróxi-4-metilpent-5-ila, 4-hidróxi-4-metilpent-5-ila, 5-hidróxi-4-metilpent-5-ila, 1-hidróxi-5-metilpent-5-ila, 2-hidróxi-5-metilpent-5-ila, 3-hidróxi-5-metilpent-5-ila, 4-hidróxi-5-metilpent-5-ila, 5-hidróxi-5-metilpent-5-ila, 1-hidróxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 2-hidróxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 3-hidróxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 4-hidróxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 1,2-diidroxi-pent-5-ila, 2,3-diidroxi-pent-5-ila, 3,4-diidroxi-pent-5-ila, 4,5-diidroxi-pent-5-ila, 1,2-diidroxi-pent-4-ila, 2,3-diidroxi-pent-4-ila, 3,4-diidroxi-pent-4-ila, 4,5-diidroxi-pent-4-ila, 1,2-diidroxi-pent-3-ila, 2,3-diidroxi-pent-3-ila, 1,2-diidroxi-2-metilbut-3-ila, 2,3-diidroxi-2-metilbut-3-ila, 3,4-diidroxi-2-metilbut-3-ila, 2-hidróxi-2-hidroximetilbut-3-ila, 1,2-diidroxi-2-metilbut-4-ila, 2,3-diidroxi-2-metilbut-4-ila, 3,4-diidroxi-2-metilbut-4-ila, 1,2-diidroxi-3-metilbut-4-ila, 2,3-diidroxi-3-metilbut-4-ila, 3,4-diidroxi-3-metilbut-4-ila, 3-hidróxi-3-hidroximetilbut-4-ila, 1,2-diidroxi-hex-6-ila, 2,3-diidroxi-hex-6-ila, 3,4-diidroxi-hex-6-ila, 4,5-diidroxi-hex-6-ila, 5,6-diidroxi-hex-6-ila, 1,2-diidroxi-2-metilpent-5-ila, 2,3-

diidróxi-2-metilpent-5-ila, 3,4-di-hidróxi-2-metilpent-5-ila, 4,5-diidróxi-2-
 metilpent-5-ila, 2-hidróxi-2-hidroximetilpent-5-ila, 1,2-diidróxi-3-metilpent-
 5-ila, 2,3-diidróxi-3-metilpent-5-ila, 3,4-diidróxi-3-metilpent-5-ila, 4,5-
 diidróxi-3-metilpent-5-ila, 3-hidróxi-3-hidroximetilpent-5-ila, 1,2-diidróxi-4-
 5 metilpent-5-ila, 2,3-diidróxi-4-metilpent-5-ila, 3,4-diidróxi-4-metilpent-5-ila,
 4,5-diidróxi-4-metilpent-5-ila, 4-hidróxi-4-hidroximetilpent-5-ila, 1,2-
 diidróxi-5-metilpent-5-ila, 2,3-di-hidróxi-5-metilpent-5-ila, 3,4-diidróxi-5-
 metilpent-5-ila, 4,5-diidróxi-5-metilpent-5-ila, 5-hidróxi-5-hidroximetilpent-
 5-ila, 1,2-diidróxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 2,3-diidróxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 3,4-
 10 diidróxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 2-hidróxi-2-hidroximetil-3-metilbut-4-ila, 3-
 hidróxi-3-hidroximetil-2-metilbut-4-ila;

- haloalquila C_1-C_4 e as frações haloalquila de fenil-haloalquila
 C_1-C_4 , heteroaril- haloalquila C_1-C_4 : um radical alquila C_1-C_4 da forma
 mencionada anteriormente que é parcial ou completamente substituído por
 15 flúor, cloro, bromo e/ou iodo, isto é, por exemplo, clorometila, diclorometila,
 triclorometila, fluorometila, difluorometila, trifluorometila, clorofluorometila,
 diclorofluorometila, clorodifluorometila, bromometila, iodometila, 2-
 fluoretila, 2-cloroetila, 2-bromoetila, 2-iodoetila, 2,2-difluoretila, 2,2,2-
 trifluoretila, 2-cloro-2-fluoretila, 2-cloro-2,2-difluoretila, 2,2-dicloro-2-
 20 fluoretila, 2,2,2-tricloroetila, pentafluoretila, 2-fluorpropila, 3-fluorpropila,
 2,2-difluorpropila, 2,3-difluorpropila, 2-cloropropila, 3-cloropropila, 2,3-
 dicloropropila, 2-bromopropila, 3-bromopropila, 3,3,3-trifluorpropila, 3,3,3-
 tricloropropila, 2,2,3,3,3-pentafluoropropila, heptafluorpropila, 1 -
 (fluorometil)-2-fluoretila, 1-(clorometil)-2-cloroetila, 1-(bromometil)-2-
 25 bromoetila, 4-fluorobutyla, 4-clorobutyi, 4-bromobutyla, nonafluorobutyla,
 1,1,2,2-tetrafluoretila e 1-trifluorometil-1,2,2,2-tetrafluoretila;

- haloalquila C_1-C_6 e as frações haloalquila de
 haloalquilsulfonilamino C_1-C_6 , haloalquil C_1-C_6 tioalquila C_1-C_4 : haloalquila
 C_1-C_4 da forma mencionada anteriormente, e também, por exemplo, 5-

fluorpentila, 5-cloropentila, 5-bromopentila, 5-iodopentila, undecafluorpentila, 6-fluorexila, 6-cloroexila, 6-bromoexila, 6-iodoexila e tridecafluorexila;

5 - haloalquenila C_3-C_6 : um radical alquenila C_3-C_6 da forma mencionada anteriormente que é parcial ou completamente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, por exemplo, 2-cloroprop-2-en-1-ila, 3-cloroprop-2-en-1-ila, 2,3-dicloroprop-2-en-1-ila, 3,3-dicloroprop-2-en-1-ila, 2,3,3-tricloro-2-en-1-ila, 2,3-diclorobut-2-en-1-ila, 2-bromoprop-2-en-1-ila, 3-bromoprop-2-en-1-ila, 2,3-dibromoprop-2-en-1-ila, 3,3-dibromoprop-2-en-1-ila, 2,3,3-tribromo-2-en-1-ila ou 2,3-dibromobut-2-en-1-ila;

10 - haloalquenila C_2-C_6 e as frações haloalquenila C_2-C_6 de haloalquenilóxi C_2-C_6 -alquila C_1-C_4 , haloalquenila C_2-C_6 -tioalquila C_1-C_4 , fenil- haloalquenila C_2-C_4 , heteroaril- haloalquenila C_2-C_4 : um radical alquenila C_2-C_6 da forma mencionada anteriormente que é parcial ou
15 completamente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, por exemplo, 2-clorovinila, 2-cloroallila, 3-cloroallila, 2,3-dicloroallyl, 3,3-dicloroallila, 2,3,3-tricloroallila, 2,3-diclorobut-2-enila, 2-bromovinila, 2-bromoallila, 3-bromoallila, 2,3-dibromoallila, 3,3-dibromoallila, 2,3,3-tribromoallila ou 2,3-dibromobut-2-enila;

20 - cianoalquenila C_2-C_6 : por exemplo, 2-cianovinila, 2-cianoallila, 3-cianoallila, 2,3-dicianoallila, 3,3-dicianoallila, 2,3,3-tricianoallila, 2,3-dicianobut-2-enila;

25 - hidroxialquenila C_2-C_6 e as frações hidroxila de fenil- hidroxialquenila C_1-C_4 , heteroaril- hidroxialquenila C_1-C_4 : por exemplo, 2-hidroxivinila, 2-hidroxiallila, 3-hidroxiallila, 2,3-diidroxiallila, 3,3-diidroxiallila, 2,3,3-triidroxiallila, 2,3-diidroxibut-2-enila;

- haloalquinila C_3-C_6 : um radical alquinila C_3-C_6 da forma mencionada anteriormente que é parcial ou completamente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, por exemplo, 1,1-difluorprop-2-en-1-ila, 3-

iodoprop-2-in-1-ila, 4-fluorobut-2-in-1 -ila, 4-clorobut-2-in-1-ila, 1, 1-difluorobut-2-in- 1 -ila, 4-iodobut-3-in-1-ila, 5-fluorpent-3-in- 1 -ila, 5-iodopent-4-in-1-ila, 6-fluorex-4-in-1-ila ou 6-iodoex-5-in-1 -ila;

- haloalquinila C_2-C_6 e as frações haloalquinila C_2-C_6 de
 5 haloalquinilóxi C_2-C_6 alquila C_1-C_4 , haloalquinila C_2-C_6 - tioalquila C_1-C_4 ,
 fenil haloalquinila $-C_2-C_4$, heteroaril- haloalquinila C_2-C_4 : um radical
 alquinila C_2-C_6 da forma mencionada anteriormente que é parcial ou
 completamente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, por exemplo,
 1,1-difluorprop-2-in-1-ila, 3-iodoprop-2-in- 1 -ila, 4-fluorobut-2-in-1-ila, 4-
 10 clorobut-2-in- 1 -ila, 1,1-difluorobut-2-in- 1 -ila, 4-iodobut-3-in-1 -ila, 5-
 fluorpent-3-in-1-ila, 5-iodopent-4-in-1-ila, 6-fluorex-4-in-1-ila ou 6-iodoex-5-
 in-1-ila;

- cianoalquinila C_2-C_6 : por exemplo, 1,1-dicianoprop-2-in-1-
 15 1-ila, 3-cianoprop-2-in-1-ila, 4-cianobut-2-in- 1 -ila, 1,1-dicianobut-2-in-1 -ila,
 4-cianobut-3-in-1 -ila, 5-cianopent-3-in-1-ila, 5-cianopent-4-in-1-ila, 6-
 cianohex-4-in-1-ila ou 6-cianohex-5-in-1-ila;

- hidroxialquinila C_2-C_6 e as frações hidróxi de fenil-
 hidroxialquinila C_2-C_4 : por exemplo, 1,1-diidroxioprop-2-in-1-ila, 3-
 hidroxiprop-2-in-1-ila, 4-hidroxibut-2-in-1 -ila, 1, 1-diidroxiibut-2-in- 1 -ila,
 20 4-hidroxibut-3-in- 1 -ila, 5-hidroxipent-3-in-1-ila, 5-hidroxipent-4-in-1-ila, 6-
 hidroxiex-4-in-1-ila ou 6-hidroxiex-5-in-1-ila;

- alquilsulfinila C_1-C_6 (alquil $C_4-C_6-S(=O)-$) e as frações
 alquilsulfinila C_1-C_6 de alquilsulfinil C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 : por exemplo,
 metilsulfinila, etilsulfinila, propilsulfinila, 1-metiletilsulfinila, butilsulfinila,
 25 1-metilpropilsulfinila, 2-metilpropilsulfinila, 1,1-dimetiletilsulfinila,
 pentilsulfinila, 1-metilbutilsulfinila, 2-metilbutilsulfinila, 3-metilbutilsulfinila,
 2,2--dimetilpropilsulfinila, 1-etilpropilsulfinila, 1,1-dimetilpropilsulfinila, 1,2-
 dimetilpropilsulfinila, hexilsulfinila, 1-metilpentil-sulfinila, 2-
 metilpentilsulfinila, 3-metilpentilsulfinila, 4-metilpentilsulfinila, 1,1-

dimetilbutilsulfinila, 1,2-dimetilbutilsulfinila, 1,3-dimetilbutilsulfinila, 2,2-dimetilbutilsulfinila, 2,3-dimetilbutilsulfinila, 3,3-dimetilbutilsulfinila, 1-etilbutilsulfinila, 2-etilbutilsulfinila, 1,1,2-trimetilpropilsulfinila, 1,2,2-trimetilpropilsulfinila, 1-etil-1-metilpropilsulfinila e 1-etil-2-metilpropilsulfinila;

5 - haloalquilsulfinila C₁-C₆ e as frações haloalquilsulfinila C₁-C₆ de haloalquilsulfinil C₁-C₆-alquila C₁-C₄: um radical alquilsulfinila C₁-C₆ da forma mencionada anteriormente que é parcial ou completamente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, La, por exemplo,

10 fluorometilsulfinila, difluorometilsulfinila, trifluorometilsulfinila, clorodifluorometilsulfinila, bromodifluorometilsulfinila, 2 fluoretilsulfinila, 2-cloroetilsulfinila, 2-bromoetilsulfinila, 2-iodoetilsulfinila, 2,2-difluor-etilsulfinila, 2,2,2-trifluoretilsulfinila, 2,2,2-tricloroetilsulfinila, 2-cloro-2-fluoretilsulfinila, 2-cloro-2,2-difluoretilsulfinila, 2,2-dicloro-2-fluoretilsulfinila,

15 pentafluoretilsulfinila, 2-fluorpropilsulfinila, 3fluorpropilsulfinila, 2-cloropropilsulfinila, 3-cloropropilsulfinila, 2-bromopropilsulfinila, 3-bromopropilsulfinila, 2,2-difluorpropilsulfinila, 2,3-difluorpropilsulfinila, 2,3-dicloropropilsulfinila, 3,3,3-trifluorpropilsulfinila, 3,3,3-tricloropropilsulfinila, 2,2,3,3,3-pentafluorpropilsulfinila,

20 heptafluorpropilsulfinila, 1-(fluorometil)-2-fluoretilsulfinila, 1-(clorometil)-2-cloroetilsulfinila, 1-(bromometil)-2-bromoetilsulfinila, 4-fluorobutilsulfinila, 4-clorobutilsulfinila, 4--bromobutilsulfinila, nonafluorobutilsulfinila, 5-fluorpentilsulfinila, 5-cloropentilsulfinila, 5-bromopentilsulfinila, 5-iodopentilsulfinila, undecafluorpentilsulfinila, 6 fluorexilsulfinila, 6-

25 cloroexilsulfinila, 6-bromoexilsulfinila, 6-iodoexilsulfinila e tridecafluorexilsulfinila;

- alquilsulfonila C₁-C₆ (alquil C₁-C₆-S(O)₂-) e as frações alquilsulfonila C₁-C₆ de alquilsulfonil C₁-C₆--alquila C₁-C₄, alquilsulfonilamino C₁-C₆, alquilsulfonilamino C₁-C₆-alquila C₁-C₄,

alquilsulfonil C_1-C_6 --(C_1-C_6 -alquilamino)-alquila C_1-C_4 : por exemplo, metilsulfonila, etilsulfonila, propilsulfonila, 1-metiletilsulfonila, butilsulfonila, 1-metilpropilsulfonila, 2-metilpropilsulfonila, 1,1-dimetiletilsulfonila, pentilsulfonila, 1-metilbutilsulfonila, 2-metilbutilsulfonila, 3-metilbutilsulfonila, 1,1-dimetilpropilsulfonila, 1,2-dimetilpropilsulfonila, 2,2-dimetilpropilsulfonila, 1-etilpropylsulfonila, hexilsulfonila, 1-metilpentilsulfonila, 2--metilpentilsulfonila, 3-metilpentilsulfonila, 4-metilpentilsulfonila, 1,1-dimetilbutilsulfonila, 1,2-dimetilbutilsulfonila, 1,3-dimetilbutilsulfonila, 2,2-dimetilbutilsulfonila, 2,3-dimetilbutilsulfonila, 3,3-dimetilbutilsulfonila, 1-etilbutilsulfonila, 2-etilbutilsulfonila, 1,1,2--trimetilpropilsulfonila, 1,2,2 trimetilpropilsulfonila, 1-etil-1-metilpropilsulfonila e 1-etil--2-metilpropilsulfonila;

- haloalquilsulfonila C_1-C_6 e as frações haloalquilsulfonila C_1-C_6 de haloalquilsulfonil C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , haloalquilsulfonilamino C_1-C_6 : um radical alquilsulfonila C_1-C_6 da forma mencionada anteriormente que é parcial ou completamente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, isto é, por exemplo, fluorometilsulfonila, diflúor-metilsulfonila, trifluorometilsulfonila, clorodifluorometilsulfonila, bromodifluorometilsulfonila, 2 fluoretilsulfonila, 2-cloroetilsulfonila, 2-bromoetilsulfonila, 2-iodoetilsulfonila, 2,2-difluoretilsulfonila, 2,2,2-trifluoretilsulfonila, 2-cloro-2-fluoretilsulfonila, 2-cloro-2,2-difluoretilsulfonila, 2,2-dicloro-2-fluoretil-sulfonila, 2,2,2-tricloroetilsulfonila, pentafluoretilsulfonila, 2-fluorpropilsulfonila, 3-fluorpropilsulfonila, 2-cloropropilsulfonila, 3-cloropropilsulfonila, 2-bromopropilsulfonila, 3-bromopropilsulfonila, 2,2-difluorpropilsulfonila, 2,3-difluorpropilsulfonila, 2,3-dicloropropilsulfonila, 3,3,3-trifluorpropilsulfonila, 3,3,3-tricloro-propilsulfonila, 2,2,3,3,3-entafluorpropilsulfonila, heptafluorpropilsulfonila, 1 -(fluorometil)-2fluoretilsulfonila, 1 -(clorometil)-2-cloroetilsulfonila, 1-(bromometil)-2-bromoetilsulfonila, 4-

fluorobutilsulfonila, 4-clorobutilsulfonila, 4-bromobutilsulfonila, nonafluorobutilsulfonila, 5-fluoropentilsulfonila, 5-cloropentilsulfonila, 5-bromopentilsulfonila, 5-iodopentilsulfonila, 6-fluorexilsulfonila, 6-bromoexilsulfonila, 6-iodoexilsulfonila e tridecafluorexilsulfonila;

5 - alcóxi C_1-C_4 e também todas as frações alcóxi de hidroxicarbonil-alcóxi C_1-C_4 , alcoxicarbonil C_1-C_4 -alcóxi C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 -alcóxi C_1-C_4 -alquila C_1-C_4 e alquil C_1-C_4 -alcoxicarbonilamino C_1-C_4 : por exemplo, metóxi, etóxi, propóxi, 1-metiletóxi, butóxi, 1-metilpropóxi, 2-metilpropóxi e 1,1-dimetiletóxi;

10 - alcóxi C_1-C_6 e as frações alcóxi de hidrocarboneto-alcóxi C_1-C_6 , alcoxicarbonil C_1-C_6 -alcóxi C_1-C_6 , N-(alcóxi C_1-C_6)-N-(alquil C_1-C_6)aminocarbonila, N-(alquenil C_3-C_6)-N-(alcóxi C_1-C_6)aminocarbonila, N-alquinil C_3-C_6 -N-(alcóxi C_1-C_6)aminocarbonila e alcoxiiimino C_1-C_6 -alquila C_1-C_6 : alcóxi C_1-C_4 da forma mencionada anteriormente, e também, por
15 exemplo, pentóxi, 1-metilbutóxi, 2-metilbutóxi, 3-metoxilbutóxi, 1,1-dimetilpropóxi, 1,2-dimetilpropóxi, 2,2-dimetilpropóxi, 1-etilpropóxi, hexóxi, 1-metilpentóxi, 2-metilpentóxi, 3-metilpentóxi, 4-metilpentóxi, 1,1-dimetilbutóxi, 1,2-dimetilbutóxi, 1,3-dimetilbutóxi, 2,2-dimetilbutóxi, 2,3-dimetilbutóxi, 3,3-dimetilbutóxi, 1 -etilbutóxi, 2-etilbutóxi, 1,1,2-
20 trimetilpropóxi, 1,2,2-trimetilpropóxi, 1-etil-1 -metilpropóxi e 1-etil-2-metilpropóxi;

- haloalcóxi C_1-C_4 : um radical alcóxi C_1-C_4 da forma mencionada anteriormente que é parcial ou completamente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, isto é, por exemplo, fluorometóxi,
25 difluorometóxi, trifluorometóxi, clorodifluorometóxi, bromodifluorometóxi, 2-fluoretóxi, 2-cloroetóxi, 2-bromometóxi, 2-iodoetóxi, 2,2-difluoretóxi, 2,2,2-trifluoretóxi, 2-cloro-2-fluoretóxi, 2-cloro-2,2-difluoretóxi, 2,2-dicloro-2-fluoretóxi, 2,2,2-tricloroetóxi, pentafluoretóxi, 2-fluorpropóxi, 3-fluorpropóxi, 2-cloropropóxi, 3-cloropropóxi, 2-bromopropóxi, 3-

bromopropóxi, 2,2-difluorpropóxi, 2,3-difluorpropóxi, 2,3-dicloropropóxi, 3,3,3-trifluorpropóxi, 3,3,3-tricloropropóxi, 2,2,3,3,3-penta-fluorpropóxi, heptafluorpropóxi, 1-(fluorometil)-2-fluoretóxi, 1-(clorometil)-2-cloroetóxi, 1-(bromometil)-2-bromoetóxi, 4-fluorobutóxi, 4-clorobutóxi, 4-bromobutóxi e nonafluorobutóxi;

5 - haloalcóxi C_1-C_6 e as frações haloalcóxi C_1-C_6 de haloalcóxi C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , haloalcoxicarbonil C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 : haloalcóxi C_1-C_4 da forma mencionada anteriormente, e também, por exemplo, 5-fluorpentóxi, 5-cloropentóxi, 5-bromopentóxi, 5-iodopentóxi, undecafluorpentóxi, 6-
10 fluorexóxi, 6-cloroexóxi, 6-bromoexóxi, 6-iodoexóxi e dodecafluorexóxi;

- alcóxi C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 e as frações alcóxi C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 de alcóxi C_1-C_6 -alcóxi C_1-C_4 -alquila C_1-C_4 : alquila C_1-C_4 que é substituído por alcóxi C_1-C_6 da forma mencionada anteriormente, isto é, por exemplo, metoximetila, etoximetila, propoximetila, (1-metiletóxi)metila,
15 butoximetila, (1-metilpropóxi)metila, (2-metil-propóxi)metila, (1,1-dimetiletóxi)metila, 2-(metóxi)etila, 2-(etóxi)etila, 2-(propóxi)etila, 2-(1-metiletóxi)etila, 2-(butóxi)etila, 2-(1-metilpropóxi)-etila, 2-(2-metilpropóxi)etila, 2-(1,1-dimetiletóxi)etila, 2-(metóxi)propila, 2-(etóxi)propila, 2-(propóxi)propila, 2-(1-metiletóxi)propila, 2-(butóxi)propila,
20 2-(1-metilpropóxi)propila, 2-(2-metilpropóxi)propila, 2-(1,1-dimetiletóxi)-propila, 3-(metóxi)propila, 3-(etóxi)propila, 3-(propóxi)propila, 3-(1-metiletóxi)-propila, 3-(butóxi)propila, 3-(1-metilpropóxi)propila, 3-(2-metilpropóxi)propila, 3-(1,1-dimetiletóxi)propila, 2-(metóxi)butila, 2-(etóxi)butila, 2-(propóxi)butila, 2-(1-metiletóxi)butila, 2-(butóxi)butila, 2-(1-metilpropóxi)butila, 2-(2-metilpropóxi)butila, 2-(1,1-dimetiletóxi)butila, 3-(metóxi)butila, 3-(etóxi)butila, 3-(propóxi)butila, 3-(1-metiletóxi)butila, 3-(butóxi)butila, 3-(1-metilpropóxi)-butila, 3-(2-metilpropóxi)butila, 3-(1,1-dimetiletóxi)butila, 4-(metóxi)butila, 4-(etóxi)butila, 4-(propóxi)butila, 4-(1-metiletóxi)butila, 4-(butóxi)butila, 4-(1-metilpropóxi)butila, 4-(2-

metilpropóxi)butila e 4-(1,1-dimetiletóxi)butila;

- alcóxicarbonila C_1-C_4 e as frações alcóxicarbonila de alcóxicarbonil C_1-C_4 -alcóxi C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 -alcóxicarbonila C_1-C_4 e di-(alquil C_1-C_4)amino-alcóxicarbonila C_1-C_4 : por exemplo, metóxicarbonila, etóxicarbonila, propóxicarbonila, 1-metiletóxicarbonila, butóxicarbonila, 1-metilpropóxicarbonila, 2-metilpropóxicarbonila ou 1,1-dimetiletóxicarbonila;

- alcóxicarbonila C_1-C_6 e as frações alcóxicarbonila de alcóxicarbonil C_1-C_6 -alcóxi C_1-C_6 e alcóxicarbonilamino C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 : alcóxicarbonila C_1-C_4 da forma mencionada anteriormente, e também, por exemplo, pentóxicarbonila, 1-metilbutóxicarbonila, 2-metilbutóxicarbonila, 3-metilbutóxicarbonila, 2,2-dimetilpropóxicarbonila, 1-etilpropóxicarbonila, hexóxicarbonila, 1,1-dimetilpropóxicarbonila, 1,2-dimetilpropóxicarbonila, 1-metilpentóxicarbonila, 2-metilpentóxicarbonila, 3-metilpentóxicarbonila, 4-metilpentóxicarbonila, 1,1-dimetilbutóxicarbonila, 1,2-dimetilbutóxicarbonila, 1,3-dimetilbutóxicarbonila, 2,2-dimetil-butóxicarbonila, 2,3-dimetilbutóxicarbonila, 3,3-dimetilbutóxicarbonila, 1-etilbutóxicarbonila, 2-etilbutóxicarbonila, 1,1,2-trimetil propóxicarbonila, 1,2,2-trimetilpropóxicarbonila, 1-etil-1-metilpropóxicarbonila ou 1-etil-2-metilpropóxicarbonila;

- alquiltio C_1-C_4 e as frações alquiltio C_1-C_4 de haloalquil C_1-C_6 - tioalquila C_1-C_4 , haloalquenil C_2-C_6 - tioalquila C_1-C_4 ;

- haloalquínil C_2-C_6 - tioalquila C_1-C_4 : por exemplo, metiltio, etiltio, propiltio, 1-metiletiltio, butiltio, 1-metilpropiltio, 2-metilpropiltio e 1,1-dimetilpropiltio;

- alquiltio C_1-C_6 e as frações alquiltio C_1-C_6 de alquiltio C_1-C_4 alquila C_1-C_6 : alquiltio C_1-C_4 da forma mencionada anteriormente, e também, por exemplo, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 1-metil-pentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-

metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2--dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-timetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio e 1-etil-2-metilpropiltio;

5 - alquilamino C_1-C_6 e os radicais alquilamino C_1-C_6 de N-(alquilamino C_1-C_6)imino-alquila C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 , alquilsulfonil C_1-C_6 --(alquilamino C_1-C_6)-alquila C_1-C_4 , alquilcarbonil C_1-C_6 -(alquilamino C_1-C_6)-alquila C_1-C_4 e [(alquil C_1-C_6)aminolcianoimino: por exemplo, metilamino, etilamino, propilamino, 1-metiletilamino, butilamino, 10 1-metilpropilamino, 2-metilpropilamino, 1,1-dimetiletilamino, pentilamino, 1-metilbutilamino, 2-metilbutilamino, 3-metilbutilamino, 2,2-dimetilpropilamino, 1-etilpropilamino, hexilamino, 1,1-dimetilpropilamino, 1,2-dimetilpropilamino, 1-metilpentilamino, 2-metilpentilamino, 3-metilpentilamino, 4-metilpen^Pilamino, 1,1-dimetilbutilamino, 1,2-dimetilbutilamino, 1,3-dimetilbutilamino, 2,2-dimetilbutilamino, 2,3-dimetilbutilamino, 3,3-dimetilbutilamino, 1-etilbutilamino, 2-etilbutilamino, 1,1,2-timetilpropilamino, 1,2,2-trimetilpropilamino, 1-etil-1-metilpropilamino ou 1-etil-2-metilpropilamino;

- di-(alquil C_1-C_4)amino: por exemplo, N,N-dimetilamino, 20 N,N-dietilamino, N,N-dipropilamino, N, N-di-(1 -metiletil)amino, N,N-dibutilamino, N,N-di-(1-metilpropil)amino, N,N-di-(2-metilpropil)amino, N,N-di-(1,1-dimetil-etil)amino, N-etil-N-metilamino, N-metil-N-propilamino, N-metil-N-(1-metiletil)amino, N-butil-N-metilamino, N-metil-N-(1-metilpropil)-amino, N-metil-N-(2-metilpropil)amino, N-(1,1-dimetiletil)-N-metilamino, N-etil-N-propilamino, N-etil-N-(1-metiletil)amino, N-butil-N-etilamino, N-etil-N-(1-metilpropil)amino, N-etil-N-(2-metilpropil)amino, N-etil-N-(1, 1-dimetiletil)amino, N-(1 -metiletil)-N-propilamino, N-butil-N-propilamino, N-(1-metilpropil)-N-propilamino, N-(2-metilpropil)-N-propilamino, N-(1,1-dimetiletil)-N-propilamino, N-butil-N-(1-

metiletil)amino, N-(1-metil-etil)-N-(1-metilpropil)amino, N-(1-metiletil)-N-(2-metilpropil)amino, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-metiletil)amino, N-butil-N-(1-metilpropil)amino, N-butil-N-(2-metilpropil)amino, N-butil-N-(1,1-dimetiletil)amino, N-(1-metil-propil)-N-(2-metilpropil)amino, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-metilpropil)amino e N-(1,1-dimetiletil)-N-(2-metilpropil)amino;

- di-(alquil C₁-C₆)amino e os radicais dialquilamino de N-(dialquilamino C₁-C₆)imino-alquila C₁-C₆, di(alquil C₁-C₆)amino-alquila C₁-C₄, [di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilóxi]-alquila C₁-C₄, {di[di(alquil C₁-C₆)amino]carbonilóxi}-alquila C₁-C₄ e [di(alquil C₁-C₆)amino]cianoimino: di-(C₁-C₄-alquil)amino da forma mencionada anteriormente, e também, por exemplo, N,N-dipentilamino, N,N-dihexilamino, N-metil-N-pentilamino, N-etil-N-pentilamino, N-metil-N-hexilamino e N-etil-N-hexilamino;

- (alquilamino C₁-C₄)carbonila e as frações (alquilamino C₁-C₄)carbonila de (alquilamino C₁-C₄)carbonilamino: por exemplo, metilaminocarbonila, etilaminocarbonila, propilaminocarbonila, 1-metiletilaminocarbonila, butilaminocarbonila, 1-metil-propilaminocarbonila, 2-metilproilaminocarbonila ou 1,1 -dimetiletilaminocarbonila;

- (alquilamino C₁-C₄)tiocarbonila e também as frações (C₁-C₄-alquilamino)tiocarbonila de (alquilamino C₁-C₄)tiocarbonilamino: por exemplo, metilaminotio-carbonila, etilaminotiocarbonila, propilaminotiocarbonila, 1-metiletilaminotiocarbonila, butilaminotiocarbonila, 1-metilpropilaminotiocarbonila, 2-metilpropilaminotiocarbonila ou 1,1 -dimetiletilaminotiocarbonila;

- di-(alquil C₁-C₄)aminocarbonila e também frações di-(alquil C₁-C₄)aminocarbonila de di-(alquil C₁-C₄)aminocarbonilamino: por exemplo N,N-dimetilaminocarbonila, N,N-dietilaminocarbonila, N,N-di-(1-metiletil)aminocarbonila, N,N-dipropil-aminocarbonila, N,N-dibutilaminocarbonila, N,N-di-(1-metilpropil)aminocarbonila, N,N-di-(2-

metilpropil)aminocarbonila, N,N-di-(1,1-dimetiletil)aminocarbonila, N-etil-N-metilaminocarbonila, N-metil-N-propilaminocarbonila, N-metil-N-(1-metiletil)aminocarbonila, N-butil-N-metilaminocarbonila, N-metil-N-(1-metilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-(2-metilpropil)aminocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-metilaminocarbonila, N-etil-N-propilaminocarbonila, N-etil-N-(1-metiletil)aminocarbonila, N-butil-N-etilaminocarbonila, N-etil-N-(1-metilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(2-metilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(1,1-dimetiletil)aminocarbonila, N-(1-metiletil)-N-propilaminocarbonila, N-butil-N-propilaminocarbonila, N-(1-metilpropil)-N-propilaminocarbonila, N-(2-metilpropil)-N-propilaminocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-propilaminocarbonila, N-butil-N-(1-metiletil)aminocarbonila, N-(1-metiletil)-N-(1-metilpropil)aminocarbonila, N-(1-metiletil)-N-(2-metilpropil)aminocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-metiletil)aminocarbonila, N-butil-N-(1-metilpropil)aminocarbonila, N-butil-N-(2-metilpropil)aminocarbonila, N-butil-N-(1,1-dimetiletil)aminocarbonila, N-(1-metilpropil)-N-(2-metilpropil)aminocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-metilpropil)aminocarbonila ou N-(1,1-di-metiletil)N-(2-etilpropil)aminocarbonila;

- (alquilamino C₁-C₆)carbonila e também as frações
 20 (alquilamino C₁-C₆)carbonila de (alquilamino C₁-C₆)carbonilamino, (alquilamino C₁-C₆)carbonilóxi-alquila C₁-C₄, alquilaminocarbonil C₁-C₆-alquila C₁-C₄ e [(alquil C₁-C₆)aminocarbonilamino]-alquila C₁-C₄: (alquilamino C₁-C₄)carbonila da forma mencionada anteriormente, e também, por exemplo, pentilaminocarbonila, 1-metilbutilaminocarbonila, 2-metilbutilaminocarbonila, 3-metilbutilaminocarbonila, 2,2-dimetilpropilaminocarbonila, 1-etilpropilamino-carbonila, hexilaminocarbonila, 1,1-dimetilpropilaminocarbonila, 1,2-dimetilpropilaminocarbonila, 1-metilpentilaminocarbonila, 2-metilpentilaminocarbonila, 3-metilpentilaminocarbonila, 4-metilpentilaminocarbonila,

- 1,1-dimetilbutilaminocarbonila, 1,2-dimetilbutilaminocarbonila, 1,3-dimetilbutilaminocarbonila, 2,2-dimetilbutilaminocarbonila, 2,3-dimetilbutilaminocarbonila, 3,3-dimetilbutilaminocarbonila, 1-etilbutilaminocarbonila, 2-etilbutilaminocarbonila, 1,1,2-trimetilpropilaminocarbonila, 1,2,2-trimetilpropilaminocarbonila, 1-etil-1-metilpropilaminocarbonila ou 1-etil-2-metilpropilaminocarbonila;
- di-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila e também as frações di-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila de di-(alquil C₁-C₆)aminocarbonilamino, di(alquil C₁-C₆)aminocarbonil-alquila C₁-C₄ e [di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilamino]-alquila C₁-C₄: di-(alquil C₁-C₄)aminocarbonila da forma mencionada anteriormente, e também, por exemplo, N-metil-N-pentilaminocarbonila, N-metil-N-(1-metilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(2-metilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(3-metilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(2,2-dimetilpropil)amino-carbonila, N-metil-N-(1-etilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-hexilamino-carbonila, N-metil-N-(1,1-dimetilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-(1,2-dimetil-propil)aminocarbonila, N-metil-N-(1-metilpentil)aminocarbonila, N-metil-N-(2-metilpentilaminocarbonila, N-metil-N-(3-metilpentilaminocarbonila, N-metil-N-(4-metilpentil)aminocarbonila, N-metil-N-(1,1-dimetilbutil)amino-carbonila, N-metil-N-(1,2-dimetilbutilaminocarbonila, N-metil-N-(1,3-dimetil-butil)aminocarbonila, N-metil-N-(2,2-dimetilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(2,3-dimetilbutilaminocarbonila, N-metil-N-(3,3-dimetilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(1-etilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(2-etilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(1,1,2-trimetilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-(1,2,2-trimetil-propil)aminocarbonila, N-metil-N-(1-etil-1-metilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-(1-etil-2-metilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-pentilaminocarbonila, N-etil-N-(1-metilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-(2-metilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-(3-metilbutil)aminocarbonila, N-

etil-N-(2,2-dimetilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(1-
 etilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-hexilaminocarbonila, N-etil-N-(1,1-
 dimetilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(1,2-dimetilpropil)aminocarbonila, N-
 etil-N-(1-metilpentil)aminocarbonila, N-etil-N-(2-
 5 metilpentil)-aminocarbonila, N-etil-N-(3-metilpentil)aminocarbonila, N-etil-
 N-(4-metil-pentil)aminocarbonila, N-etil-N-(1,1-dimetilbutil)aminocarbonila,
 N-etil-N-(1,2-dimetilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-(1,3-
 dimetilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-(2,2-dimetilbutil)aminocarbonila, N-
 etil-N-(2,3-dimetilbutil)amino-
 10 carbonila, N-etil-N-(3,3-dimetilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-
 (1-etilbutil)-aminocarbonila, N-etil-N-(2-etilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-
 (1,1,2-trimetil-propil)aminocarbonila, N-etil-N-(1,2,2-
 trimetilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(1-
 15 metilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(1-etil-2-metilpropil)aminocarbonila, N-
 propil-N-pentilaminocarbonila, N-butil-N-pentilaminocarbonila, N,N-
 dipentilaminocarbonila, N-propil-N-hexilaminocarbonila, N-butil-N-
 hexilamino-carbonila, N-pentil-N-hexilaminocarbonila ou N,N-
 dihexilaminocarbonila;
 - di-(alquil C₁-C₆)aminotiocarbonila: por exemplo, N,N-
 20 dimetilaminotiocarbonila, N,N-dietilaminotiocarbonila, N,N-di-(1-
 metiletil)aminotiocarbonila, N,N-dipropilaminotiocarbonila, N,N-
 dibutilaminotiocarbonila, N,N-di-(1-metil-propilaminotiocarbonila, N,N-di-
 (2-metilpropil)aminotiocarbonila, N,N-di-(1,1-dimetiletil)aminotiocarbonila,
 N-etil-N-metilaminotiocarbonila, N-metil-N-propilaminotiocarbonila, N-
 25 metil-N-(1-metiletil)aminotiocarbonila, N-butil-N-metilaminotiocarbonila,
 N-metil-N-(1-metilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(2-
 metilpropil)aminotiocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-
 metil-aminotiocarbonila, N-etil-N-propilaminotiocarbonila, N-etil-N-(1-
 metiletil)-aminotiocarbonila, N-butil-N-etilaminotiocarbonila, N-etil-N-(1-

metilpropil)-aminotiocarbonila, N-etil-N-(2-metilpropil)aminotiocarbonila, N-
 etil-N-(1,1-dimetiletil)aminotiocarbonila, N-(1-metiletil)-N-
 propilaminotio-carbonila, N-butil-N-propilaminotiocarbonila, N-(1-
 metilpropil)-N-propilamino-tiocarbonila, N-(2-metilpropil)-N-propilamino-
 5 tiocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-propilaminotiocarbonila, N-butil-N-(1-
 metiletil)aminotiocarbonila, N-(1-metiletil)-N-(1-
 metilpropil)aminotiocarbonila, N-(1-metiletil)-N-(1-
 (2-metilpropil)aminotiocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-
 metiletil)amino-tiocarbonila, N-butil-N-(1-metilpropil)aminotiocarbonila, N-
 10 butil-N-(2-metil-propilaminotiocarbonila, N-butil-N-(1,1-
 dimetiletil)aminotiocarbonila, N-(1-metilpropil)-N-(2-
 metilpropil)aminotiocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-
 metilpropil)aminotiocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-(2-metilpropil)-
 aminotiocarbonila, N-metil-N-pentilaminotiocarbonila, N-metil-N-(1-
 15 metilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(2-metilbutil)aminotiocarbonila, N-
 metil-N-(3-metilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(2,2-
 dimetilpropil)amino-tiocarbonila, N-metil-N-(1-etilpropil)aminotiocarbonila,
 N-metil-N-hexilamino-tiocarbonila, N-metil-N-(1,1-
 dimetilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1,2-
 20 dimetilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1-
 metilpentil)-aminotiocarbonila, N-metil-N-(2-metilpentil)aminotiocarbonila,
 N-metil-N-(3-metilpentil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(4-
 metilpentil)aminotio-carbonila, N-metil-N-(1,1-
 dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1,2-
 25 dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1,3-
 dimetilbutil)amino-tiocarbonila, N-metil-N-(2,2-
 dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(2,3-
 dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(3,3-
 dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1-etilbutil)aminotiocarbonila, N-

- metil-N-(2-etilbutil)-aminotiocarbonila, N-metil-N-etil-N-(1,1,2-trimetilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1,2,2-trimetilpropyl)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1-etil-1-metil-propil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1-etil-2-metilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-pentilaminotiocarbonila, N-etil-N-(1-metilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2-metilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(3-metilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2,2-dimetilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1-etil-propil)aminotiocarbonila, N-etil-N-hexilaminotiocarbonila, N-etil-N-(1,1-dimetilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,2-dimetilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1-metilpentil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2-metilpentil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(3-metilpentil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(4-metilpentil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,1-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,2-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,3-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2,2-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2,3-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(3,3-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1-etilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2-etilbutil)-aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,1,2-trimetilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,2,2-trimetilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1-metilpropil)-aminotiocarbonila, N-etil-N-(1-etil-2-metilpropil)aminotiocarbonila, N-propil-N-pentilaminotiocarbonila, N-butyl-N-pentilaminotiocarbonila; N,N-dipentilaminotiocarbonila, N-propil-N-hexilaminotiocarbonila, N-butyl-N-hexilaminotiocarbonila, N-pentil-N-hexilaminotiocarbonila ou N,N-dihexilaminotiocarbonila;

- heterociclila de três a seis membros e também as frações de

heterociclila de três a seis membros de heterociclil-alquila C₁-C₄ de três a seis membros: hidrocarbonetos monocíclicos saturados ou parcialmente insaturados tendo três a seis membros do anel da forma mencionada

anteriormente que, além dos átomos de carbono, podem conter um a quatro átomos de nitrogênio, ou um a três átomos de nitrogênio e um átomo de oxigênio ou enxofre, ou um a três átomos de oxigênio, ou um a três átomos de enxofre, e que podem ser anexados por meio de um átomo de carbono ou um

5 átomo de nitrogênio.

Por exemplo, 2-oxiranila, 2-oxetanila, 3-oxetanila, 2-aziridinila, 3-tiethanila, 1-azetidínila, 2-azetidínila, por exemplo, 2-tetraidrofuranoila, 3-tetraidrofuranoila, 2-tetraidrotienila, 3-tetra-hidrotienila, 2-pirrolidinila, 3-pirrolidinila, 3-isoxazolidinila, 4-isoxazolidinila, 5-

10 isoxazolidinila, 3-isotiazolidinila, 4-isotiazolidinila, 5-isotiazolidinila, 3-pirazolidinila, 4-pirazolidinila, 5-pirazolidinila, 2-oxazolidinila, 4-oxazolidinila, 5-oxazolidinila, 2-tiazolidinila, 4-tiazolidinila, 5-tiazolidinila, 2-imidazolidinila, 4-imidazolidinila, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ila, 1,2,4-oxadiazolidin -5-ila, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ila, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ila, 1,2,4-

15 triazolidin-3-ila, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ila, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ila, 1,3,4-triazolidin-2-ila, 1,2,3,4-tetrazolidin-5-ila, por exemplo, 1-pirrolidinila, 2-isotiazolidinila, 2-isotiazolidinila, 1-pirazolidinila, 3-oxazolidinila, 3-tiazolidinila, 1 -imidazolidinila, 1,2,4-triazolidin-1 -ila, 1,2,4-oxadiazolidin-2-ila, 1,2,4-oxadiazolidin-4-ila, 1,2,4-tiadiazolidin-2-ila, 1,2,4-tiadiazolidin-4-

20 ila, 1,2,3,4-tetrazolidin- 1 -ila, for exemplo 2,3-diidrofur-2-ila, 2,3-diidrofur-3-ila, 2,4-diidrofur-2-ila 2,4-diidrofur-3-ila, 2,3-diidrotien-2-ila, 2,3-diidrotien-3-ila, 2,4-diidrotien-2-ila, 2,4-diidrotien-3-ila, 4,5-diidropirrol-2-ila, 4,5-diidropirrol-3-ila, 2,5-diidropirrol-2-ila, 2,5-diidropirrol-3-ila, 4,5-di-

25 hidroisoxazol-3-ila, 2,5-diidroisoxazol-3-ila, 2,3-diidroisoxazol-3-ila, 4,5-diidroisoxazol-4-ila, 2,5-diidroisoxazol-4-ila, 2,3-diidroisoxazol-4-ila, 4,5-diidroisoxazol-5-ila, 2,5-diidroisoxazol-5-ila, 2,3-diidro-isoxazol-5-ila, 4,5-diidroisotiazol-3-ila, 2,5-diidroisotiazol-3-ila, 2,3-diidroisotiazol-3-ila, 4,5-diidroisotiazol-4-ila, 2,5-diidroisotiazol-4-ila, 2,3-diidroisotiazol-4-ila, 4,5-diidroisotiazol-5-ila, 2,5-diidroisotiazol-5-ila, 2,3-diidroisotiazol-5-ila, 2,3-

diidropirazol-2-ila, 2,3-diidropirazol-3-ila, 2,3-diidropirazol-4-ila, 2,3-
 diidropirazol-5-ila, 3,4-diidropirazol-3-ila, 3,4-diidropirazol-4-ila, 3,4-
 dihidropirazol-5-ila, 4,5-diidropirazol-3-ila, 4,5-diidropirazol-4-ila, 4,5-
 diidropirazol-5-ila, 2,3-diidroimidazol-2-ila, 2,3-diidroimidazol-3-ila, 2,3-
 5 diidroimidazol-4-ila, 2,3-diidroimidazol-5-ila, 4,5-diidroimidazol-2-ila, 4,5-
 diidroimidazol-4-ila, 4,5-diidroimidazol-5-ila, 2,5-diidroimidazol-2-ila, 2,5-
 diidroimidazol-4-ila, 2,5-diidroimidazol-5-ila, 2,3-diidrooxazol-3-ila, 2,3-
 diidrooxazol-4-ila, 2,3-diidro-oxazol-5-ila, 3,4-diidrooxazol-3-ila, 3,4-
 diidrooxazol-4-ila, 3,4-diidrooxazol-5-ila, 2,3-diidrotiazol-3-ila, 2,3-
 10 diidrotiazol-4-ila, 2,3-diidrotiazol-5-ila, 3,4-diidrotiazol-3-ila, 3,4-
 diidrotiazol-4-ila, 3,4-diidrotiazol-5-ila, 3,4-diidrotiazol-2-ila, 3,4-
 diidrotiazol-3-ila, 3,4-diidrotiazol-4-ila, por exemplo, 4,5-diidropirrol-1-ila,
 2,5-diidropirrol-1-ila, 4,5-diidroisoxazol-2-ila, 2,3-di hyd roisoxazol- 1 -ila,
 4,5-di hyd roi soth iazol -1 -ila, 2,3-diidroisotiazol- 1 -ila, 2,3-diidropirazol-1-
 15 ila, 4,5-diidropirazol-1-ila, 3,4-diidropirazol-1-ila, 2,3-diidroimidazol-1-ila,
 4,5-diidroimidazol-1-ila, 2,5-diidroimidazol-1-ila, 2,3-diidrooxazol-2-ila, 3,4-
 diidrooxazol-2-ila, 2,3-diidrotiazol-2-ila, 3,4-diidrotiazol-2-ila, por exemplo,
 2-piperidinila, 3-piperidinila, 4-piperidinila, 1,3-dioxan-2-ila, 1,3-dioxan-4-
 ila, 1,3dioxan--5 ila, 1,4-dioxan-2-ila, 1,3-ditian-2-ila, 1,3-ditian-3-ila, 1,3-
 20 ditian-4-ila, 1,4-ditian-2-ila, 1,3-ditian-5-ila, 2-tetraidropiranila, 3-
 tetraidropiranila, 4-tetraidropiranila, 2-tetraidrotiopiranila, 3-
 tetraidrotiopiranila, 4-tetraidrotiopiranila, 3-hexaidropiridazinila, 4-
 hexaidropiridazinila, 2-hexaidropirimidinila, 4-hexaidropirimidinila, 5-
 hexaidropirimidinila, 2- 5 piperazinila, 1,3,5-hexaidrotriazin-2-ila, 1,2,4-
 25 hexaidrotriazin-3-ila, tetraidro-1,3-oxazin-2-ila, tetraidro-1,3-oxazin-6-ila, 2-
 morfolinila, 3-morfolinila, 1,3,5-trioxan-2-ila, por exemplo, 1-piperidinila, 1 -
 hexaidropiridazinila, 1 -hexaidropirimidinila, 1 -piperazinila, 1,3,5-
 hexaidrotriazin-1-ila, 1,2,4-hexaidrotriazin-1-ila, tetraidro-1,3-oxazin- 1 -ila,
 1-morfolinila, por exemplo, 2H-piran-2-ila, 2H-piran-3-ila, 2H-piran-4-ila,

2H-piran-5-ila, 2H-piran-6-ila, 3,6-diidro-2H-piran-2-ila, 3,6-diidro-2H-piran-3-ila, 3,6-diidro-2H-piran-4-ila, 3,6-diidro-2H-piran-5-ila, 3,6-diidro-2H-piran-6-ila, 3,4-diidro-2H-piran-3-ila, 3,4-diidro-2H-piran-4-ila, 3,4-diidro-2H-piran-6-ila, 2H-tiopiran-2-yi, 2H-tiopiran-3-ila, 2H-tiopiran-4-ila, 2H-tiopiran-5-ila, 2H-tiopiran-6-ila, 5,6-diidro-4H-1,3-oxazin-2-ila;

- arila e a fração arila de aril-(alquil C_1-C_6): um carbociclo aromático monocíclico a tricíclico tendo 6 a 14 membros do anel, tais como, por exemplo, fenila, naftila e anthracenila;

- heteroarila e os radicais heteroarila em heteroaril- alquila C_1-C_4 , heteroaril-alquila C_1-C_4 , heteroaril- C_2-C_4 -alquenila, heteroaril- C_2-C_4 -alquinila, heteroaril-haloalquila C_1-C_4 , heteroaril- haloalquenila C_2-C_4 , heteroaril- haloalquinila C_2-C_4 , heteroaril- hidroxialquila C_1-C_4 , heteroaril- hidroxialquenila C_2-C_4 , heteroaril- hidroxialquinila C_2-C_4 , heteroarilcarbonil-alquila C_1-C_4 , heteroarilcarbonilóxi-alquila C_1-C_4 , heteroarilóxi-carbonil-alquila C_1-C_4 , heteroarilóxi-alquila C_1-C_4 , heteroariltio-alquila C_1-C_4 , heteroarilsulfinil-alquila C_1-C_4 , heteroarilsulfonyl-alquila C_1-C_4 ;

- heteroarila aromático mono- ou bicíclico tendo 5 a 10 membros do anel que, além dos átomos de carbono, contém 1 a 4 átomos de nitrogênio ou 1 a 3 átomos de nitrogênio e one oxigênio ou one átomo de enxofre ou one oxigênio ou um átomo de enxofre, por exemplo, monociclos, tais como furila (por exemplo, 2-furila, 3-furila), tienila (por exemplo, 2-tienila, 3-tienila), pirrolila (por exemplo, pirrol-2-ila, pirrol-3-ila), pirazolila (por exemplo, pirazol-3-ila, pirazol-4-ila), isoxazolila (por exemplo, isoxazol-3-ila, isoxazol-4-ila, isoxazol-5-ila), isotiazolila (por exemplo, isotiazol-3-ila, isotiazol-4-ila, isotiazol-5-ila), imidazolila (por exemplo, imidazol-2-ila, imidazol-4-ila), oxazolila (por exemplo, oxazol-2-ila, oxazol-4-ila, oxazol-5-ila), tiazolila (por exemplo, tiazol-2-ila, tiazol-4-ila, tiazol-5-ila), oxadiazolila (por exemplo, 1,2,3-oxadiazol-4-ila, 1,2,3-oxa-diazol-5-ila, 1,2,4-oxadiazol-3-ila, 1,2,4,-oxadiazol-5-ila, 1,3,4-oxadiazol-2-ila), tiadiazolila (por exemplo,

1,2,3-tiadiazol-4-ila, 1,2,3-tiadiazol-5-ila, 1,2,4-tiadiazol-3-ila, 1,2,4-tiadiazol-5-ila, 1,3,4-tiadiazolil-2-ila), triazolila (por exemplo, 1,2,3-triazol-4-ila, 1,2,4-triazol-3-ila), tetrazol-5-ila, piridila (por exemplo, piridin-2-ila, piridin-3-ila, piridin-4-ila), pirazinila (por exemplo, piridazin-3-ila, piridazin-4-ila), pirimidinila (por exemplo, pirimidin-2-ila, pirimidin-4-ila, pirimidin-5-ila), pirazin-2-ila, triazinila (por exemplo, 1,3,5-triazin-2-ila, 1,2,4-triazin-3-ila, 1,2,4-triazin-5-ila, 1,2,4-triazin-6-ila), tetrazinila (por exemplo, 1,2,4,5-tetrazin-3-ila); e também

10 - biciclos, tais como os derivados benzo-fundidos dos monociclos mencionados anteriormente, por exemplo, quinolinila, isoquinolinila, indolila, benzotienila, benzofuranila, benzoxazolila, benzotiazolila, benzoisotiazolila, benzimidazolila, benzopirazolila, benzotiadiazolila, benzotriazolila.

15 - heteroarila de 5 ou 6 membros tendo um a quatro átomos de nitrogênio ou um a três átomos de nitrogênio e um átomo de oxigênio ou enxofre ou tendo um átomo de oxigênio ou enxofre:

20 por exemplo, heterociclos de 5 membros aromáticos são anexados por meio de um átomo de carbono e que, além dos átomos de carbono, podem conter um a quatro átomos de nitrogênio ou um a três átomos de nitrogênio e um átomo de enxofre ou oxigênio ou um átomo de enxofre ou oxigênio como membros do anel, por exemplo, 2-furila, 3-furila, 2-tienila, 3-tienila, 2-pirrolila, 3-pirrolila, 3-isoxazolila, 4-isoxazolila, 5-isoxazolila, 3-isotiazolila, 4-isotiazolila, 5-isotiazolila, 3-pirazolila, 4-pirazolila, 5-pirazolila, 2-oxazolila, 4-oxazolila, 5-oxazolila, 2-tiazolila, 4-tiazolila, 5-tiazolila, 2-imidazolila, 4-imidazolila, 1,2,4-oxadiazol-3-ila, 1,2,4-oxadiazol-5-ila, 1,2,4-tiadiazol-3-ila, 1,2,4-tiadiazol-5-ila, 1,2,4-triazol-3-ila, 1,3,4-oxadiazol-2-ila, 1,3,4-tiadiazol-2-ila e 1,3,4-triazol-2-ila;

por exemplo, heterociclos de 6 membros aromáticos que são anexados por meio de um átomo de carbono e que, além dos átomos de

carbono, podem conter um a quatro, preferivelmente um a três, átomos de nitrogênio como membros do anel, por exemplo, 2-piridinila, 3-piridinila, 4-piridinila, 3-piridazinila, 4-piridazinila, 2-pirimidinila, 4-pirimidinila, 5-pirimidinila, 2-pirazinila, 1,3,5-triazin-2-ila e 1,2,4-triazin-3-ila.

5 Todos os anéis fenila e arila ou radicais heterociclila e heteroarila e todos os componentes fenila em fenil-alquila C_1-C_6 , fenilcarbonila, fenilcarbonil-alquila C_1-C_6 , fenilcarbonilamino- alquila C_1-C_4 , fenoxicarbonila, fenilaminocarbonila, fenilsulfonilaminocarbonila, N-(alquil C_1-C_6)-N-fenilaminocarbonila e fenil-alquilcarbonila C_1-C_6 , todos os
10 componentes arila em aril(alquil C_1-C_4), todos os componentes heteroarila em heteroarila mono- ou bicíclico e todos os componentes heterociclila em heterociclil-alquila C_1-C_6 , heterociclilcarbonila, heterocililcarbonil-alquila C_1-C_6 , heterocicliloxicarbonila, heterociclilaminocarbonila, heterociclilsulfonilaminocarbonila, N-(alquil C_1-C_6)-N-
15 heterociclilaminocarbonila e heterociclil- alquilcarbonila C_1-C_6 são, a menos que de outra forma indicado, preferivelmente não substituídos ou carregam um a três átomo de halogênios e/ou um grupo nitro, um radical ciano e/ou um ou dois substituintes metila, trifluorometila, metóxi ou trifluorometóxi.

Em uma modalidade particular, as variáveis das serinamidas
20 substituídas por heteroarila da fórmula (I) são da forma definida a seguir, as definições sendo, tanto em si mesmos quanto em combinação um com o outro, modalidade preferidas dos compostos da fórmula (I):

É dada preferência às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) em que

25 A é heteroarila de 5 membros tendo um a quatro átomos de nitrogênio ou um a três átomos de nitrogênio e um átomo de oxigênio ou enxofre ou tendo um átomo de oxigênio ou enxofre;

particularmente preferivelmente heteroarila de 5 membros selected do grupo que consiste em tienila, furila, pirazolila, imidazolila,

tiazolila e oxazolila;

especialmente preferivelmente heteroarila de 5 membros selected do grupo que consiste em tienila, furila, pirazolila e imidazolila;

onde os radicais heteroarila mencionados são substituídos por um radical haloalquila C_1-C_6 , preferivelmente na posição 2 por um radical haloalquila C_1-C_6 , e podem carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano, alquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 e alcóxi C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 .

Também é dada preferência às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) em que

A é heteroarila de 5 membros tendo um a quatro átomos de nitrogênio ou um a três átomos de nitrogênio e um átomo de oxigênio ou enxofre ou tendo um átomo de oxigênio ou enxofre;

particularmente preferivelmente heteroarila de 5 membros selected do grupo que consiste em tienila, furila, pirazolila, imidazolila, tiazolila e oxazolila;

especialmente preferivelmente heteroarila de 5 membros selected do grupo que consiste em tienila, furila, pirazolila e imidazolila;

onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em ciano, alquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 e alcóxi C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 .

Também é dada preferência às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) em que

A é um heteroarila de 5 membros tendo um a quatro átomos de nitrogênio ou um a três átomos de nitrogênio e um átomo de oxigênio ou enxofre ou tendo one átomo de oxigênio;

particularmente preferivelmente heteroarila de 5 membros selected do grupo que consiste em furila, pirazolila, imidazolila, tiazolila e

oxazolila, especialmente preferivelmente heteroarila de 5 membros selected do grupo que consiste em furila, pirazolila e imidazolila;

onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em ciano, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ e alcóxi C₁-C₆-alquila C₁-C₄.

Também é dada preferência às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) em que

A é heteroarila de 6 membros tendo um a quatro átomos de nitrogênio;

particularmente preferivelmente piridila ou pirimidila, especialmente preferivelmente pirimidila, onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em ciano, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ e alcóxi C₁-C₆-alquila C₁-C₄.

Também é dada preferência às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I), em que

A é heteroarila de 5 ou 6 membros tendo um a quatro átomos de nitrogênio, ou tendo um a três átomos de nitrogênio e um átomo de oxigênio ou enxofre, ou tendo um átomo de oxigênio ou enxofre, que são substituídos por um radical haloalquila C₁-C₆, preferivelmente na posição 2 por um radical haloalquila C₁-C₆, e podem carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em ciano, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ e alcóxi C₁-C₆-alquila C₁-C₄.

Também é dada preferência às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) em que

A é heteroarila de 5 ou 6 membros selecionado do grupo que consiste em pirrolila, tienila, furila, pirazolila, imidazolila, tiazolila, oxazolila,

tetrazolila, piridila e pirimidinila, onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em ciano, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, C₁-C₆-haloalkóxi e alcóxi C₁-C₆-alquila C₁-C₄;

particularmente preferivelmente heteroarila de 5 ou 6 membros selected do grupo que consiste em tienila, furila, pirazolila, imidazolila, tiazolila, oxazolila e piridila;

onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆ e haloalquila C₁-C₆;

especialmente preferivelmente heteroarila de 5 membros selecionado do grupo que consiste em tienila, furila, pirazolila, imidazolila, tiazolila e oxazolila,

onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcialmente halogenados e/ou podem carregar 1 a 2 radicais do grupo que consiste em alquila C₁-C₆ e haloalquila C₁-C₄;

acima de tudo preferivelmente heteroarila de 5 membros selected do grupo que consiste em tienila, furila, pirazolila e imidazolila;

onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcialmente halogenados e/ou podem carregar 1 a 2 radicais do grupo que consiste em alquila C₁-C₆ e haloalquila C₁-C₄.

Também é dada preferência às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) em que

A é heteroarila de 5 ou 6 membros selecionado do grupo que consiste em pirrolila, furila, pirazolila, imidazolila, tiazolila, oxazolila, tetrazolila, piridila e pirimidinila, onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em ciano, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆,

haloalquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ e alcóxi C₁-C₆-alquila C₁-C₄, particularmente preferivelmente heteroarila de 5 ou 6 membros selected do grupo que consiste em furila, pirazolila, imidazolila, tiazolila, oxazolila e piridila, onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcial ou

5 completamente halogenados e/ou podem carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆ e haloalquila C₁-C₆;

especialmente preferivelmente heteroarila de 5 membros selected do grupo que consiste em furila, pirazolila, imidazolila, tiazolila e oxazolila,

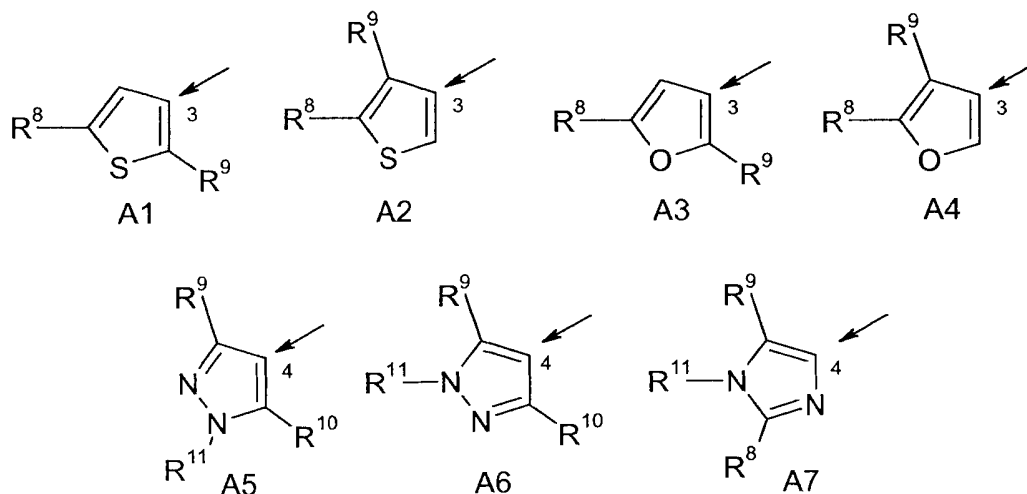
10 onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcialmente halogenados e/ou podem carregar 1 a 2 radicais do grupo que consiste em alquila C₁-C₆ e haloalquila C₁-C₄;

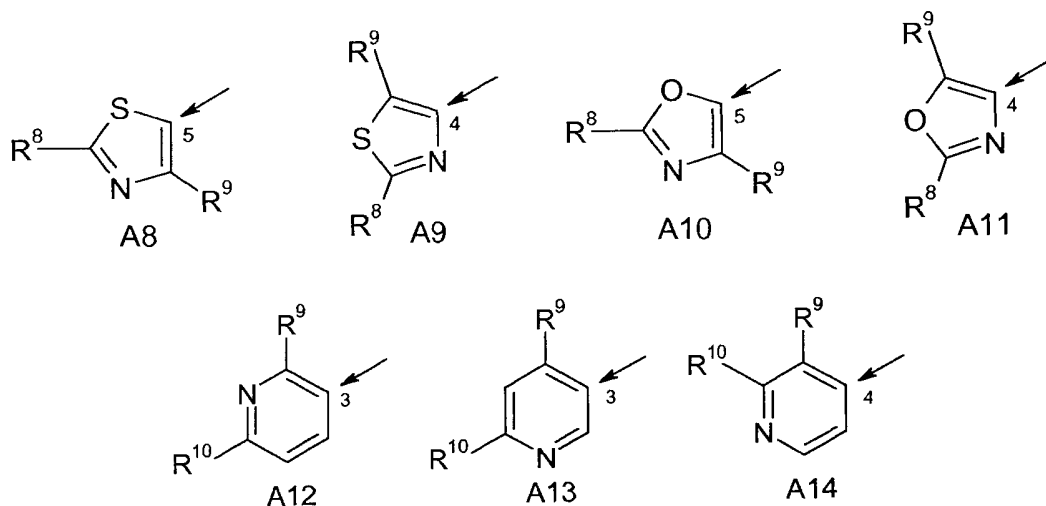
acima de tudo preferivelmente heteroarila de 5 membros selected do grupo que consiste em furila, pirazolila e imidazolila,

15 onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcialmente halogenados e/ou podem carregar 1 a 2 radicais do grupo que consiste em alquila C₁-C₆ e haloalquila C₁-C₄.

Também é dada preferência às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) em que

20 A é heteroarila de 5 ou 6 membros que é anexado por meio de carbono e selected do grupo que consiste em A1 a A14





onde a seta indica o ponto de anexação e

R^8 é hidrogênio, halogênio, alquila C_1-C_6 ou haloalquila C_1-C_6 ; particularmente preferivelmente hidrogênio, alquila C_1-C_4 ou haloalquila C_1-C_4 ; especialmente preferivelmente hidrogênio ou alquila C_1-C_4 ;

5 acima de tudo preferivelmente hidrogênio;

R^9 é halogênio, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 ou haloalcóxi C_1-C_6 ; particularmente preferivelmente halogênio, alquila C_1-C_4 ou haloalquila C_1-C_6 ; especialmente preferivelmente halogênio ou haloalquila C_1-C_6 ;

10 muito preferivelmente haloalquila C_1-C_6 ;

acima de tudo preferivelmente haloalquila C_1-C_4 ;

com extrema preferência CF_3 ;

R^{10} é hidrogênio, halogênio, alquila C_1-C_6 ou haloalquila C_1-C_6 ; particularmente preferivelmente hidrogênio, halogênio ou haloalquila C_1-C_4 ;

15 C_4 ;

especialmente preferivelmente hidrogênio ou halogênio; acima de tudo preferivelmente hidrogênio; e

R^{11} é hidrogênio, alquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 ou alcóxi C_1-C_6 -alquila C_1-C_4 ;

20

particularmente preferivelmente alquila C_1-C_4 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_4 ou alcóxi C_1-C_4 -alquila C_1-C_4 ;

especialmente preferivelmente alquila C₁-C₄ ou haloalquila C₁-C₄;

acima de tudo preferivelmente alquila C₁-C₄;

com extrema preferência CH₃;

5 particularmente preferivelmente A1, A2, A3, A4, A5, A6, A8 ou A9; onde R⁸ a R¹¹ são da forma definida anteriormente;

acima de tudo preferivelmente A1, A2, A5 ou A6;

onde R⁸ a R¹¹ são da forma definida anteriormente.

10 preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroaróila da fórmula (I) em que

R¹ é hidrogênio.

preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroaróila da fórmula (I) em que

R² é hidrogênio ou hidroxila;

15 particularmente preferivelmente hidrogênio.

preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroaróila da fórmula (I) em que

R¹ é hidrogênio; e

R² é hidrogênio ou hidróxi;

20 particularmente preferivelmente hidrogênio.

preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroaróila da fórmula (I) em que

R³ é alquila C₁-C₆ ou haloalquila C₁-C₆;

particularmente preferivelmente alquila C₁-C₆;

25 especialmente preferivelmente alquila C₁-C₄;

acima de tudo preferivelmente CH₃.

preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroaróila da fórmula (I), em que

R⁴ é hidrogênio, alquila C₁-C₆, alquenila C₃-C₆, alquinila C₃-

C₆, formila, alquilcarbonila C₁-C₆, alquenilcarbonila C₂-C₆, cicloalquilcarbonila C₃-C₆, alcoxicarbonila C₁-C₆, alquilaminocarbonila C₁-C₆, C₁-C₆-alquilsulfonilaminocarbonila, alquilaminotiocarbonila (C₁-C₆), di-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, N-(alcóxi C₁-C₆)-N-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, di-(alquil C₁-C₆)-aminotiocarbonila, alcoxiimino C₁-C₆-alquila C₁-C₆, onde os radicais alquila, cicloalquila e alcóxi mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, hidroxila, cicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)amino, alquilcarbonila C₁-C₄, hidroxicarbonila, alcoxicarbonila C₁-C₄, aminocarbonila, alquilamino C₁-C₄carbonila, di-(alquil C₁-C₄)aminocarbonila, ou alquilcarbonilóxi C₁-C₄;

fenila, fenil-alquila C₁-C₆, fenilcarbonila, fenilcarbonil-alquila C₁-C₆, fenilsulfonilaminocarbonila ou fenil-alquilcarbonila C₁-C₆,

onde o anel fenila pode ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: nitro, ciano, alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄ ou haloalcóxi C₁-C₄; ou S₀2R₂;

particularmente preferivelmente hidrogênio, alquila C₁-C₆, alquenila C₃-C₆, alquinila C₃-C₆, formila, alquilcarbonila C₁-C₆, alquenilcarbonila C₂-C₆, alcoxicarbonila C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfonilaminocarbonila, alquilaminocarbonila (C₁-C₆), di-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, N-(alcóxi C₁-C₆)-N-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, alquilaminotiocarbonila (C₁-C₆) ou di-(alquil C₁-C₆)aminotiocarbonila,

onde os radicais alquila ou alcóxi mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, alcóxi C₁-C₄, alcoxicarbonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄carbonila, di-(alquil C₁-C₄)aminocarbonila ou alquilcarbonilóxi C₁-C₄;

fenil-alquila C₁-C₆, fenilcarbonila, fenilcarbonil-alquila C₁-C₆, fenilsulfonilaminocarbonila ou fenil-alquilcarbonila C₁-C₆, onde o anel fenila pode ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três

dos seguintes grupos: nitro, ciano, alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄ ou haloalcóxi C₁-C₄; ou SO₂R⁷;

especialmente preferivelmente hidrogênio, alquila C₁-C₆, alquenila C₃-C₆, alquinila C₃-C₆, formila, alquilcarbonila C₁-C₆, alquenilcarbonila C₂-C₆, alcoxicarbonila C₁-C₆, (alquil C₁-C₆)aminocarbonila, di-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, N-(alcóxi C₁-C₆)-N-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, alquilaminotiocarbonila (C₁-C₆), di-(alquil C₁-C₆)-aminotiocarbonila, fenil-alquila C₁-C₆, fenilcarbonila, fenilcarbonil-alquila C₁-C₆ ou fenil-alquilcarbonila C₁-C₆,

10 onde o anel fenila pode ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: nitro, ciano, alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄ ou haloalcóxi C₁-C₄; ou SO₂R⁷.

Preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) em que

15 é hidrogênio, alquila C₁-C₆, alquenila C₃-C₆, alquinila C₃-C₆, formila, alquilcarbonila C₁-C₆, alquenilcarbonila C₂-C₆, cicloalquilcarbonila C₃-C₆, alcoxicarbonila C₁-C₆, alquilaminocarbonila C₁-C₆, di-(alquilaminocarbonila C₁-C₆, N-(alcóxi C₁-C₆)-N-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, alquilaminotiocarbonila (C₁-C₆), di-(alquil C₁-C₆)aminotiocarbonila, alcoximino C₁-C₆-alquila C₁-C₆,

20 onde os radicais alquila, cicloalquila ou alcóxi mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, hidroxila, cicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)amino, alquilcarbonila C₁-C₄, hidroxicarbonila, alcoxicarbonila C₁-C₄, aminocarbonila, alquilamino C₁-C₄carbonila, di-(alquilamino C₁-C₄carbonila ou alquilcarbonilóxi C₁-C₄; ou SO₂R⁷.

Preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I), em que

R^4 é hidrogênio, alquila C_1-C_6 , alquenila C_3-C_6 , alquinila C_3-C_6 , formila, alquilcarbonila C_1-C_6 , alcoxicarbonila C_1-C_6 , alquilaminocarbonila C_1-C_6 , di-(alquil C_1-C_6)aminocarbonila, N-(alcóxi C_1-C_6)-N-(alquil C_1-C_6)aminocarbonila,

5 onde os radicais alquila e alcóxi mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, alcóxi C_1-C_4 , C_1-C_4 -alquilaminocarbonila ou di-(alquilamino C_1-C_4)carbonila; fenil-alquila C_1-C_6 , fenilcarbonila, fenilcarbonil-alquila C_1-C_6 , fenil-aminocarbonila ou N-(alquil C_1-C_6)-N-
10 (fenil)aminocarbonila,

onde o fenila pode ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, alquila C_1-C_4 ou haloalquila C_1-C_4 ; ou SO_2R^7 ;

particularmente preferivelmente hidrogênio, formila,
15 alquilcarbonila C_1-C_4 , alquilaminocarbonila C_1-C_4 , di-(alquilamino C_1-C_4)carbonila, fenilaminocarbonila, N-(alquil C_1-C_4)-N-(fenil)aminocarbonila, SO_2CH_3 , SO_2CF_3 ou $SO_2(C_6H_5)$.

preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I), em que

20 R^5 e R^6 junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 7 membros que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre ou 2 átomos de oxigênio ou
25 enxofre,

onde o anel é não substituído ou substituído da forma indicada na fórmula (I), e onde o anel é monocíclico ou fundido a um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 6 membros adicional que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 a 1 átomo de nitrogênio ou 1 átomo de

oxigênio ou átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou átomos de enxofre, 0 a 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre,

onde o anel fundido é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 e alcóxi C_1-C_6 , e onde o anel não é ligado ou ligado por uma cadeia saturada ou insaturada de 1 a 3 membros que não contém nenhum heteroátomo ou contém 1 átomo de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou 1 átomo de enxofre,

10 onde a ponte é não substituída ou substituída por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C_1-C_6 , hidroxila e alcóxi C_1-C_6 ;

particularmente preferivelmente junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado de 15 3 a 7 membros que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 a 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou enxofre,

20 onde o anel é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C_1-C_6 , hidroxila, alcóxi C_1-C_6 , formila, alquil C_1-C_6 -carbonila, alcóxicarbonila C_1-C_6 , alquilaminocarbonila C_1-C_6 , di-(alquil C_1-C_6)-aminocarbonila, alquilsulfonilamino, carbonila, alcoximino,

25 onde os radicais alquila e alcóxi mencionados podem ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos:

ciano, hidroxila e alcóxi C_1-C_4 , fenila, parcial ou completamente halogenado, e onde o anel é monocíclico ou fundido a um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 6 membros adicional que é

carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 a 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou átomos de enxofre, 0 a 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre,

5 onde o anel fundido é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆ e alcóxi C₁-C₆, e onde o anel não é ligado ou ligado por uma cadeia saturada ou insaturada de 1 a 3 membros que não contém nenhum heteroátomo ou contém
10 one átomo de nitrogênio ou 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou 1 átomo de enxofre,

 onde a ponte é não substituída ou substituída por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C₁-C₆, hidroxila e alcóxi C₁-C₆.

15 Preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroaróila da fórmula (I), em que

 R⁵ e R⁶ junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado monocíclico de 3 a
20 12 membros que é carbocíclico ou contém 1 a 3 átomos de nitrogênio, 0 a 3 átomos de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 a 2 átomos de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 3 átomos de oxigênio ou enxofre, 2 átomos de oxigênio e 1 átomo de enxofre, ou 1 oxigênio e 2 átomos de enxofre,

25 onde o anel é não substituído ou substituído da forma indicada na fórmula (I);

 particularmente preferivelmente junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado monocíclico de 3 a 7 membros que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de

nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 a 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 3 átomos de oxigênio ou enxofre,

onde o anel é não substituído ou substituído da forma indicada na fórmula (I);

muito particularmente preferivelmente junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado monocíclico de 3 a 7 membros que é carbocíclico ou contém 1 a 3 átomos de nitrogênio, 0 a 3 átomos de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 a 2 átomos de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 3 átomos de oxigênio ou enxofre, 2 átomos de oxigênio e 1 átomo de enxofre, ou 1 oxigênio e 2 átomos de enxofre,

onde o anel é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C_1-C_6 , hidroxila, alcóxi C_1-C_6 , formila, C_1-C_6 -alquil-carbonila, alcoxicarbonila C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 carbonila, di-(alquil C_1-C_6)aminocarbonila, alquilsulfonil-amino, carbonila, alcoxiiimino,

onde os radicais alquila e alcóxi mencionados podem ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, hidroxila, alcóxi C_1-C_4 , fenila, parcial ou completamente halogenado.

preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I), em que

R^5 e R^6 junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado monocíclico de 3 a 12 membros que é carbocíclico ou contém 1 a 3 átomos de nitrogênio, 0 a 3 átomos de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou enxofre, 0 a 2 átomos de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1

oxigênio e 1 átomo de enxofre, 3 átomos de oxigênio ou enxofre, 2 átomos de oxigênio e 1 átomo de enxofre, ou 1 oxigênio e 2 átomos de enxofre,

onde o anel é não substituído ou substituído da forma indicada na fórmula (I);

5 e onde o anel é fundido a um anel saturado, parcialmente insaturado ou completamente insaturado de 3 a 7 membros adicional que é carbocíclico ou contém 1 a 3 átomos de nitrogênio, 0 a 2 átomos de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou átomos de enxofre, 0 a 1 átomo de nitrogênio e 1
10 átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio e 1 átomo de enxofre ou 1 átomo de oxigênio e 2 átomos de enxofre,

onde o anel fundido é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, ciano, nitro, alquila C₁-C₆, alquenila C₃-C₆,
15 alquinila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₃-C₆, haloalquinila C₃-C₆, hidroxila, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ e alquilsulfonila C₁-C₆;

particularmente preferivelmente junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 7 membros que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0
20 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou enxofre,

onde o anel é não substituído ou substituído da forma indicada na fórmula (I);

25 e onde o anel é fundido a um anel saturado, parcialmente insaturado ou completamente insaturado de 3 a 7 membros adicional que é carbocíclico ou contém 1 a 3 átomos de nitrogênio, 0 a 2 átomos de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou átomos de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1

átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio e 1 átomo de enxofre ou 1 átomo de oxigênio e 2 átomos de enxofre,

onde o anel fundido é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível,

5 substituintes do grupo que consiste em halogênio, ciano, nitro, alquila C_1-C_6 , alquenila C_3-C_6 , alquinila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_3-C_6 , haloalquinila C_3-C_6 , hidroxila, alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 e alquilsulfonila C_1-C_6 ;

10 muito particularmente preferivelmente junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 7 membros que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou enxofre,

15 onde o anel é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C_1-C_6 , hidroxila, alcóxi C_1-C_6 , formila, alquil C_1-C_6 -carbonila, C_1-C_6 -alcoxicarbonila, alquilaminocarbonila C_1-C_6 , di-(alquil C_1-C_6)aminocarbonila, alquilsulfonil-amino, carbonila, alcoxiimino,

20 onde os radicais alquila e alcóxi mencionados podem ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, hidroxila, alcóxi C_1-C_4 , fenila, parcial ou completamente halogenado,

25 e onde o anel pode ser fundido a um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 6 membros adicional que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou átomos de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre,

onde o anel fundido é não substituído ou substituído por 1 a 3,

no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆ e alcóxi C₁-C₆.

preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I), em que

R⁶ e R⁶ junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado monocíclico de 3 a 12 membros que é carbocíclico ou contém 1 a 3 átomos de nitrogênio, 0 a 3 átomos de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou enxofre, 0 a 2 átomos de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 3 átomos de oxigênio ou enxofre, 2 átomos de oxigênio e 1 átomo de enxofre, ou 1 oxigênio e 2 átomos de enxofre,

onde o anel é não substituído ou substituído da forma indicada na fórmula (I),

e onde o anel é ligado por uma cadeia saturada ou insaturada de 1 a 4 membros que não contém nenhum heteroátomo ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou 1 átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou 2 átomos de enxofre, ou 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre,

onde as pontes são não substituídas ou substituídas por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, ciano, nitro, alquila C₁-C₆, alquenila C₃-C₆, alquinila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₃-C₆, haloalquinila C₃-C₆, hidroxila, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ e alquilsulfonila C₁-C₆;

particularmente preferivelmente junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 7 membros que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 ou 1

átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou enxofre,

onde o anel é não substituído ou substituído da forma indicada na fórmula (I),

5 e onde o anel é ligado por uma cadeia saturada ou insaturada de 1 a 4 membros que não contém nenhum heteroátomo ou contém 1 a 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou 1 átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou 2 átomos de enxofre ou 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio e 1
10 átomo de enxofre,

onde a ponte é não substituída ou substituída por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, ciano, nitro, alquila C_1-C_6 , alquenila C_3-C_6 , alquinila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_3-C_6 , haloalquinila C_3-C_6 ,
15 hidroxila, alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 e alquilsulfonila C_1-C_6 ;

muito particularmente preferivelmente junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 7 membros que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de
20 enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou enxofre,

onde o anel é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C_1-C_6 , hidroxila, alcóxi C_1-C_6 , formila,
25 alquil C_1-C_6 -carbonila, alcoxicarbonila C_1-C_6 , alquilaminocarbonila C_1-C_6 , di-(alquil C_1-C_6)aminocarbonila, alquilsulfonil-amino, carbonila, alcoxiimino,

onde os radicais alquila e alcóxi mencionados podem ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, hidroxila, alcóxi C_1-C_4 , fenila, parcial ou

completamente halogenado, e onde o anel é ligado por uma cadeia saturada ou insaturada de 1 a 4 membros que não contém nenhum heteroátomo ou contém 1 a 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio ou 1 átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou 2 átomos de enxofre ou 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre,

onde a ponte é não substituída ou substituída por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, ciano, nitro, alquila C_1-C_6 , alquenila C_3-C_6 , alquinila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_3-C_6 , haloalquinila C_3-C_6 , hidroxila, alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 e alquilsulfonila C_1-C_6 .

Preferência é igualmente dada às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I), em que

R^7 é alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 ou fenila,

onde o radical fenila pode ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode ser substituído por alquila C_1-C_4 ;

particularmente preferivelmente alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 ou fenila;

especialmente preferivelmente metila, trifluorometila ou fenila.

É dada preferência particular às serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) em que

A é heteroarila de 5 ou 6 membros selecionado do grupo que consiste em tienila, furila, pirazolila, imidazolila, tiazolila, oxazolila e piridila;

onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em alquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 e haloalquila C_1-C_6 ;

R^1 e R^2 são hidrogênio;

R^3 é alquila C_1-C_4 ,

particularmente preferivelmente CH_3 ;

R^4 é hidrogênio, formila, alquilcarbonila $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquilamino $\text{C}_1\text{-C}_4$ carbonila, di-(alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$)aminocarbonila, fenilaminocarbonila, N-(alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$)-N-(fenil)aminocarbonila, SO_2CH_3 , SO_2CF_3 ou $\text{SO}_2(\text{C}_6\text{H}_5)$;

5 R^5 e R^6 junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 7 membros que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou
10 enxofre,

onde o anel é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila $\text{C}_1\text{-C}_6$, hidroxila, alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, formila, alquil carbonila $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxicarbonila $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquilaminocarbonila $\text{C}_1\text{-C}_6$, di-
15 (alquil $\text{C}_3\text{-C}_6$)aminocarbonila, alquilsulfonilamino, carbonila, alcoxiiimino,

onde os radicais alquila e alcóxi mencionados podem ser parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos:

20 ciano, hidroxila, alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, fenila, parcial ou completamente halogenado,

e o anel é monocíclico ou fundido a um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 6 membros adicional que é carbocíclico ou contém 1 a 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou átomos de enxofre, 0
25 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre,

onde o anel fundido é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquila $\text{C}_1\text{-C}_6$ e alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, ou o anel é ligado em ponte por uma cadeia saturada ou insaturada de 1

a 3 membros que não contém nenhum heteroátomo ou contém 1 átomo de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou 1 átomo de enxofre,

5 onde a ponte é não substituída ou substituída por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C₁-C₆, hidroxila e alcóxi C₁-C₆.

10 Acima de tudo é dada preferência aos compostos da fórmula (I.a) (corresponde à fórmula (I) onde A = A-1 onde R⁸ = H; R⁶ = CF₃, R¹, R² e R⁵ = H; R³ = CH₃), em particular aos compostos da fórmula I.a.1 a I.a.138 da tabela 1, onde as definições das variáveis A e R¹ a R⁶ são de particular importância para os compostos de acordo com a invenção não somente em combinação um com o outro, mas em cada caso também em si mesmos.

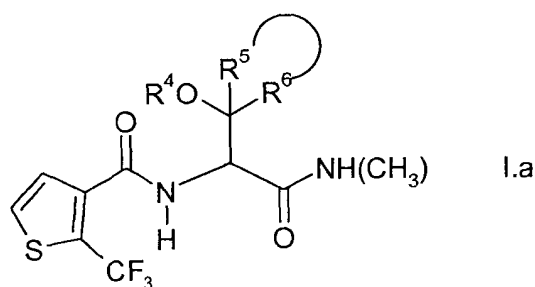


Tabela I

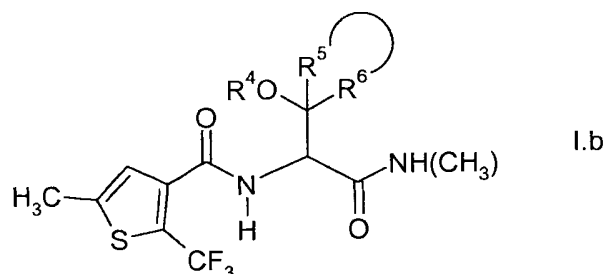
No.	R ⁴	R ⁵ a R ⁶
I.a.1	H	-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.2	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.3	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.4	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.5	H	-CHCH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.6	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.7	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.8	H	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.9	H	-CH ₂ -CH ₂ -O-CHCH ₃ -
I.a.10	H	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCH ₃)-
I.a.11	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.12	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.13	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -
I.a.14	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -
I.a.15	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -
I.a.16	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(CONHCH ₃)-CH ₂ -
I.a.17	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -
I.a.18	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -

I.a.19	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.20	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.21	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.22	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CHCH ₃ -
I.a.23	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCH ₃)-
I.a.24	H	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.25	H	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.26	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCH ₃)-
I.a.27	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.28	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.29	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.30	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.31	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -
I.a.32	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -
I.a.33	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -
I.a.34	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(CONHCH ₃)-CH ₂ -
I.a.35	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -
I.a.36	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.37	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.38	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.39	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(CONHCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.40	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.41	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.42	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.43	C(O)CHa	-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.44	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.45	C(O)CH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.46	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.47	C(O)CH ₃	-CHCH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.48	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.49	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.50	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.51	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CHCH ₃ -
I.a.52	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCH ₃)-
I.a.53	C(O)CH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.54	C(O)CH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH(OCHa)-
I.a.55	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -
I.a.56	C(O)CHa	-CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -
I.a.57	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -
I.a.58	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(CONHCH ₃)-CH ₂ -
I.a.59	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -
I.a.60	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.61	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.62	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.63	C(O)CHa	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.64	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CHCH ₃ -
I.a.65	C(O)CHa	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCH ₃)-
I.a.66	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.67	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.68	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCH ₃)-

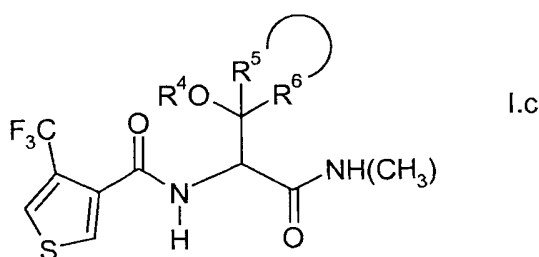
I.a.69	C(O)CH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.70	C(O)CH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.71	C(O)CH ₃	-CH ₂ "O-CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.72	C(O)CH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.73	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -
I.a.74	C(O)CH ₃	"CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -
I.a.75	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -
I.a.76	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(CONHCH ₃)-CH ₂ -
I.a.77	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -
I.a.78	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.79	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.80	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.81	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(CONHCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.82	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.83	C(O)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.84	C(O)CH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.85	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.86	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.87	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.88	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.89	C(O)NHCH ₃	-CHCH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.90	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.91	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.92	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.93	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CHCH ₃ -
I.a.94	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCH ₃)-
I.a.95	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.96	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.97	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -
I.a.98	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -
I.a.99	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -
I.a.100	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(CONHCH ₃)-CH ₂ -
I.a.101	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -
I.a.102	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.103	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.104	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.105	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.106	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CHCH ₃ -
I.a.107	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCH ₃)-
I.a.108	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.109	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.110	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCH ₃)-
I.a.111	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.112	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.113	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.114	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.115	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -
I.a.116	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -
I.a.117	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -
I.a.118	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(CONHCH ₃)-CH ₂ -

I.a.119	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -
I.a.120	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.121	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.122	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.123	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(CONHCHa)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.124	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -GH ₂ -
I.a.125	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.126	C(O)NHCH ₃	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.127	GON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.128	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.129	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.130	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.131	CON(CH ₃) ₂	-CHCH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.132	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.133	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.134	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.135	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CHCH ₃ -
I.a.136	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCH ₃)-
I.a.137	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -O-CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.138	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH(OCHa)-
I.a.139	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -
I.a.140	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -
I.a.141	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -
I.a.142	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(CONHCH ₃)-CH ₂ -
I.a.143	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -
I.a.144	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.145	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.146	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.147	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.148	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CHCH ₃ -
I.a.149	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCH ₃)-
I.a.150	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.151	CON(CHa) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.152	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH(OCHa)-
I.a.153	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -C H ₂ -
I.a.154	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CHCH ₃ -
I.a.155	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH(OCH ₃)-
I.a.156	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -O-CH ₂ -O-CH ₂ -
I.a.157	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -
I.a.158	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -
I.a.159	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -
I.a.160	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(CONHCH ₃)-CH ₂ -
I.a.161	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -
I.a.162	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COH)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.163	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.164	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.165	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N (CON H C H ₃)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.166	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N (CON (CH ₃) ₂)-CH ₂ -CH ₂ -
I.a.167	CON(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
I.a.168	CON(CH ₃) ₂	-C H ₂ -O-CH ₂ -C H ₂ -O-CH ₂ -

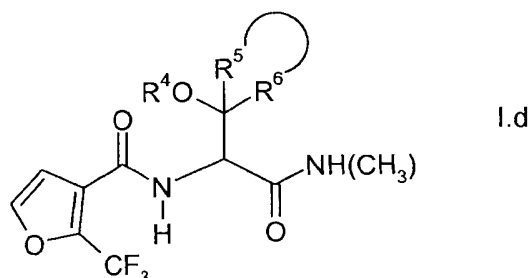
Acima de tudo preferência é igualmente dada aos compostos da fórmula I.b, em particular aos compostos das fórmulas I.b.1 a I.b.168, que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.168 em que A é A1 onde $R^8 = \text{CH}_3$ e $R^9 = \text{CF}_3$:



5 Acima de tudo preferência é igualmente dada aos compostos da fórmula I.c, em particular aos compostos das fórmulas I.c.1 a I.c.168, que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.168 em que A é A2 onde $R^8 = \text{H}$ e $R^9 = \text{CF}_3$:

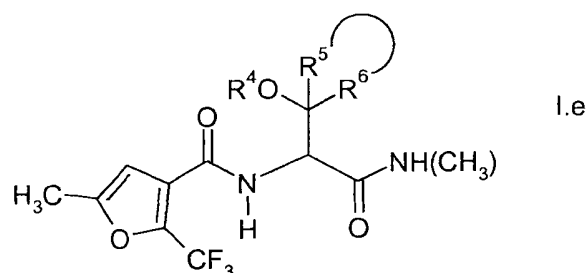


10 Acima de tudo preferência é igualmente dada aos compostos da fórmula I.d, em particular aos compostos das fórmulas I.d.1 a I.d.168, que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.168 em que A é A3 onde $R^8 = \text{H}$ e $R^9 = \text{CF}_3$:



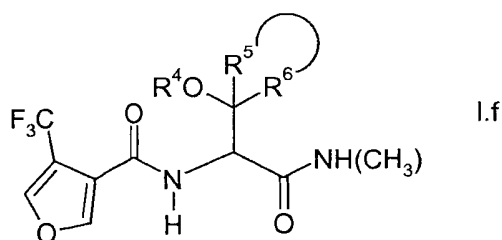
15 Acima de tudo preferência é igualmente dada aos compostos da fórmula I.e, em particular aos compostos das fórmulas I.e.1 a I.e.168, que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.168 em que A

é A3 onde $R^8 = \text{CH}_3$ e $R^9 = \text{CF}_3$:



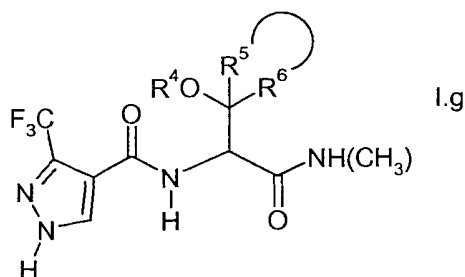
Acima de tudo preferência é igualmente dada aos compostos da fórmula I.f, em particular aos compostos das fórmulas I.f.1 a I.f.68, que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.168 em que A

5 é A4 onde $R^8 = \text{H}$ e $R^9 = \text{CF}_3$:



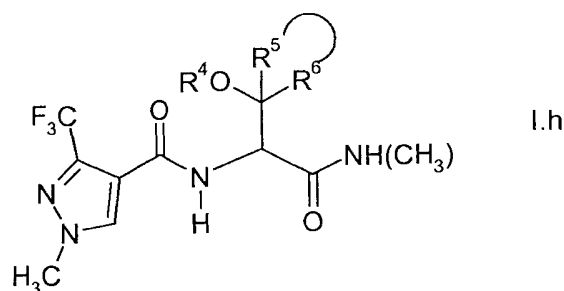
Acima de tudo preferência é igualmente dada aos compostos da fórmula I.g, em particular aos compostos das fórmulas I.g.1 a I.g.168, que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.168 em que A

10 é AS onde $R^{11} = \text{H}$, $R^9 = \text{CF}_3$ e $R^{10} = \text{H}$:

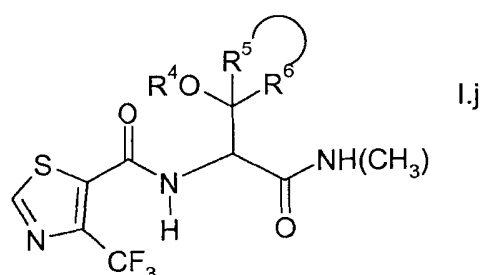


Acima de tudo preferência é igualmente dada aos compostos da fórmula I.h, em particular aos compostos das fórmulas I.h.1 a I.h.168, que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.168 em que A

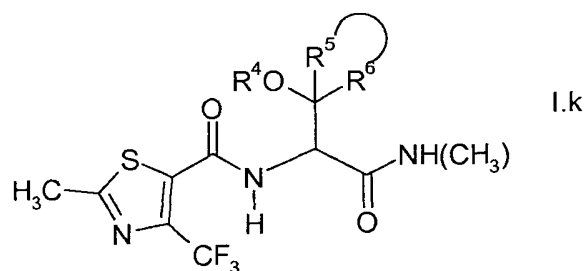
é A5 onde $R^{11} = \text{CH}_3$, $R^9 = \text{CF}_3$ e $R^{10} = \text{H}$:



Acima de tudo preferência é igualmente dada aos compostos da fórmula I.j, em particular aos compostos das fórmulas I.j.1 a 14.168, que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.168 em que A é A8 onde $R^8 = H$ e $R^9 = CF_3$:



5 Acima de tudo preferência é igualmente dada aos compostos da fórmula I.k, em particular aos compostos das fórmulas I.k.1 a I.k.168, que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.168 em que A é A8 onde $R^8 = CH_3$ e $R^9 = CF_3$:

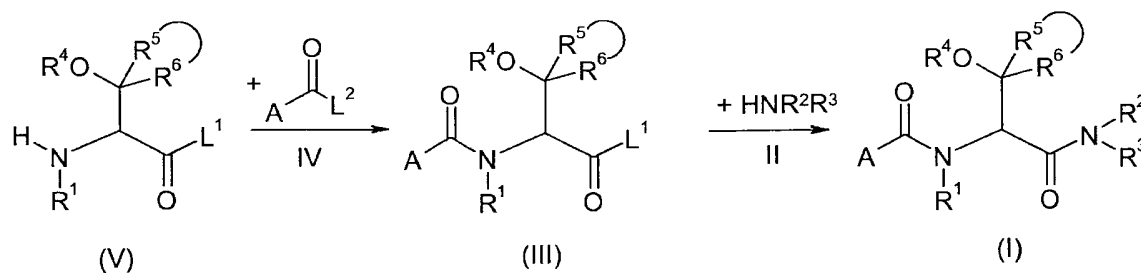


10 As serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) podem ser obtidas por diferentes vias, por exemplo, pelos seguintes processos:

Processo A

15 Derivados de serina da fórmula (V) são inicialmente reagidos com ácidos de heteroarila/derivados de ácido de heteroarila da fórmula (IV) para dar os derivados de heteroarila correspondentes da fórmula (III) que

então reagem com aminas da fórmula (II) para dar as serinamidas substituídas por heteroarila desejadas da fórmula (I):



L^1 é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente, por exemplo, hidroxila ou alcóxi C_1 - C_6 .

5 L^2 é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente, por exemplo, hidroxila, halogênio, alquilcarbonila C_1 - C_6 , alcóxicarbonila C_1 - C_6 , alquilsulfonila C_1 - C_4 , fosforila ou isoureíla.

A reação dos derivados de serina da fórmula (V) com ácidos de heteroarila/derivados de ácido de heteroarila da fórmula (IV) onde L^2 é hidroxila para dar derivados de heteroarila da fórmula (III) é realizada na presença de um reagente de ativação e uma base, normalmente a temperaturas de 0 °C ao ponto de ebulição da mistura de reação, preferivelmente de 0 °C a 110 °C, particularmente preferivelmente a temperatura ambiente, em um solvente orgânico inerte [cf. Bergmann, E. D.; et al., J Chem Soc 1951, 2673; Zhdankin, V. V.; et al., Tetrahedron Lett. 2000, 41 (28), 5299-5302; Martin, S. F. et al., Tetrahedron Lett. 1998, 39 (12), 1517-1520; Jursic, B. S. et al., Synth Commun 2001, 31 (4), 555-564; Albrecht, M. et al., Synthesis 2001, (3), 468-472; Yadav, L. D. S. et al., Indian J. Chem B. 41(3), 593-595(2002); Clark, J. E. et al., Synthesis (10), 891-894 (1991)] Reagentes de ativação são agentes de condensação, tal como, por exemplo, dicicloexilcarbodiimida ligada a poliestireno, diisopropilcarbodiimida, carbonildiimidazol, ésteres clorofórmicos, tais como cloroformiato de metila, cloroformiato de etila, cloroformiato de isopropila, cloroformiato de isobutila, cloroformiato de sec-butila ou cloroformiato de alila, cloreto de pivaloíla, ácido polifosfórico, anidrido propanofosfônico, cloreto de bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosforila

10

15

20

25

(BOPCI) ou cloretos de sulfonila, tais como cloreto de metanossulfonila, cloreto de toluenossulfonila ou cloreto de benzenossulfonila.

Solventes adequados são hidrocarbonetos alifáticos, tais como pentano, hexano, cicloexano e misturas de alcanos C_5-C_8 , hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno, tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, tais como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, tais como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butil metílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano (THF), nitritos, tais como acetonitrila e propionitrila, cetonas, tais como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA) e N-metilpirrolidona (NMP), ou ainda em água; é dada preferência particular a cloreto de metileno, THF e água.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Bases adequadas são, no geral, compostos inorgânicos, tais como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio, óxidos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de potássio e óxido de cálcio, carbonatos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, e também bicarbonatos de metal alcalino, tal como bicarbonato de sódio, além disso bases orgânicas, por exemplo, aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina, N-metil-morfolina e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, such as colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. É dada preferência particular a hidróxido de sódio, trietilamina e piridina.

As bases são geralmetne empregadas em quantidades equimolares. Entretanto, elsa também podem ser usadas em excesso ou, se

apropriado, como solvente.

Os materiais de partida geralmente reagem um com o outro em quantidades equimolares. Pode ser vantajoso usar um excesso de (IV), com base em (V).

5 As misturas de reação são desenvolvidas de uma maneira costumeira por exemplo, misturando com água, separando as fases e, se apropriado, purificação cromatográfica dos produtos brutos. Alguns dos intermediários e produtos finais são obtidos na forma de óleos viscosos que são purificados ou sem componentes voláteis em pressão reduzida e em
10 temperatura moderadamente elevada. Se os intermediários e produtos finais forem obtidos na forma de sólidos, purificação também pode ser realizada por recristalização ou digestão.

A reação dos derivados de serina da fórmula (V) com ácidos de heteroarila/derivados de ácido de heteroarila da fórmula (IV) onde L² é
15 halogênio, alquilcarbonila C₃-C₆, alcoxicarbonila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₄, fosforila ou isoureila para dar derivados de heteroarila da fórmula (III) é realizada na presença de uma base, normalmente a temperaturas de 0 °C ao ponto de ebulição da mistura de reação, preferivelmente de 0 °C a 100 °C, particularmente preferivelmente a temperatura ambiente, em um solvente
20 orgânico inerte [cf. Bergmann, E. D.; et al., J Chem Soc 1951, 2673; Zhdankin, V. V.; et al., Tetrahedron Lett. 2000, 41 (28), 5299-5302; Martin, S. F. et al., Tetrahedron Lett. 1998, 39 (12), 1517-1520; Jursic, B. S. et al., Synth Commun 2001, 31 (4), 555-564; Albrecht, M. et al., Synthesis 2001, (3), 468-472; Yadav, L. D. S. et al., Indian J. Chem B. 41(3), 593-595(2002);
25 Clark, J. E. et al., Synthesis (10), 891-894 (1991)].

Solventes adequados são hidrocarbonetos alifáticos, tais como pentano, hexano, cicloexano e misturas de alcanos C₅-C₈, hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno, tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, tais como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno,

éteres, tais como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butil metílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano (THF), nitrilas, tais como acetonitrila e propionitrila, cetonas, tais como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e tertbutil metil cetona, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA) e N-metilpirrolidona (NMP), ou ainda em 5 água; é dada preferência particular a cloreto de metileno, THF e água.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Bases adequadas são, no geral, compostos inorgânicos, tais como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como 10 hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio, óxidos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de potássio e óxido de cálcio, carbonatos de metal alcalino e metal 15 alcalino terroso, tais como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, e também bicarbonatos de metal alcalino, tais como bicarbonato de sódio, além disso bases orgânicas, por exemplo, aminas terciárias, such as trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina, N-metilmorfolina e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, tais como 20 colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas.

Preferência particular é dada ao hidróxido de sódio, trietilamina e piridina.

As bases são geralmetne empregadas em quantidades equimolares. Entretanto, elas também podem ser usadas em excesso ou, se 25 apropriado, como solvente.

Os materiais de partida geralmente reagem um com o outro em quantidades equimolares. Pode ser vantajoso usar um excesso de (IV), com base em (V).

Desenvolvimento e isolamento dos produtos podem ser

realizados de uma maneira conhecida per se.

Certamente também é possível inicialmente reagir os derivados de serina da fórmula (V) de uma maneira análoga com aminas da fórmula (II) para dar as amidas correspondentes que então reagem com ácidos de heteroarila/derivados de ácido de heteroarila da fórmula (IV) para dar as serinamidas substituídas por heteroarila desejadas da fórmula (1).

Os derivados de serina da fórmula (V) (por exemplo, onde L^1 = hidroxila ou alcóxi C_1-C_6) requeridos para preparar os derivados de heteroarila da fórmula (III) são conhecidos da literatura, mesmo na forma enantiomérica ou diastereomericamente pura, ou eles podem ser preparados de acordo com a literatura citada:

- por condensação de equivalentes de enolato de glicina com cetonas cíclicas [Blaser, D. et al., *Liebigs Ann. Chem.* 10, 1067-1078 (1991); Seethaler, T. et al., *Liebigs Ann. Chem.* 1, 11-17 (1991); Weltenauer, G. et al., *Gazz. Chim. Ital.* 81, 162 (1951); Dalla Croce, P. et al., *Heterociclos* 52(3), 1337-1344 (2000); Van der Wert, A. W. et al., *J. Chem. Soc. Chem. Commun.* 100, 682-683 (1991); Caddick, S. et al., *Tetrahedron* 57 (30), 6615-6626 (2001); Owa, T. et al., *Chem. Lett.* 1, 83-86 (1988); Alker, D. et al., *Tetrahedron* 54 (22), 6089-6098 (1998); Rousseau, J. F. et al., *J. Org. Chem.* 63 (8), 2731-2737 (1998); Saeed, U.M. et al., *Tetrahedron* 48 (12), 2507-2514 (1992); Deng, L. et al., *J. Org. Chem.* 67 (14), 4759-4770 (2002)].

- por aminoidroxilação de derivados de ácido acrílico [Zhang, H. X. et al., *Tetrahedron Asymmetr.* 11(16), 3439-3447 (2000); Fokin, V. V. et al., *Angew. Chem. Int. Edit.* 40(18), 3455 (2001); Sugiyama, H. et al., *Tetrahedron Lett.* 43(19), 3489-3492 (2002); Bushey, M. L. et al., *J. Org. Chem.* 64(9), 2984-2985 (1999); Raatz, D. et al., *Synlett* (12), 1907-1910 (1999)].

- por substituição nucleofílica de grupos abandonadores na posição 2 de derivados de ácido 3-hidroxiopropiônico [Owa, T. et al., *Chem.*

Left. (11), 1873-1874 (1988); Boger, D. L. et al., J. Org. Chem. 57(16), 4331-4333 (1992); Alcaide, B. et al., Tetrahedron Lett. 36(30), 5417-5420 (1995)].

- por condensação de cetonas com nucleófilos com formação de oxazolininas e subsequente hidrólise [Evans, D. A. et al., Angew. Chem. Int.

5 Edit. 40(10), 1884-1888 (2001); Ito, Y. et al., Tetrahedron Lett. 26(47), 5781-5784 (1985); Togni, A. et al., J. Organomet. Chem. 381(1), C21-5 (1990); Longmire, J. M. et al., Organometallics 17(20), 4374-4379 (1998); Suga, H. et al., J. Org. Chem. 58(26), 7397-7405 (1993)].

10 - por ciclização oxidativa de derivados de ácido 2-acilaminopropiônico para dar oxazolininas e subsequente hidrólise (JP10101655).

Os ácidos de heteroarila/derivados de ácido de heteroarila da fórmula (IV) requeridos para preparar os derivados de heteroarila da fórmula (III) são comercialmente disponíveis ou podem ser preparados analogamente aos procedimentos conhecidos na literatura do haleto correspondente por uma
15 reação de Grignard [por exemplo, A. Mannschuk et al., Angew. Chem. 100, 299 (1988)].

A reação dos derivados de heteroarila da fórmula (III) onde L^1 = hidroxila ou sais deste com aminas da fórmula (II) para dar as serinamidas substituídas por heteroarila desejadas da fórmula (I) é realizada
20 na presença de um reagente de ativação e, se apropriado, na presença de uma base, normalmente a temperaturas de 0 °C ao ponto de ebulição da mistura de reação, preferivelmente de 0 °C a 100 °C, particularmente preferivelmente a temperatura ambiente, em um solvente orgânico inerte [cf. Perich, J. W.,
25 Johns, R. B., J. Org. Chem. 53 (17), 4103-4105 (1988); Somlai, C. et al., Synthesis (3), 285-287 (1992); Gupta, A. et al., J. Chem. Soc. Perkin Trans. 2, 1911 (1990); Guan et al., J. Comb. Chem. 2, 297 (2000)].

Reagentes de ativação adequados são agentes de condensação, tais como, por exemplo, dicitloexilcarbodiimida ligada a poliestireno,

diisopropilcarbodiimida, carbonildiimidazol, ésteres clorofórmicos, tais como cloroformiato de metila, cloroformiato de etila, cloroformiato de isopropila, cloroformiato de isobutila, sec cloroformiato de butila ou cloroformiato de alila, cloreto de pivaloila, ácido polifosfórico, anidrido propanofosfônico, cloreto de bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosforila (BOPCI) ou cloretos de sulfonila, tais como cloreto de metanossulfonila, cloreto de toluenossulfonila ou cloreto de benzenossulfonila.

Solventes adequados são hidrocarbonetos alifáticos, tais como pentano, hexano, cicloexano e misturas de alcanos C_1-C_8 , hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno, tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, tais como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, tais como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butil metílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano (THF), nitrilas, tais como acetonitrila e propionitrila, cetonas, such as acetona, metil etil cetona, dietil cetona e tercbutil metil cetona, álcoois, tais como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA) e N-metilpirrolidona (NMP), ou ainda em água; é dada preferência particular a cloreto de metileno, THF, metanol, etanol e água.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Bases adequadas são, no geral, compostos inorgânicos, tais como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio, óxidos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de potássio e óxido de cálcio, carbonatos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, e também bicarbonatos de metal alcalino, tal como

bicarbonato de sódio, além disso bases orgânicas, por exemplo, aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, diisopropilamina, N-metilmorfolina e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, tais como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. É dada preferência particular a hidróxido de sódio, trietilamina, etildiisopropilamina, N-metilmorfolina e piridina.

As bases são geralmente empregadas em quantidades catalíticas; entretanto, elas também podem ser empregadas em quantidades equimolares, em excesso ou, se apropriado, como solvente.

Os materiais de partida geralmente reagem um com o outro em quantidades equimolares. Pode ser vantajoso usar um excesso de (II), com base em (III).

Desenvolvimento e isolamento dos produtos podem ser realizados de uma maneira conhecida per se. A reação dos derivados de heteroarila da fórmula (III) onde $L^1 = \text{alcóxi } C_1-C_6$ com aminas da fórmula (II) para dar as serinamidas substituídas por heteroarila desejadas da fórmula (I) é normalmente realizada a temperaturas de 0 °C ao ponto de ebulição da mistura de reação, preferivelmente de 0 °C a 100 °C, particularmente preferivelmente a temperatura ambiente, em um solvente orgânico inerte, se apropriado na presença de uma base [cf. Kawahata, N. H. et al., *Tetrahedron Lett.* 43 (40), 7221-7223 (2002); Takahashi, K. et al., *J. Org. Chem.* 50 (18), 3414-3415 (1985); Lee, Y. et al., *J. Am. Chem. Soc.* 121 (36), 8407-8408 (1999)].

Solventes adequados são hidrocarbonetos alifáticos, tais como pentano, hexano, cicloexano e misturas de alcanos C_5-C_8 , hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno, tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, tais como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, tais como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano (THF), nitritos, tais como acetonitrila e

propionitrila, cetonas, tais como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, álcoois, tais como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA) e N-metilpirrolidona (NMP), ou ainda em água; é dada preferência particular a cloreto de metileno, THF, metanol, etanol e água.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Se apropriado, a reação pode ser realizada na presença de uma base. Bases adequadas são, no geral, compostos inorgânicos, tais como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio, óxidos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de potássio e óxido de cálcio, carbonatos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, e também bicarbonatos de metal alcalino, tais como bicarbonato de sódio, além disso bases orgânicas, por exemplo, aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, diisopropilamina, N-metilmorfolina e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, tais como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. É dada preferência particular a hidróxido de sódio, trietilamina, etildiisopropilamina, N-metilmorfolina e piridina.

As bases são geralmente empregadas em quantidades catalíticas; entretanto, elas também podem ser empregadas em quantidades equimolares, em excesso ou, se apropriado, como solvente.

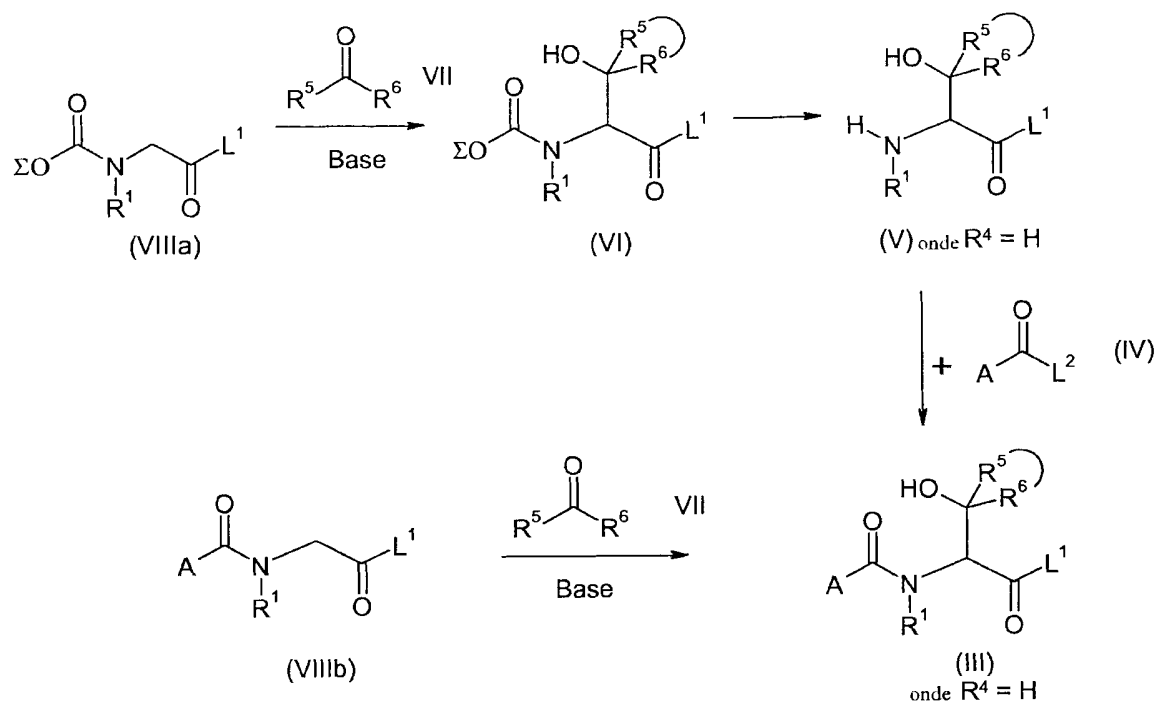
Os materiais de partida geralmente reagem um com o outro em quantidades equimolares. Pode ser vantajoso usar um excesso de (II), com base em (III).

Desenvolvimento e isolamento dos produtos podem ser realizados de uma maneira conhecida per se.

As amins da fórmula (II) requeridos para preparar as serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) são comercialmente disponíveis.

Processo B

Derivados de heteroarila da fórmula (III) onde $R^4 =$ hidrogênio também podem ser obtidos condensando derivados de glicina acilados da fórmula (VIII) onde o grupo acila pode ser um grupo protetor clivável, tais como benziloxicarbonila (cf. (Villa) onde E = benzila) ou terc-butiloxicarbonila (cf. (Villa) onde E = terc-butila), com compostos de carbonila (VII) para dar os produtos de aldol correspondentes (VI). O grupo protetor é então clivado e o derivado de serina resultante da fórmula (V) onde $R^4 =$ hidrogênio é acilado usando derivados de ácido de heteroarila da fórmula (IV), Analogamente, também é possível converter um derivado de glicina acilado da fórmula (VIII) onde o grupo acila é um radical heteroarila substituído (cf. Villb) na presença de uma base com um composto de carbonila VII no derivado de heteroarila III onde $R^4 =$ hidrogênio:



L^1 é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente, por exemplo, hidroxila ou alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_6$.

L^2 é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente, por exemplo, hidroxila, halogênio, alquilcarbonila $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxicarbonila $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquilsulfonila $\text{C}_1\text{-C}_4$, fosforila ou isoureila.

A reação dos derivados de glicina (VIII) com compostos de carbonila (VII) para dar o produto aldol correspondente (VI) ou derivado de heteroarila (III) onde $\text{R}^4 = \text{hidrogênio}$ é normalmente realizada a temperaturas de $-100\text{ }^\circ\text{C}$ ao ponto de ebulição da mistura de reação, preferivelmente de $-80\text{ }^\circ\text{C}$ a $20\text{ }^\circ\text{C}$, particularmente preferivelmente de $-80\text{ }^\circ\text{C}$ a $-20\text{ }^\circ\text{C}$, em um solvente orgânico inerte na presença de uma base [cf. J.-F. Rousseau et al., J. Org. Chem. 63, 2731-2737 (1998)].

Solventes adequados são hidrocarbonetos alifáticos, tais como pentano, hexano, cicloexano e misturas de alcanos $\text{C}_5\text{-C}_8$, hidrocarbonetos aromáticos, tais como tolueno, o-, m- e p-xileno, éteres, tais como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butil metílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida e

dimetilacetamida, particularmente preferivelmente éter dietílico, dioxano e tetraidrofurano.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Bases adequadas são, no geral, compostos inorgânicos, tais como hidretos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de potássio e óxido de cálcio, amidas de metal alcalino, tais como diisopropilamida de lítio e hexametildisilazida de lítio, compostos organometálicos, em particular alquilas de metal alcalino, tais como metillítio, butillítio e fenillítio, e também alcóxidos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como metóxido de sódio, etóxido de sódio, etóxido de potássio, terc-butóxido de potássio, terc-pentóxido de potássio e dimetoximagnésio, além disso bases orgânicas, por exemplo, aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, tais como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. É dada preferência particular a óxido de sódio, hexametildisilazida de lítio e diisopropilamida de lítio.

As bases são geralmente empregadas em quantidades equimolares; entretanto, elas também podem ser usadas cataliticamente, em excesso ou, se apropriado, como solventes.

Os materiais de partida geralmente reagem um com o outro em quantidades equimolares. Pode ser vantajoso empregar um excesso de base e/ou compostos de carbonila (VII), com base nos derivados de glicina (VIII).

Desenvolvimento e isolamento dos produtos podem ser realizados de uma maneira conhecida per se.

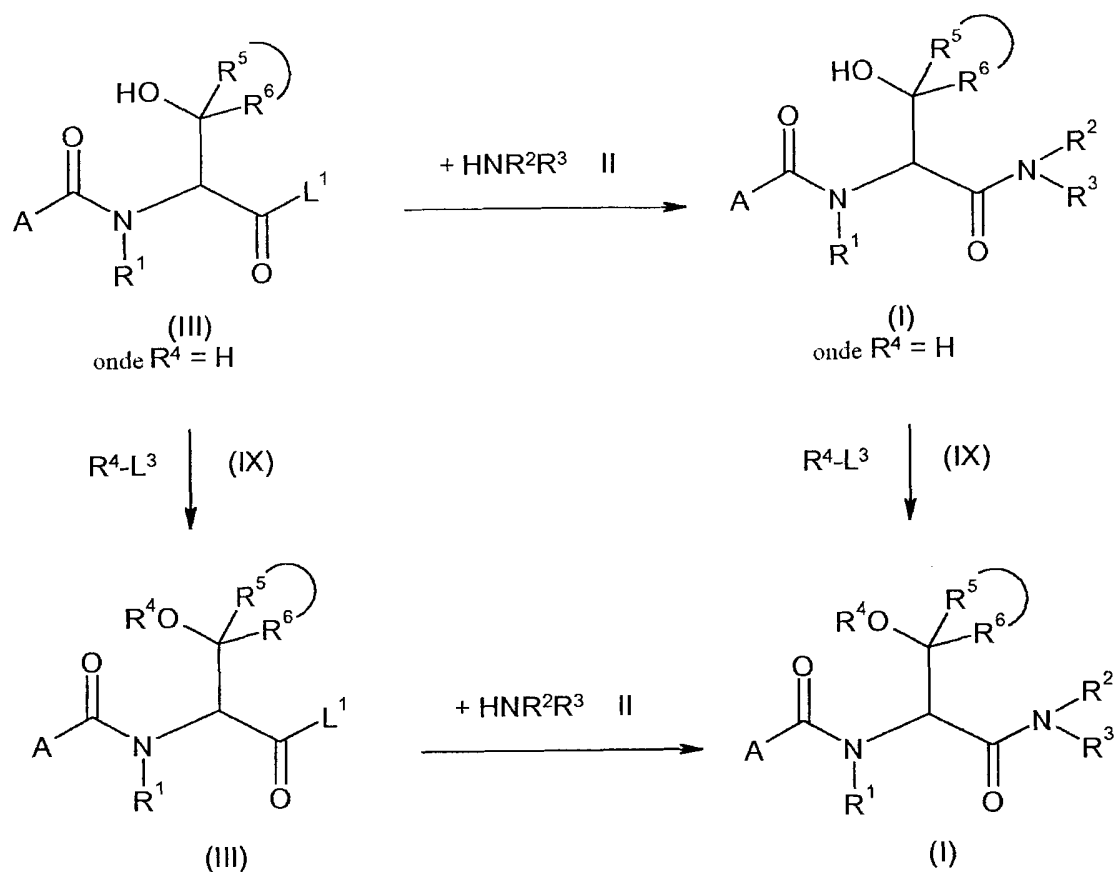
Os derivados de glicina da fórmula (VIII) requeridos para preparar os compostos (I) são comercialmente disponíveis, conhecidos na literatura [por exemplo, H. Pessoa-Mahana et al., Synth. Comm. 32, 1437 (2002)] ou pode ser preparada de acordo com a literatura citada.

O grupo protetor é clivado por processos conhecidos na literatura, dando derivados de serina da fórmula (V) onde $R^4 = \text{hidrogênio}$ [cf. J.-F. Rousseau et al., *J. Org. Chem.* 63, 2731-2737 (1998); J. M. Andres, *Tetrahedron* 56, 1523 (2000)]; no caso de $\Sigma = \text{benzila}$ por hidrogenólise, preferivelmente usando hidrogênio e Pd/C em metanol; no caso de $E = \text{terc-butila}$ usando ácido, preferivelmente ácido clorídrico em dioxano.

A reação dos derivados de serina (V) onde $R^4 = \text{hidrogênio}$ com ácidos de heteroarila/derivados de ácido de heteroarila (IV) para dar derivados de heteroarila (III) onde $R^4 = \text{hidrogênio}$ é normalmente realizada analogamente à reação mencionada no processo A dos derivados de serina da fórmula (V) com ácidos de heteroarila/derivados de ácido de heteroarila da fórmula (IV) para dar derivados de heteroarila (III).

Analogamente ao processo A, os derivados de heteroarila da fórmula (III) onde $R^4 = \text{hidrogênio}$ pode então reagir com aminas da fórmula (II) para dar as serinamidas substituídas por heteroarila desejadas da fórmula (1) onde $R^4 = \text{hidrogênio}$ que podem então ser derivatizados com compostos da fórmula (IX) para dar serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) [cf., por exemplo, Yokokawa, F. et al., *Tetrahedron Lett.* 42 (34), 5903-5908 (2001); Arrault, A. et al., *Tetrahedron Lett.* 43 (22), 4041-4044 (2002)].

Também é possível derivatizar os derivados de heteroarila da fórmula (III) onde $R^4 = \text{hidrogênio}$ inicialmente com compostos da fórmula (IX) para dar derivados adicionais de heteroarila da fórmula (III) [cf., por exemplo, Troast, D. et al., *Org. Lett.* 4 (6), 991-994 (2002); Ewing W. et al., *Tetrahedron Lett.*, 30 (29), 3757-3760 (1989); Paulsen, H. et al., *Liebigs Ann. Chem.* 565 (1987)], seguido pela reação com aminas da fórmula (II) analogamente ao processo A, dando as serinamidas substituídas por heteroarila desejadas da fórmula (I):



L^1 é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente, por exemplo, hidroxila ou alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_6$.

L^3 é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente, por exemplo, halogênio, hidroxila, ou alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_6$.

5 A reação dos derivados de heteroaróila da fórmula (III) (onde, se apropriado, $\text{R}^4 = \text{hidrogênio}$) com aminas da fórmula (II) para dar serinamidas substituídas por heteroaróila da fórmula (I) (onde, se apropriado, $\text{R}^4 = \text{hidrogênio}$) é normalmente realizada analogamente à reação dos derivados de heteroaróila da fórmula (III) com aminas da fórmula (II) descrita

10 no processo A.

A reação dos derivados de heteroaróila da fórmula (III) onde $\text{R}^4 = \text{hidrogênio}$ ou das serinamidas substituídas por heteroaróila da fórmula (I) onde $\text{R}^4 = \text{hidrogênio}$ com compostos da fórmula (IX) para dar derivados de heteroaróila da fórmula (III) ou serinamidas substituídas por heteroaróila

15 da fórmula (I) é normalmente realizada a temperaturas de $0\text{ }^\circ\text{C}$ a $100\text{ }^\circ\text{C}$,

preferivelmente de 10°C a 50 °C, em um solvente orgânico inerte na presença de uma base [cf., por exemplo, Troast, D. et al., *Org. Lett.* 4 (6), 991-994 (2002); Ewing W. et al., *Tetrahedron Lett.*, 30 (29), 3757-3760 (1989); Paulsen, H. et al., *Liebigs Ann. Chem.* 565 (1987)].

5 Solventes adequados são hidrocarbonetos alifáticos, tais como pentano, hexano, cicloexano e misturas de alcanos C₅-C₈, hidrocarbonetos aromáticos, tais como tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, tais como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, tais como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butil metílico, 10 dioxano, anisol e tetraidrofurano, nitritos, tais como acetonitrila e propionitrila, cetonas, tais como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, álcoois, tais como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida e dimetilacetamida, particularmente preferivelmente 15 diclorometano, éter terc-butil metílico, dioxano e tetraidrofurano.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Bases adequadas são, no geral, compostos inorgânicos, tais como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de 20 cálcio, óxidos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de potássio e óxido de cálcio, amidas de metal alcalino, tais como amida de lítio, amida de sódio e amida de potássio, carbonatos de metal 25 alcalino e metal alcalino terroso, tais como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, e também bicarbonatos de metal alcalino, tal como bicarbonato de sódio, compostos organometálicos, em particular alquilas de metal alcalino, tais como metilítio, butillítio e fenillítio, haletos de alquilmagnésio, tal como cloreto de metilmagnésio, e também alcóxidos de

metal alcalino e metal alcalino terroso, tais como metóxido de sódio, etóxido de sódio, etóxido de potássio, terc-butóxido de potássio, terc-pentóxido de potássio e dimetoximagnésio, além disso bases orgânicas, por exemplo, aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, diisopropilamina e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, tais como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. É dada preferência particular a hidróxido de sódio, óxido de sódio e trietilamina.

As bases são geralmente empregadas em quantidades equimolares; entretanto, elas também podem ser empregadas cataliticamente, em excesso ou, se apropriado, como solventes.

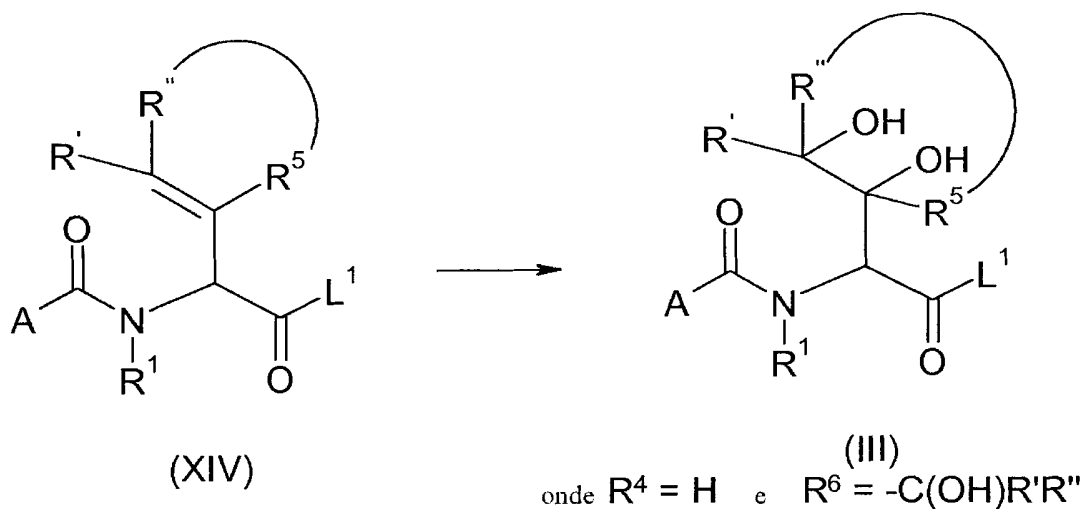
Os materiais de partida geralmente reagem um com o outro em quantidades equimolares. Pode ser vantajoso usar um excesso de base e/ou (IX), com base em (III) ou (I).

Desenvolvimento e isolamento dos produtos podem ser realizados de uma maneira conhecida per se.

Os compostos requeridos da fórmula (VIII) são comercialmente disponíveis.

Processo C

Derivados de heteroarila da fórmula (III) onde $R^4 =$ hidrogênio e $R^6 = -C(OH)R'R''$ também podem ser obtidos diidroxilando vinilglicinas da fórmula (XIV) com um agente oxidante, tais como tetróxido de ósmio ou permanganato:



L^1 é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente, por exemplo, hidroxila ou alcóxi C_1-C_6 .

R' é hidrogênio, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , hidroxialquila C_1-C_6 , fenila ou alcóxicarbonila C_1-C_6 .

5 R'' é hidrogênio, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , hidroxialquila C_1-C_6 , fenila ou alcóxicarbonila C_1-C_6 .

Esta reação é normalmente realizada a temperaturas de $-78\text{ }^\circ\text{C}$ ao ponto de ebulição da mistura de reação, preferivelmente de $-10\text{ }^\circ\text{C}$ a $120\text{ }^\circ\text{C}$, especialmente preferivelmente de $0\text{ }^\circ\text{C}$ a $50\text{ }^\circ\text{C}$, em um solvente orgânico inerte, se apropriado na presença de um agente de reoxidação, tal como, por exemplo, N-óxido de N-metilmorfolina (D. Johnson et al., Tetrahedron 2000, 56, 5, 781).

15 Solventes adequados são hidrocarbonetos halogenados, tais como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, tais como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butil metílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano, nitrilas, tais como acetonitrila e propionitrila, cetonas, tais como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, álcoois, tais como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida, dimetilacetamida e água;

20 Particularmente preferivelmente acetona ou água.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Os materiais de partida geralmente reagem um com o outro em quantidades equimolares. Pode ser vantajoso empregar um excesso de agente oxidante, com base em XIV.

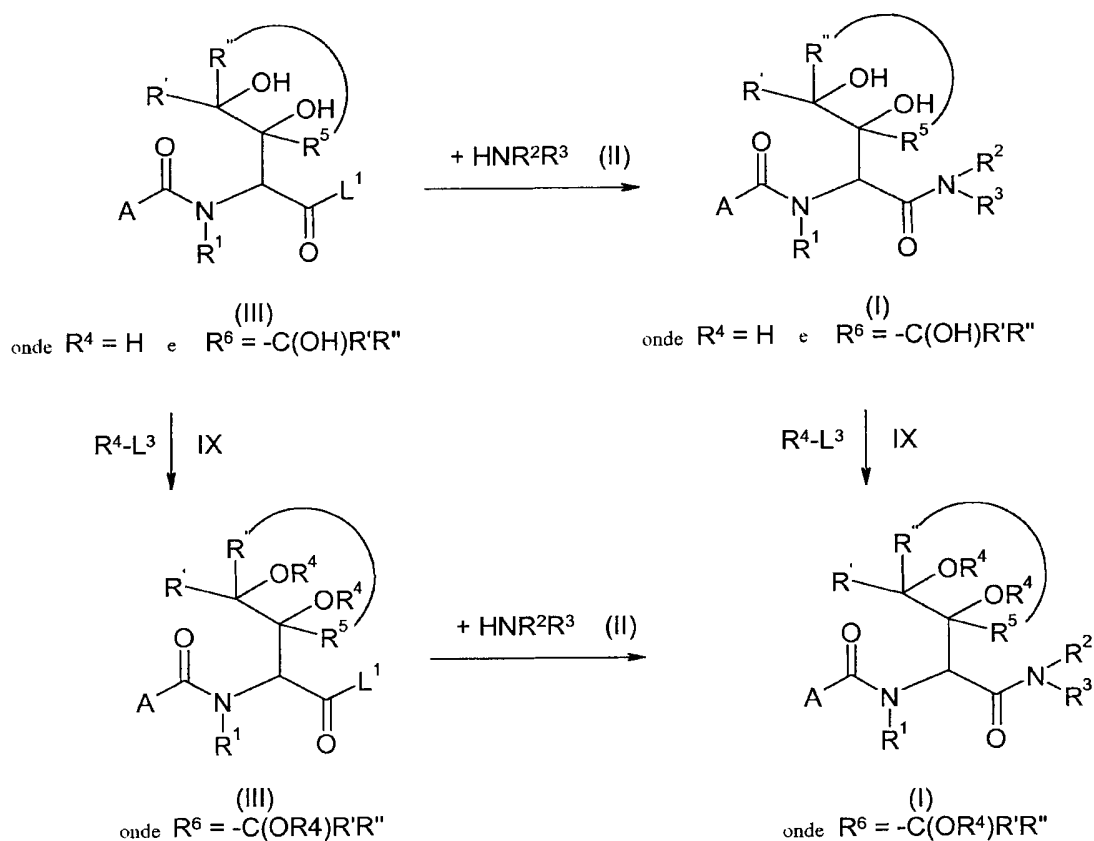
5 As misturas de reação são desenvolvidas de uma maneira costumeira, por exemplo, misturando com água, separando as fases e, se apropriado, purificação cromatográfica dos produtos brutos. Alguns dos intermediários e produtos finais são obtidos na forma de óleos viscosos que podem ser purificados ou sem componentes voláteis em pressão reduzida e
10 em temperatura moderadamente elevada. Se os intermediários e produtos finais forem obtidos na forma de sólidos, purificação também pode ser realizada por recristalização ou digestão.

As vinilglicinas da fórmula (XIV) requeridas para preparar os derivados de heteroarila da fórmula (III) onde $R^4 = \text{hidrogênio}$ e $R^6 = -\text{C(OH)R'R''}$ são conhecidas na literatura [D. B. Berkowitz et al., J. Org. Chem. 2000, 65, 10, 2907; M. Keen et al., J. Chem. Soc. Perkin 11997, 4, 487], ou elas podem ser preparadas de acordo com a literatura citada.

Os derivados de heteroarila da fórmula (III) onde $R^4 = \text{hidrogênio}$ e $R^6 = -\text{C(OH)R'R''}$ podem então reagir com aminas da fórmula
20 (II) analogamente ao processo A para dar as serinamidas substituídas por heteroarila desejadas da fórmula (I) onde $R^4 = \text{hidrogênio}$ e $R^6 = -\text{C(OH)R'R''}$, que podem então ser derivatizadas com compostos da fórmula (IX) para dar serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) onde $R^6 = -\text{C(OR}^4\text{)R'R''}$ [cf., por exemplo, Yokokawa, F. et al., Tetrahedron Lett. 42
25 (34), 5903-5908 (2001); Arrault, A. et al., Tetrahedron Lett. 43(22), 4041-4044 (2002)];

Também é possível derivatizar os derivados de heteroarila da fórmula (III) onde $R^4 = \text{hidrogênio}$ inicialmente com compostos da fórmula (IX) para dar derivados adicionais de heteroarila da fórmula (III) onde $R^6 = -$

C(OR⁴)R'R'' analogamente ao processo B [cf., por exemplo, Troast, D. et al., Org. Lett. 4 (6), 991-994 (2002); Ewing W. et al., Tetrahedron Lett., 30 (29), 3757-3760 (1989); Paulsen, H. et al., Liebigs Ann. Chem. 565 (1987)]; seguido pela reação analogamente ao processo A com aminas da fórmula (II) para dar as serinamidas substituídas por heteroaróila desejadas da fórmula (I) onde R⁶ = -C(OR⁴)R'R'':



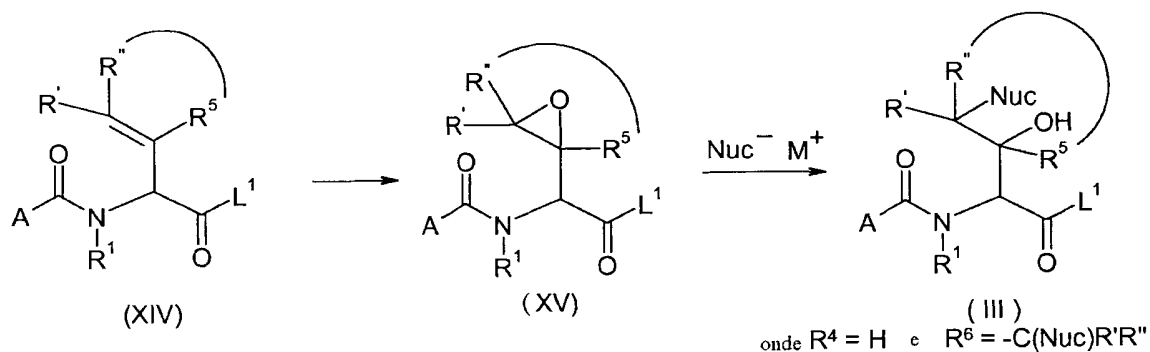
L' é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente, por exemplo, hidroxila ou alcóxi C₁-C₆.

L³ é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente, por exemplo, halogênio, hidroxila ou alcóxi C₁-C₆.

R' é hidrogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, C f-C₆-hidroxialquila, fenila ou alcóxicarbonila C₁-C₆.

R'' é hidrogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, hidroxialquila C₁-C₆, fenila ou alcóxicarbonila C₁-C₆.

Derivados de heteroaróila da fórmula (III) onde $R^4 =$ hidrogênio e $R^6 = -C(\text{Nuc})R'R''$ também podem ser obtidos epoxidando vinilglicinas da fórmula (XIV) com um agente epoxidante para dar epoxiglicinas da fórmula (XV), seguido por uma abertura de epóxido nucleofílico:



L^1 é um grupo de saída deslocável nucleofilicamente, por exemplo, hidroxila ou alcóxi C_1-C_6 .

R' é hidrogênio, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , C_1-C_6 -hidroxialquila, fenila ou alcóxicarbonila C_1-C_6 .

R'' hidrogênio, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , hidroxialquila C_1-C_6 , fenila ou alcóxicarbonila C_1-C_6 .

Nuc^-M^+ é, por exemplo, um tiolato, tal como, por exemplo, tiofenolato de sódio, um alcóxido, tal como fenóxido de potássio ou uma amida, tal como imidazolato de sódio.

A epoxidação é normalmente realizada a temperaturas de -78 °C ao ponto de ebulição da mistura de reação, preferivelmente de -20 °C a 50 °C, especialmente preferivelmente de 0 °C a 30 °C, em um solvente orgânico inerte [cf. P. Meffre et al., *Tetrahedron Lett.* 1990, 31, 16, 2291].

Adequados para uso como agentes epoxidantes são perácidos e peróxidos (por exemplo, ácido meta-cloroperbenzóico, ácido peracético, dimetildioxirano, peróxido de hidrogênio).

Solventes adequados são hidrocarbonetos halogenados, tais como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, álcoois, tais como

metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e tert-butanol, e também água, particularmente preferivelmente hidrocarbonetos halogenados e água.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Os materiais de partida geralmente reagem um com o outro em
5 quantidades equimolares. Pode ser vantajoso usar um excesso de epagente oxidante, com base em (XIV).

As misturas de reação são desenvolvidas de uma maneira
costumeira por exemplo, misturando com água, separando as fases e, se
apropriado, purificação cromatográfica dos produtos brutos. Alguns dos
10 intermediários e produtos finais são obtidos na forma de óleos viscosos which can be purified ou sem componentes voláteis em pressão reduzida e em temperatura moderadamente elevada. Se os intermediários e produtos finais forem obtidos na forma de sólidos, purificação também pode ser realizada por recristalização ou por digestão.

15 As vinilglicinas da fórmula (XIV) requeridas para preparar os derivados de heteroarila da fórmula (III) onde $R^4 = \text{hidrogênio}$ e $R^6 = -\text{C}(\text{OH})\text{R}'\text{R}''$ são conhecidas na literatura [D. B. Berkowitz et al, J. Org. Chem. 2000, 65, 10, 2907; M. Koen et al., J. Chem. Soc. Perkin 1 1997, 4, 487], ou elas podem ser preparadas de acordo com a literatura citada.

20 A abertura do epóxido é normalmente realizada a temperaturas de $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ ao ponto de ebulição da mistura de reação, preferivelmente de $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $100\text{ }^{\circ}\text{C}$, especialmente preferivelmente de $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $50\text{ }^{\circ}\text{C}$, em um solvente orgânico inerte, se apropriado na presença de um caralisador [cf. P. Meffre et al., Tetrahedron Lett. 1990, 31, 16, 2291; M. R. Paleo et al., J. Org. Chem.
25 2003, 68, 1, 130].

Solventes adequados são álcoois, tais como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida e dimetilacetamida e água, particularmente preferivelmente metanol e água.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Adequados para uso como catalisadores ácidos são ácidos de Lewis, tais como trifluoreto de boro, tricloreto de alumínio, cloreto de ferro (III), cloreto de estanho (IV), cloreto de titânio(IV), cloreto de zinco (II) e perclorato de magnésio.

O catalisador é empregado de uma maneira costumeira em uma razão de 1 a 100 mol %, preferivelmente de 1 a 10 mol %, com base no composto (XV).

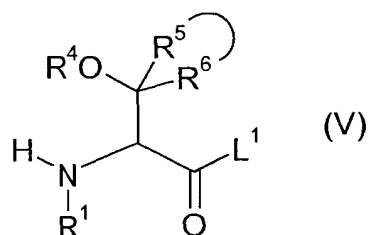
Os materiais de partida geralmente reagem um com o outro em quantidades equimolares. Pode ser vantajoso usar um excesso de Nuc^{”M”}, com base em (XV).

As misturas de reação são desenvolvidas de uma maneira costumeira por exemplo, misturando com água, separando as fases e, se apropriado, purificação cromatográfica dos produtos brutos. Alguns dos intermediários e produtos finais são obtidos na forma de óleos viscosos que são purificados ou sem componentes voláteis em pressão reduzida e em temperatura moderadamente elevada. Se os intermediários e produtos finais forem obtidos na forma de sólidos, purificação também pode ser realizada por recristalização ou digestão.

Os derivados de heteroaróila da fórmula (III) onde R⁴ = hidrogênio e R⁶ = -C(Nuc)R'R'' podem então reagir com aminas da fórmula (II) analogamente ao processo A para dar as serinamidas substituídas por benzoíla desejadas da fórmula (I) onde R⁴ = hidrogênio e R⁶ = -C(Nuc)R'R'', que então podem ser derivatizados com compostos da fórmula (IX) para dar serinamidas substituídas por heteroaróila da fórmula (I) onde R⁶ = -C(Nuc)R'R'' [cf., por exemplo, Yokokawa, F. et al., *Tetrahedron Lett.* 42 (34), 5903-5908 (2001); Arrault, A. et al., *Tetrahedron Lett.* 43(22), 4041-4044 (2002)).

Também é possível derivatizar os derivados de heteroaróila da

fórmula (III) onde R⁴ hidrogênio inicialmente com compostos da fórmula (IX) para dar derivados de benzoíla adicionais da fórmula (III) onde R⁶ = -C(Nuc)R'R'' analogamente ao processo B [cf., por exemplo, Troast, D. et al., Org. Lett. 4 (6), 991-994 (2002); Ewing W. et al., Tetrahedron Lett., 30 (29), 3757-3760 (1989); Paulsen, H. et al., Liebigs Ann. Chem. 565 (1987)], seguido por reação analogamente ao processo A com aminas da fórmula (II) para dar as serinamidas substituídas por heteroaróila desejadas da fórmula (I) onde R⁶ = -C(Nuc)R'R'':



L¹ é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente, por exemplo, hidroxila ou alcóxi C₁-C₆.

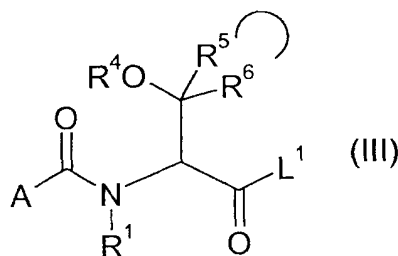
L³ é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente, por exemplo, halogênio, hidroxila ou alcóxi C₁-C₆.

R' é hidrogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, hidroxialquila C₁-C₆, fenila ou alcóxicarbonila C₁-C₆.

R'' é hidrogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, hidroxialquila C₁-C₆, fenila ou alcóxicarbonila C₁-C₆.

Nuc⁻M⁺ é, por exemplo, um tiolato, tal como, por exemplo, tiofenolato de sódio, um alcóxido, tal como fenóxido de potássio, ou uma amida, tal como imidazolato de sódio.

Derivados de heteroaróila da fórmula (III)



onde A, R¹ e R⁴, R⁵ e R⁶ são da forma definida anteriormente e L¹ é hidroxila ou alcóxi C₁-C₆ também formam parte do sujeito em questão da presente invenção.

5 As modalidades particularmente preferidas dos intermediários com relação às variáveis correspondem aos radicais A, R¹ e R⁴ a R⁶ da fórmula (I).

É dada preferência particular a derivados de heteroarila da fórmula (III) em que

10 A é heteroarila de 5 ou 6 membros selecionado do grupo que consiste em tienila, furila, pirazolila, imidazolila, tiazolila, oxazolila e piridila;

onde os radicais heteroarila mencionados podem ser parcial ou completamente halogenados e/ou podem carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆ e haloalquila C₁-C₆;

R¹ é hidrogênio;

15 R⁴ é hidrogênio, formila, alquilcarbonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄carbonila, di-(alquil C₁-C₄)aminocarbonila, fenilaminocarbonila, N-(alquil C₁-C₄)-N-(fenil)aminocarbonila, SO₂CH₃, SO₂CF₃ ou SO₂(C₆H₅);

20 R⁶ e R⁶ junto com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 7 membros que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou enxofre,

25 onde o anel é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C₁-C₆, hidroxila, alcóxi C₁-C₆, formila, alquil C₁-C₆-carbonila, alcoxycarbonila C₁-C₆, alquilaminocarbonila C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-aminocarbonila, alquilsulfonilamino, carbonila, alcoxiiimino,

onde os radicais alquila e alcóxi mencionados podem ser

parcial ou completamente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos:

ciano, hidroxila, alcóxi C_1-C_4 , fenila, parcial ou completamente halogenado, e o anel é monocíclico ou fundido a um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 6 membros adicional que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou átomos de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre,

onde o anel fundido é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 e alcóxi C_1-C_6 , ou o anel é ligado por uma cadeia saturada ou insaturada de 1 a 3 membros que não contém nenhum heteroátomo ou contém 1 átomo de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou 1 átomo de enxofre,

onde a ponte é não substituída ou substituída por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C_1-C_6 , hidroxila e alcóxi C_1-C_6 .

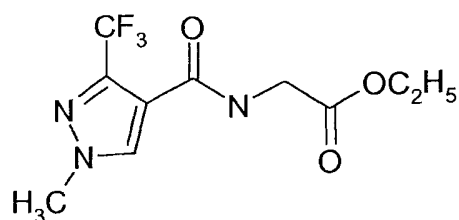
O exemplos a seguir servem para ilustrar a invenção.

Preparação exemplos

Exemplo 1

éster 1-(metilcarbamoil-[(1-metil-3-trifluorometil-1 H-pirazol-4-carbonil)amino]metil}ciclobutílico do ácido dimetilcarbâmico

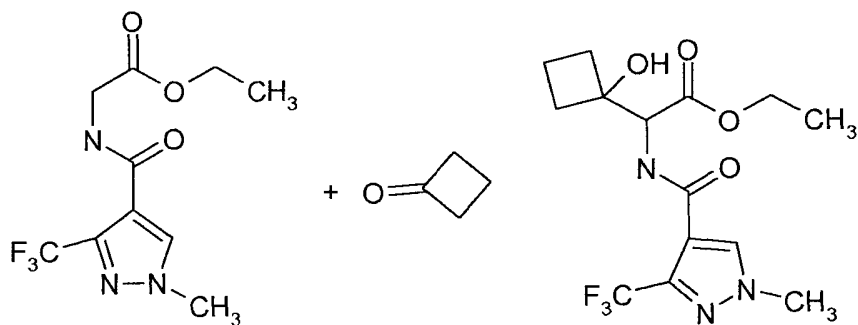
1.1 [(1-methyl-3-trifluoromethyl-1H-pyrazol-4-carbonil)amino]acetato de etila



3,63 g (25,8 mmol) de cloridrato de éster de glicina etílico foram dissolvidos em CH_2Cl_2 , THF, 5,00 g (25,8 mmol) de ácido 1-metil-3-trifluorometil-4-carboxílico e 7,82 g de trietilamina (77,3 mmol) foram adicionados a RT e 6,56 g (25,8 mmol) de cloreto de bis-(2-oxo)-3-oxazolidinil)fosfonila foram adicionados a 0 °C. A mistura foi agitada a 0 °C por 3 h e então a RT por 16 horas. Os solventes foram então removidos, o resíduo foi tomado em acetato de etila, lavado e seco e o solvente foi removido. Isto deu 3,88 g (54 % de teoria) do composto título na forma de um óleo vermelho.

10 RMN ^1H (DMSO): $\delta = 1,20$ (t, 3H); 3,95 (s, 6H); 4,15 (q, 2H); 8,35 (s, 1H); 8,65 (t, 1H).

1.2 (1-hidroxiciclobutil)-1(3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carbonil)amino-1-acetato de etila (Cpd.3.1)



23,0 mL de hexametildisilazano (mmol) foram dissolvidos em 200 mL de THF, e 46 mL de solução de butillítio 2,5 M (115 mmol) em hexano foram adicionados em gotas a -78 °C. Depois de 30 min, 7,90 g (22,3 mmol) de [(1-metil-3-trifluorometil-1 H-pirazol-4-carbonil)amino}acetato de etila, dissolvidos em 50 mL de THF, foram adicionados em gotas e a mistura foi agitada a -78 °C por 1,5 hora. 3,0 g (42,8 mmol) de ciclobutanona e 4,14 g (29,2 mmol) de BF_3 -eterato, dissolvidos em 50 mL de THF, foram

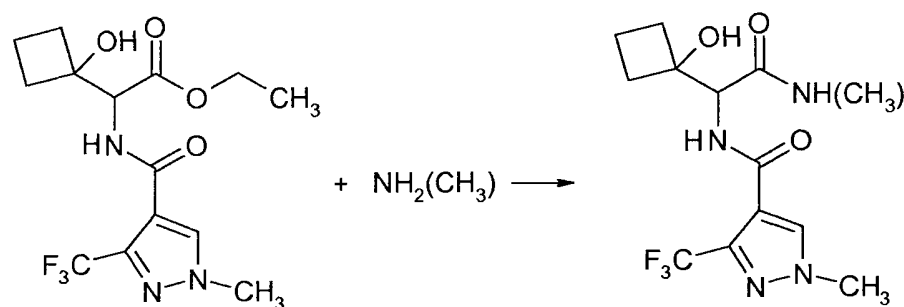
adicionados em gotas e a mistura foi agitada a $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ por 2 horas, a $-50\text{ }^{\circ}\text{C}$ por 1 hora e a $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ por 1 hora. 100 mL de solução de NH_4Cl saturada foram adicionados em gotas, e a mistura foi agitada por 30 min. A fase orgânica foi separada e os solventes foram removidos em pressão reduzida. Isto deu 9,88 g (100 %) de cristais incolores que reagiram sem purificação adicional.

RMN ^1H (DMSO): 1,2 (t, 3H); 1,5-2,2 (m, 6H); 4,1 (m, 2H); 4,6 (d, 1H); 5,4 (s, 1H); 8,0 (d, 1H); 8,5 (s, 1H)

MS (M+H): 350

Os intermediários da fórmula (III) listados na tabela 3 a seguir foram preparados de uma maneira análoga.

1.3 (1-hidroxiciclobutil)metilcarbamoilmetil-1-metil-3-trifluorometil-1 H-pirazol-4-carboxamida



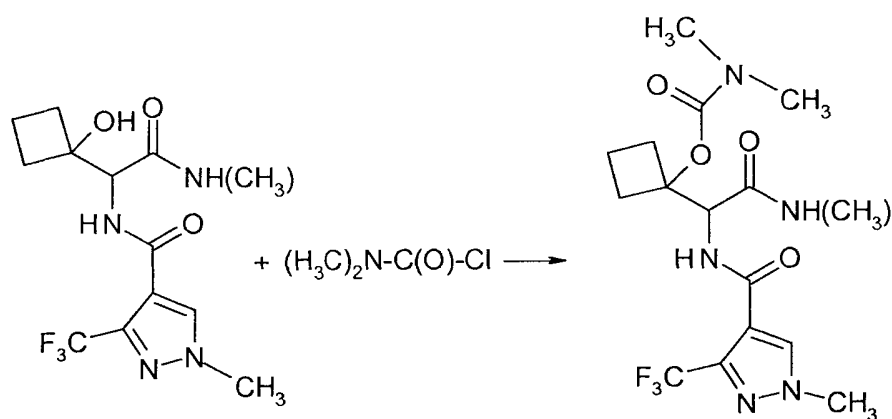
9,00 g (25,8 mmol) de [(1-metil-3-trifluorometil-1 H-pirazol-4-carbonil)-amino]acetato de etila foram dissolvidos em 400 mL de metanol, e metilamina foi introduzida a $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ por 1 hora. O precipitado resultante foi filtrado com sucção e lavado com pentano. Isto deu 4,7 g de cristais incolores.

RMN ^1H (DMSO): 1,5-2,1 (m, 5H); 2,4 (m, 1H); 2,6(d, 3H); 3,9 (s, 3H); 4,5 (d, 1H); 5,3 (s, 1H); 7,8 (s, 1H); 7,9 (d, 1H); 8,5 (s, 1H)

MS (M+H):335

MP: $210\text{ }^{\circ}\text{C}$

1.4 éster 1-{metilcarbamoil-[(1-metil-3-trifluorometil-1 H-pirazol-4-carbonil)aminolmetil]ciclobutílico do ácido dimetilcarbâmico



600 mg (1,79 mmol) de N-[(1-

hidroxiciclobutil)metilcarbamoimetil]-1-metil-3-trifluorometil-1 H-pirazol-4-carboxamida foram dissolvidos em 30 mL de THF, e 0,130 g (2,75 mmol) de óxido de sódio (60 % em óleo mineral) foi adicionado. 300 mg (2,79 mmol) de cloreto de dimetilcarbamoila foram adicionados e a mistura foi agitada a 23 °C por 15 horas. A mistura foi concentrada, o resíduo foi tomado em acetato de etila e a mistura foi lavada com água, seca com Na₂SO₄ e reconcentrada. Isto deu 650 mg (1,62 mmol, 90 % de teoria) de cristais incolores.

10 RMN ¹H (DMSO): 1,2 (m, 1H); 1,6 (m, 1 H); 1,8 (m, 1H); 2,4 (m, 3H); 2,6 (d, 3H); 2,8 (2s, 6H); 3,9 (s, 3H); 8,0 (m, 1H); 8,3 (d, 1H); 8,4 (s, 1 H)

MS (M+H): 406

MP: 190 °C

15 Os compostos da fórmula (I) listados na tabela 2 a seguir foram preparados de uma maneira análoga.

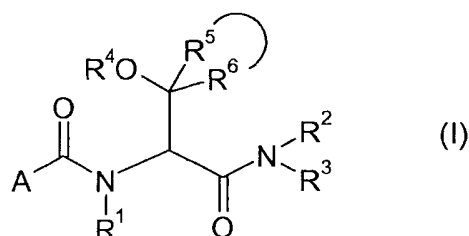


Tabela 2

Nr.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ +R ⁶	Sal	MS (m+z-FH)	P.f (°C)
2.1	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -O-C(CH ₃) ₂ -O-CH ₂ -		395	162
2.2	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		365	195
2.3	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		436	222
2.4	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		422	198
2.5	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		408	198
2.6	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		381	223
2.7	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		452	215
2.8	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -S(O)-CH ₂ -CH ₂ -		468	225
2.9	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -S(O) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		484	
2.10	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		363	211
2.11	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		349	204
2.12	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		434	195
2.13	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		406	205
2.14	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(CH ₃)-		365	210
2.15	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -		438	205
2.16	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -		367	215

Nr.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ +R ⁶	Sal	MS (m ⁺ -FH)	P.f (°C)
2.17	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₂ CH ₂ CONHCH ₃)-		434	156
2.18	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOC(CH ₃) ₃)-CH ₂ -		450	215
2.19	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		405	182
2.20	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		420	145
2.21	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -C(-O-CH ₂ -CH ₂ -O)-CH ₂ -CH ₂ -		421	214
2.22	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -C(-O-CH ₂ -CH ₂ -O)-CH ₂ -CH ₂ -		492	220
2.23	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OSi(CH ₃) ₂ C(CH ₃) ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		493	174
2.24	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(CH ₃)-		422	200
2.25	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		363	203
2.26	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		377	194
2.27	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		434	192
2.28	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOC(CH ₃) ₃)-CH ₂ -		507	
2.29	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		391	175
2.30	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		377	185
2.31	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		434	177
2.32	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COO(CH ₃) ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		535	224
2.33	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		335	210
2.34	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		406	190
2.35	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		391	170

Nr.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ +R ⁶	Sal	MS (m++H)	P.f.(°C)
2.36	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		420	228
2.37	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		406	
2.38	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		392	218
2.39	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		392	200
2.40	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	CH ₂ -CH-CH=CH-CH ₂ -CH- $\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{---} \end{array} \right]$		373	132
2.41	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	-CH-CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ - $\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{---} \end{array} \right]$		375	210
2.42	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	-CH-CH=CH-CH-CH ₂ - $\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{---} \end{array} \right]$		373	192
2.43	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH-CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ - $\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{---} \end{array} \right]$		431	194
2.44	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH-CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ - $\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{---} \end{array} \right]$		446	207
2.45	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH ₂	-CH-CH=CH-CH-CH ₂ - $\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{---} \end{array} \right]$		416	190
2.46	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OSi(CH ₃) ₂ C(CH ₃) ₃)-CH ₂ -CH ₂ - $\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{---} \end{array} \right]$		537	175
2.47	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH ₂	-CH-CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ - $\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{---} \end{array} \right]$		418	182

Nr.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ + R ⁶	Sal	MS (m++H)	P.f. (°C)
2.48	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	$\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \\ \text{CH-CH=CH-CH-CH}_2 \end{array} \right]$		444	210
2.49	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	$\left[\text{CH}_2\text{-CH-CH=CH-CH}_2\text{-CH-} \right]$		429	95
2.50	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	$\left[\text{CH}_2\text{-CH-CH=CH-CH}_2\text{-CH-} \right]$		444	156
2.51	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	$\left[\text{CH}_2\text{-CH-CH=CH-CH}_2\text{-CH-} \right]$		429	182
2.52	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		377	190
2.53	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		450	
2.54	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ -CH ₂ -		379	80
2.55	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -C(O)-CH ₂ -CH ₂ -		448	188
2.56	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -		365	
2.57	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -CH ₂ -		435	222
2.58	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		406	
2.59	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂ -CH ₂ -	HCl	364	
2.60	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(CON(CH ₃) ₂)-CH ₂ -CH ₂ -		596	184
2.61	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		477	88
2.62	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		449	212

Nr.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ +R ⁶	Sal	MS (m+-FH)	P.f (°C)
2.63	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂ -CH ₂ -	HCl	471	175
2.64	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₂ CN)-CH ₂ -CH ₂ -		474	197
2.65	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -		351	
2.66	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -		337	
2.67	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	CH ₂ -CH-CH=CH-CH ₂ -CH-		415	
2.68	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -O-CH ₂ -		408	
2.69	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -		408	
2.70	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -		422	
2.71	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(CH ₃)-		436	152
2.72	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		434	198
2.73	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		420	160
2.74	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOC(CH ₃) ₃)-CH ₂ -		521	
2.75	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		448	188
2.76	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-C(-NH-CH ₃)=C(-O-CH ₃)-C(=O)-		406	120
2.77	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-C(-O-CH ₃)=C(-O-CH ₃)-C(=O)-		407	
2.78	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-C(-O-CH ₃)=C(-OH)-C(=O)-		393	165
2.79	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂ -	CF ₃ CO ₂ H	420	
2.80	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COO(CH ₃))-CH ₂ -		479	

Nr.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ + R ⁶	Sal	MS (m++H)	P.f (°C)
2.81	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -		436	198
2.82	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -C(=N-N-CO-CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		520	
2.83	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -C(=N-N-SO ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		540	
2.84	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -C(=N-OH)-CH ₂ -CH ₂ -		463	
2.85	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -C(=N-O-CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		477	
2.86	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		399	
2.87	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		470	
2.88	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		456	
2.89	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	$\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{---} \\ \text{---CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		417	95
2.90	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	$\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{---} \\ \text{---CH-CH=CH-CH-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		415	
2.91	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	$\left[\text{N}(\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5) \right]$ -CH ₂ -CH-CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ -		462	
2.92	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	$\left[\text{N}(\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5) \right]$ -CH ₂ -CH-CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ -		519	134
2.93	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃)-		419	148
2.94	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₂ CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		404	
2.95	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₂ CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		350	

N r.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ +R ⁶	Salz	MS (m++H)	P.f (°C)
2.96	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₂ CH ₃	H	$\begin{array}{l} \text{---CH}_2\text{---} \\ \\ \text{---CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH-CH}_2\text{---} \end{array}$		390	97
2.97	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₂ CH ₃	H	-C(-O-CH(CH ₃) ₂)=C(-O-CH(CH ₃) ₂)-C(=O)-		478	
2.98	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -O-C(CH ₃) ₂ -O-CH ₂ -		395	162
2.99	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		365	195
2.100	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		436	222
2.101	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		422	198
2.102	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		408	198
2.103	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		381	223
2.104	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		452	215
2.105	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -S(O)-CH ₂ -CH ₂ -		468	225
2.106	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -S(O) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		484	
2.107	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		363	211
2.108	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		349	204
2.109	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		434	195
2.110	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		406	205
2.111	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(CH ₃)-		365	210
2.112	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -		438	205
2.113	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -		367	215

Nr.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ + R ⁶	Salz	MS (m+-FH)	P.f (°C)
2.114	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₂ CH ₂ CON HCH ₃)-		434	156
2.115	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOC(CH ₃) ₃)-CH ₂ -		450	215
2.116	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		405	182
2.117	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		420	145
2.118	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -C(-O-CH ₂ -CH ₂ -O-)-CH ₂ -CH ₂ -		421	214
2.119	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -C(-O-CH ₂ -CH ₂ -O-)-CH ₂ -CH ₂ -		492	220
2.120	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH(OSi(CH ₃) ₂ C(CH ₃) ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		493	174
2.121	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(CH ₃)-		422	200
2.122	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		363	203
2.123	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		377	194
2.124	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		434	192
2.125	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOC(CH ₃) ₃)-CH ₂ -		507	
2.126	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		391	175
2.127	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		377	185
2.128	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		434	177
2.129	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COO(CH ₃) ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		535	224
2.130	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		335	210
2.131	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		406	190

Nr.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ -FR6	Sal	MS (m++H)	P.f.(°C)
2.132	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		391	170
2.133	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		420	228
2.134	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		406	
2.135	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		392	218
2.136	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		392	200
2.137	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	CH ₂ -CH-CH=CH-CH ₂ -CH-		373	132
2.138	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ -		375	210
2.139	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	CH-CH=CH-CH-CH ₂		373	192
2.140	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	CH-CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ -		431	194
2.141	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	CH-CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ -		446	207
2.142	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH ₂	CH-CH=CH-CH-CH ₂		416	190
2.143	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	CH ₂ -CH ₂ -CH(OSi(CH ₃) ₂ C(CH ₃) ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		537	175

Nr.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ +R ⁶	Sal	MS (m++H)	P.f (°C)
2.144	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH ₂ H ₂	$\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{-CH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		418	182
2.145	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	$\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{-CH-CH=CH-CH-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		444	210
2.146	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	$\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2 \\ \text{-CH-CH=CH-CH-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		429	95
2.147	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolil	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	$\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{-CH-CH=CH-CH}_2\text{-CH-} \\ \text{CH}_2\text{-CH-CH=CH-CH}_2\text{-CH-} \end{array} \right]$		444	156
2.148	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	$\left[\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{-CH-CH=CH-CH}_2\text{-CH-} \\ \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		429	182
2.149	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	$\left[\begin{array}{c} \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \\ \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH(OH)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		377	190
2.150	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	$\left[\begin{array}{c} \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH(OH)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \\ \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH(OH)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		450	
2.151	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	$\left[\begin{array}{c} \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH(OH)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \\ \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(O)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		379	80
2.152	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	$\left[\begin{array}{c} \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(O)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \\ \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		448	188
2.153	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	$\left[\begin{array}{c} \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-CH}_2\text{-} \\ \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-N(CON(CH}_3)_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		365	
2.154	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	$\left[\begin{array}{c} \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-N(CON(CH}_3)_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \\ \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-N(COCH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		435	222
2.155	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	$\left[\begin{array}{c} \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-N(COCH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \\ \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-NH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$	HCl	406	
2.156	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	H	$\left[\begin{array}{c} \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-NH-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \\ \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-N(CON(CH}_3)_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		364	
2.157	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	$\left[\begin{array}{c} \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-N(CON(CH}_3)_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \\ \text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-N(CON(CH}_3)_2)\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-} \end{array} \right]$		596	184

Nr.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ + R ⁶	Sal	MS (m+-FH)	P.f (°C)
2.158	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COCH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		477	88
2.159	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		449	212
2.160	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂ -CH ₂ -	HCl	471	175
2.161	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₂ CN)-CH ₂ -CH ₂ -		474	197
2.162	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -		351	
2.163	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -O-CH ₂ -		337	
2.164	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	CH ₂ -CH-CH=CH-CH ₂ -CH-		415	
2.165	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -O-CH ₂ -		408	
2.166	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -		408	
2.167	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -		422	
2.168	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(CH ₃)-		436	152
2.169	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		434	198
2.170	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-		420	160
2.171	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COOC(CH ₃) ₃)-CH ₂ -		521	
2.172	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		448	188
2.173	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-C(-NH-CH ₃)=C(-O-CH ₃)-C(=O)-		406	120
2.174	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-C(-O-CH ₃)=C(-O-CH ₃)-C(=O)-		407	

Nr.	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵ + R ⁶	Sal	MS (m ⁺ -FH)	P.f (°C)
2.175	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-C(O-CH ₃)=C(OH)-C(=O)-		393	165
2.176	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -NH-CH ₂ -	CF ₃ CO ₂ H	420	
2.177	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -N(COO(CH ₃))-CH ₂ -		479	
2.178	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -		436	198
2.179	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -C(=N-N-CO-CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		520	
2.180	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -C(=N-N-SO ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		540	
2.181	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -C(=N-OH)-CH ₂ -CH ₂ -		463	
2.182	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -C(=N-O-CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -		477	
2.183	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		399	
2.184	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)N(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		470	
2.185	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		456	
2.186	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	$\left[\text{---CH}_2 \right]$ -CH-CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ -		417	95
2.187	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)CH ₃	$\left[\text{---CH}_2 \right]$ -CH-CH=CH-CH-CH ₂		415	
2.188	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	$\left[\text{N}(\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5) \right]$ -CH ₂ -CH-CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ -		462	
2.189	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	(CO)NH(CH ₃)	$\left[\text{N}(\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5) \right]$ -CH ₂ -CH-CH ₂ -CH ₂ -CH-CH ₂ -		519	134
2.190	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolilila	H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃)-		419	148

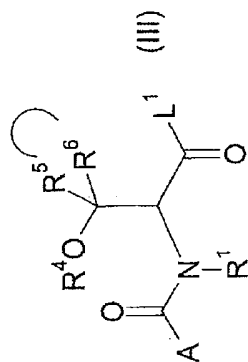


Tabela 3 (intermediários da fórmula III)

Nr.	A	R ¹	L ¹	R ⁴	R ⁶ + R ^b	MS (m ⁺ + H)	P.f (°C)
3.1	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	-O-CH ₂ -CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	350	
3.2	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	-O-CH ₂ -CH ₃	H	-CH ₂ -CH(O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂)-CH ₂ -	422	
3.3	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	-O-CH ₂ -CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	392	
3.4	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	-O-CH ₂ -CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -N(O-CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	423	120
3.4	1-CH ₃ -3-CF ₃ -4-Pirazolila	H	-O-CH ₂ -CH ₃	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ -	446	140

Atividade Biológica

Os compostos da fórmula (I) e seus sais agricolamente usados são adequados, tanto na forma de isômero misturas quanto na forma de isômeros puros, como herbicidas. As composições herbicidas compreendos compostos da fórmula (I) controlam a vegetação nas áreas de não lavoura muito eficientemente, especialmente em altas taxas de aplicação. Eles agem contragramas amplamente crescidas e gramas de erva daninha em lavouras, tais como trigo, arroz, milho, soja e algodão sem causar nenhum dano significativo às plantas de lavoura. Este efeito é principalmente observado em baixas taxas de aplicação.

Dependendo do processo de aplicação em questão, os compostos da fórmula (I), ou composições herbicidas compreendendo-os, podem adicionalmente ser empregados em inúmeras plantas de lavoura para eliminar plantas indesejáveis. Exemplos de lavouras adequadas são as seguintes:

Allium cepa, *Ananas comosus*, *Arachis hypogaea*, *Asparagus officinalis*, *Avena sativa*, *Beta vulgaris spec. altissima*, *Beta vulgaris spec. rapa*, *Brassica napus var. napus*, *Brassica napus var. napobrassica*, *Brassica rapa var. silvestris*, *Brassica oleracea*, *Brassica nigra*, *Camellia sinensis*, *Carthamus tinctorius*, *Carya illinoensis*, *Citrus limon*, *Citrus sinensis*, *Coffea arabica* (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*), *Cucumis sativus*, *Cynodon dactylon*, *Daucus carota*, *Elaeis guineensis*, *Fragaria vesca*, *Glycine max*, *Gossypium hirsutum*, (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus*, *Hevea brasiliensis*, *Hordeum vulgare*, *Humulus lupulus*, *Ipomoea batatas*, *Juglans regia*, *Lens culinaris*, *Linum usitatissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*, *Malus spec.*, *Manihot esculenta*, *Medicago sativa*, *Musa spec.*, *Nicotiana tabacum* (*N.rustica*), *Olea europaea*, *Oryza sativa*, *Phaseolus lunatus*, *Phaseolus vulgaris*, *Picea abies*, *Pinus spec.*, *Pistacia vera*, *Pisum sativum*, *Prunus armeniaca*, *Prunus avium*,

Prunus cerasus, Prunus dulcis, Prunus domestica, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Sinapis alba, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, triticale, Triticum aestivum, 5 Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera e Zea mays.

Além do mais, os compostos da fórmula (I) também podem ser usados em lavouras que toleram a ação de herbicidas devido ao plantio, incluindo processos de engenharia genética.

10 Além do mais, os compostos da fórmula (I) também podem ser usados em lavouras que toleram o ataque por insetos ou fungos devido ao plantio, incluindo processos de engenharia genética.

Os compostos da fórmula (1), ou as composições herbicidas compreendendo-os, podem ser usados, por exemplo, na forma de soluções aquosas, pós, suspensões prontas para aspergir, também suspensões ou 15 dispersões aquosas altamente concentradas, oleosas ou outras, emulsões, dispersões de óleo, pastas, poeiras, materiais para transmissão, ou grânulos, por meio de aspersão, atomização, polvilhamento, espalhamento ou aguamento. Formas de uso dependem do propósito pretendido; em qualquer caso, elas devem garantir a distribuição mais fina possível dos ingrediente 20 ativos de acordo com a invenção.

Os agentes herbicidas compreendem uma quantidade herbicidamente eficaz de pelo menos um composto da fórmula (I) ou um sal agricolamente usado de (I), e auxiliares que são costumeiros para a formulação de agentes de proteção de planta.

25 Exemplos de auxiliares costumeiros para a formulação de agentes de proteção de planta são auxiliares inertes, veículos sólidos, agentes tensoativos (tais como dispersantes, colóides protetores, emulsificantes, agentes umectantes e agentes de pegajosidade), espessantes orgânicos e inorgânicos, bactericidas, agentes anticongelamento, antiespumantes, se

apropriado corantes, e, para formulações de semente, adesivos.

Exemplos de espessantes (isto é, compostos que confere propriedades de fluxo modificadas à formulação, isto é, alta viscosidade no estado de repouso e baixa viscosidade no estado agitado) são polissacarídeos e também minerais placa orgânicos ou inorgânicos, tais como goma xantana (Kelzan® da Kelco), Rhodopol® 23 (Rhône Poulenc) ou Veegum® (da R.T. Vanderbilt) ou Attaclay® (da Engelhardt).

Exemplos de antiespumantes são emulsões de silicone (tais como, por exemplo, Silikon® SRE, da Wacker ou Rhodorsil® da Rhodia), álcoois de cadeia longa, ácidos graxos, sais de ácidos graxos, compostos de organoflúor e misturas destes.

Bactericidas podem ser adicionados para estabilizar a formulação herbicida aquosa. Exemplos de bactericidas são bactericidas com base em diclorophen e álcool benzílico hemiformal (Proxel® da ICI ou Acticide® RS da Thor Chemie e Kathon® MK da Rohm & Haas), e também derivados de isotiazolinona, tais como alquil isotiazolinonas e benzisotiazolinonas (Acticide MBS da Thor Chemie)

Exemplos de agentes anticongelamento são etileno glicol, propileno glicol, uréia ou glicerol.

Exemplos de corantes são tanto pigmentos ligeiramente solúveis em água quanto corantes solúveis em água. Exemplos que podem ser mencionados são os corantes conhecidos com os nomes Rodamina B, C.I. Pigment red 112 e Solvent red C.I. e também Pigment blue 15:4, Pigment blue 15:3, Pigment blue 15:2, Pigment blue 15:1, Pigment blue 80, Pigment yellow 1, Pigment yellow 13, Pigment red 112, Pigment red 48:2, Pigment red 48:1, Pigment red 57:1, Pigment red 53:1, Pigment orange 43, Pigment orange 34, Pigment orange 5, Pigment green 36, Pigment green 7, Pigment white 6, Pigment brown 25, basic violet 10, basic violet 49, acid red 51, acid red 52, acid red 14, acid blue 9, acid yellow 23, basic red 10, basic red 108.

Exemplos de adesivos são polivinilpirrolidona, acetato de polivinila, álcool polivinílico e tilose.

Adequados como auxiliares inertes são essencialmente os seguintes:

5 frações de óleo mineral de ponto de ebulição médio a alto, tais como querosene e óleo diesel, além de óleos de carvão e óleos de origem vegetal ou animal, hidrocarbonetos alifáticos, cíclicos e aromáticos, por exemplo, parafina, tetraidronaftaleno, naftalenos alquilados e seus derivados, benzenos alquilados e seus derivados, álcoois, tais como metanol, etanol,
10 propanol, butanol e cicloexanol, cetonas, tal como cicloexanona, solventes fortemente polares, por exemplo, aminas tal como N-metilpirrolidona, e água.

Veículos sólidos são terras mineral, tais como ácidos silícicos, géis de sílica, silicatos, talco, caulim, calcário, cal, carvão, bolla, loess, argila, dolomita, terra de diatomácea, sulfato de cálcio, sulfato de magnésio, óxido
15 de magnésio, materiais sintéticos do solo, fertilizantes, tais como sulfato de amônio, fosfato de amônio, nitrato de amônio, uréias e produtos vegetais, tais como farilha de cereal, farinha de casca de árvore, farinha de madeira e farinha de noz, celulose em pó ou outros veículos sólidos.

Agentes tensoativos adequados (adjuvantes, agentes
20 umectantes, agentes de pegajosidade, dispersantes ou emulsificantes) são os sais de metal alcalino, sais de metal alcalino terroso e sais de amônio de ácidos sulfônicos aromáticos, por exemplo, ligno- (Borresperse tipos Borregaard), fenol-, naftaleno-(Morwet tipos, Akzo Nobel) e ácido dibutilnaftalenossulfônico (Nekal tipos BASF), e de ácidos graxos, alquil- e
25 alquilarilsulfonatos, sulfatos de alquila, lauril éter sulfatos e sulfatos de álcool graxo, e sais de hexa-, hepta- e octadecanóis sulfatados, e também de ésteres de glicol de álcool graxo, condensados de naftaleno sulfonado e seus derivados com formaldeído, condensados de naftaleno ou dos ácidos naftalenossulfônicos com fenol e formaldeído, polioxietileno octilfenol éter,

isooctila etocilado, octil- ou nonilfenol, éter poliglicol de alquilfenila ou tributilfenila, álcoois de poliéter de alquilarila, álcool isotridecílico, alcoxilados, por exemplo, álcool graxo/condensados de óxido de etileno, óleo de rícino etoxilado, éteres de alquil polioxietileno ou éteres de alquil polioxipropileno, acetato de éter de poliglicol de álcool laurílico, ésteres de sorbitol, licores de resíduo de lignossulfito ou metilcelulose, e também proteínas, proteínas desnaturadas, polissacarídeos (por exemplo, metilcelulose), amidos modificados hidrofobicamente, álcool polivinílico (Mowiol tipos Clariant), policarboxilatos (BASF Sokalan tipos), polialcoxilatos, polivinilamina (BASF Lupamin tipos), polietileneimina (BASF Lupasol tipos), polivinilpirrolidona e copolímeros destes.

Pós, materiais para transmissão e poeiras podem ser preparados misturando ou moendo os ingredientes ativos junto com um veículo sólido.

Grânulos, por exemplo, grânulos revestidos, grânulos impregnados e grânulos homogêneos, podem ser preparados moendo os ingredientes ativos aos veículos sólidos. Veículos sólidos são terras de mineral, tais como sílicas, géis de sílica, silicatos, talco, caolim, calcário, cal, carvão, bole, loess, argila, dolomita, terra de diatomácea, sulfato de cálcio, sulfato de magnésio e óxido de magnésio, materiais sintéticos do solo, fertilizantes, tais como sulfato de amônio, fosfato de amônio, nitrato de amônio e uréias e produtos de origem vegetal, tais como farinha de cereal, farinha de casca de árvore, farinha de madeira e farinha de noz, celulose pós, ou outros veículos sólidos.

Formas de uso aquosas podem ser preparadas dos concentrados de emulsão, suspensões, pastas, pós umectáveis ou grânulos dispersáveis em água adicionando água. Para preparar emulsões, pastas ou dispersões de óleo, os substratos, tanto como tal quanto dissolvidos em um óleo ou solvente, podem ser homogeneizados em água por meio de um agente

umectante, agentes de pegajosidade, dispersante ou emulsificante. Alternativamente, também é possível preparar concentrados compreendendo substância ativa, agente umectante, agente de pegajosidade, dispersante ou emulsificante e, se desejado, solvente ou óleo, que são adequados para diluição com água.

As concentrações dos compostos da fórmula (I) nas preparações prontas para uso podem variar em amplas faixas. No geral, as formulações compreendem aproximadamente de 0,001 a 98 % em peso, preferivelmente 0,01 a 95 % em peso de pelo menos um ingrediente ativo. Os ingredientes ativos são empregados em uma pureza de 90 % a 100 %, preferivelmente 95 % a 100 % (de acordo com espectro de RMN).

Os seguintes são exemplos de formulações:

1. Produtos para diluição com água

A) Concentrados solúveis em água (SL, LS)

10 partes em peso de um composto ou composição de acordo com a invenção são dissolvidas em 90 partes em peso de água ou em um solvente solúvel em água. Como uma alternativa, agentes umectantes ou outros auxiliares são adicionados. Os compostos ativos dissolvem mediante diluição com água. Desta maneira, uma formulação tendo um teor total de 10 % em peso de composto ativo é obtida.

B) Concentrados dispersáveis

20 partes em peso de um composto ou composição de acordo com a invenção são dissolvidas em 70 partes em peso de cicloexanona com adição de 10 partes em peso de um dispersante, por exemplo, polivinilpirrolidona. Diluição com água dá uma dispersão. O teor de composto ativo é 20 % em peso.

C) Concentrados emulsificáveis

15 partes em peso de um composto ou composição de acordo com a invenção são dissolvidas em 75 partes em peso de xileno com adição

de dodecilbenzenossulfonato de cálcio e óleo de rícino etoxilado (em cada caso 5 partes em peso). Diluição com água dá uma emulsão. A formulação tem um teor de composto ativo de 15 % em peso.

D) Emulsões

5 25 partes em peso de um composto ou composição de acordo com a invenção são dissolvidas em 35 partes em peso de xileno com adição de dodecilbenzenossulfonato de cálcio e óleo de rícino etoxilado (em cada caso 5 partes em peso). Esta composição é introduzida em 30 partes em peso de água por meio de uma máquina emulsificante (por exemplo, Ultraturrax) e
10 preparada em uma emulsão homogênea. Diluição com água dá uma emulsão. A formulação tem um teor de composto ativo de 25 % em peso.

E) Suspensões

Em um moinho de bola agitado, 20 partes em peso de um composto ou composição, de acordo com a invenção são diminuídas com
15 adição de 10 partes em peso de dispersantes e agentes umectantes e 70 partes em peso de água ou um solvente orgânico para dar uma fina suspensão de composto ativo. Diluição com água dá uma suspensão estável dos compostos ativos. O teor de composto ativo na formulação é 20 % em peso.

F) Grânulos dispersáveis em água e grânulos solúveis em água

20 50 partes em peso de um composto ou composição, de acordo com a invenção são moídas finamente com adição de 50 partes em peso de dispersantes e agentes umectantes e preparadas na forma de grânulos dispersáveis em água ou solúveis em água por meio de ferramentas técnicas (por exemplo, extrusão, torre de jato, leiteo fluidizado). Diluição com água dá
25 uma dispersão ou solução estável dos compostos ativos. A formulação tem um teor de composto ativo de 50 % em peso.

G) Pós dispersáveis em água e pós solúveis em água

75 partes em peso de um composto ou composição, de acordo com a invenção são moídas em um moinho de disco com adição de 25 partes

em peso de dispersantes, agentes umectantes e sílica gel. Diluição com água dá uma dispersão ou solução estável dos compostos ativos. O teor de composto ativo da formulação é 75 % em peso.

H) Formulações em gel

5 20 partes em peso dos compostos ativos, 10 partes em peso de dispersante, 1 parte em peso de agente de gelificação e 70 partes em peso de água ou um solvente orgânico são moídas para dar uma suspensão fina. Em diluição com água, uma suspensão estável tendo um teor de composto ativo de 20 % em peso é obtida.

10 2. Produtos para serem aplicados sem diluição

I) Pós que podem ser polvilhados

5 partes em peso de um composto ou composição, de acordo com a invenção são moídas finamente e misturadas intimamente com 95 partes em peso de caolim finamente dividido. Isto dá um produto que pode ser polvilhado tendo um teor de composto ativo de 5 % em peso.

J) Grânulos (GR, FG, GG, MG)

0,5 parte em peso de um composto ou composição, de acordo com a invenção é finamente moída e associada a 99,5 partes em peso de veículos. Os processos atuais são extrusão, secagem por aspersão ou o leito fluidizado. Isto dá grânulos para serem aplicados sem diluição para uso foliar.

K) Soluções ULV (UL)

10 partes em peso de um composto ou composição de acordo com a invenção são dissolvidas em 90 partes em peso de um solvente orgânico, por exemplo, xileno. Isto dá um produto tendo 10 % (p/p) do composto ativo (s), que é aplicado sem diluição para uso foliar.

Os compostos da fórmula (I) ou os agentes herbicidas podem ser aplicadas pré- ou pós-emergência. Se os ingredientes ativos forem menos bem tolerados por certas plantas de lavoura, técnicas de aplicação podem ser usadas em que as composições herbicidas são jateadas, com a ajuda do

equipamento de aspersão, de uma maneira tal que se possível eles não entrem em contato com as folhas das plantas da lavoura sensíveis, enquanto que os ingredientes ativos alcançam as folhas das plantas indesejáveis que crescem debaixo ou na superfície que limita o solo (pós direcionado, reservado).

5 Em uma modalidade adicional, os compostos da fórmula (I) ou as composições herbicidas podem ser aplicadas tratando a semente.

10 O tratamento da semente compreende essencialmente todos os procedimentos familiares aos versados na tecnologia (adubo de semente, revestimento da semente, polvilhamento da semente, encharcamento da semente, revestimento da película da semente, revestimento de múltiplas camadas da semente, encrustamento da semente, gotejamento da semente e empelotamento da semente) com base nos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção ou as composições preparadas a partir deles. Aqui, as composições herbicidas podem ser aplicadas diluídas ou não diluídas.

15 O termo semente compreende semente de todos os tipos, tais como, por exemplo, milhos, sementes, frutas, tubérculos, mudas e formas similares. Aqui, preferivelmente, o termo semente descreve milhos e sementes.

20 As sementes usadas podem ser sementes das plantas usadas mencionadas anteriormente, mas também a semente de plantas transgênicas ou plantas obtidas por processos de semeadura costumeiros.

 As taxas de aplicação do composto da fórmula (I) são de 0,001 a 3,0, preferivelmente 0,01 a 1,0, kg/ha da substância ativa (as.), dependendo do alvo de controle, da estação, das plantas alvo e do estágio de crescimento.

25 Para o tratamento da semente, quantidades de 0,001 a 10 kg por 100 kg de semente são normalmente empregadas.

 Para ampliar o espectro de ação e para alcançar os efeitos sinérgicos, os compostos 3-(heterociclil)-substituído benzoilpirazol da fórmula (I) podem ser misturados com um grande número de representantes

de outros grupos de ingrediente ativo herbicida ou que regula o crescimento e então aplicados concomitantemente. Componentes adequados para misturas são, por exemplo, 1,2,4-tiadiazóis, 1,3,4-tiadiazóis, amidas, ácido aminofosfórico e seus derivados, aminotriazóis, anilidas, ácidos (het)ariloxialcanóicos e seus derivados, ácido benzóico e seus derivados, 5 benzotiadiazinonas, 2-(het)aril-1,3-cicloexanodionas, hetaril aril cetonas, benzilisoxazolidinonas, derivados de meta-CF₃-fenila, carbamatos, ácido quinolinecarboxílico e seus derivados, cloroacetanilidas, derivados de éter de oxima de cicloexenona, diazinas, ácido dicloropropiônico e seus derivados, 10 diidrobenzofurans, diidrofuran-3-onas, dinitroanilinas, dinitrofenóis, éteres de difenila, dipiridilas, ácidos halocarboxílicos e seus derivados, uréias, 3-feniluracilas, imidazóis, imidazolinonas, N-fenil-3,4,5,6-tetraidroftalimidas, oxadiazóis, oxiranos, fenóis, ésteres arilóxi- e hetariloxifenoxipropiônicos, ácido fenilacético e seus derivados, ácido 2-fenilpropilônico e seus derivados, 15 pirazóis, fenilpirazóis, piridazinas, ácido piridinacarboxílico e seus derivados, ésteres de pirimidila, sulfonamidas, sulfoniluréias, triazinas, triazinonas, triazolinonas, triazolcarboxamidas e uracilas e fenilpirazolinas, isoxazolinonas e seus derivados.

Além do mais, pode ser benéfico aplicar os compostos da fórmula (I) sozinhos ou em combinação com outros herbicidas, ou na forma 20 de um mistura com outros agentes de proteção de planta, junto, por exemplo, com agentes para controlar pragas ou fungos fitopatogênicos ou bactérias. Também de interesse é a miscibilidade com soluções de sal mineral, que são empregadas para tratar deficiências nutricionais e de elemento traço. Outros 25 aditivos, tais como óleos não fitotóxicos e concentrados de óleo também podem ser adicionados.

Exemplo de usos

A atividade herbicida das serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I) foi demonstrada pelos seguintes experimentos em

estufa:

Os recipientes de cultura usados foram potes de flores de plástico contendo areia argilosa com aproximadamente 3,0 % de úmus como o substrato. As sementes das plantas de teste foram semeadas separadamente para cada espécie.

Para o tratamento de pré-emergência, os ingredientes ativos, que foram suspensos ou emulsificados em água, foram aplicados diretamente depois do plantio por meio de bicos que distribuem finamente. Os recipientes foram irrigados suavemente para promover a germinação e crescimento e subsequentemente cobertos com tampa de plástico transparente até que as plantas tivessem girado. Esta cobertura causa germinação uniforme das plantas de teste, a menos que isto tenha sido piorado pelos ingredientes ativos.

Para o tratamento de pós-emergência, as plantas de teste primeiramente cresceram a uma altura de 3 a 15 cm, dependendo do habito da planta e somente então treçadas com os ingredientes ativos que foram suspensos ou emulsificados em água. Com este propósito, as plantas de teste foram tanto disseminadas diretamente ou cresceram nos mesmos recipientes, quanto elas primeiramente cresceram separadamente como mudas e transplantadas nos recipientes de teste poucos dias antes do tratamento. A taxa de aplicação para o tratamento pós-emergência foi 1,0 kg/ha de a.s. (substância ativa).

Dependendo da espécie, as plantas foram mantidas a 10 - 25 °C ou 20 - 35 °C. O período de teste se estendeu por 2 a 4 semanas. Durante este tempo, as plantas foram cultivadas, e sua resposta aos tratamentos individuais foi avaliada.

A avaliação foi realizada usando uma escala de 0 a 100. 100 significa nenhuma emergência de planta, ou completa destruição de pelo menos as partes aéreas, e 0 significa nenhum dano, ou curso normal de crescimento.

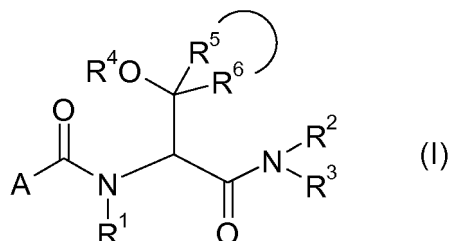
As plantas usadas no experimento de estufa pertenciam às seguintes espécies:

Nome científico	Nome comum
<i>Amaranthus retroflexus</i>	erva daninha de porco
<i>Chenopodium album</i>	lambsquaters
<i>Setaria viridis</i>	cauda de raposa verde

A taxas de aplicação de 1 kg/ha, os compostos 2.2, 2.7, 2.9, 2.12, 2.14, 2.15, 2.19, 2.21, 2.22, 2.24, 2.27, 2.28, 2.31, 2.34, 2.35, 2.36, 2.38, 2.41, 2.43, 2.44, 2.46, 2.8, 2.50, 2.51, 2.53, 2.55, 2.56, 2.57, 2.60, 2.61, 2.71, 2.72, 2.74, 2.80, 2.82, 2.83, 2.85, 2.86, 2.87, 2.88, 2.100, 2.101, 2.102, 2.104, 2.105, 2.106, 2.107, 2.109, 2.111, 2.112, 2.116, 2.117, 2.118, 2.119, 2.121, 2.124, 2.125, 2.128, 2.131, 2.132, 2.133, 2.135, 2.136, 2.137, 2.138, 2.140, 2.141, 2.143, 2.145, 2.147, 2.148, 2.149, 2.150, 2.152, 2.153, 2.154, 2.157, 2.158, 2.164, 2.168, 2.169, 2.170, 2.171, 2.177, 2.179, 2.180, 2.181, 2.182, 2.183, 2.184, 2.185, 2.186, 2.187, 2.188, 2.189 e 2.190 mostraram muito boa (> 80 %) ação pós emergência contra as plantas indesejadas *Amaranthus retroflexus*, *Chenopodium album* e *Setaria viridis*.

REIVINDICAÇÕES

1. Compostos sendo serinamidas substituídas por heteroarila caracterizados pelo fato de serem da fórmula (I)



em que as variáveis são da forma definida a seguir:

5 A é heteroarila de 5 membros selecionado de pirazolila, cujo heteroarila pode carregar 1 a 3 radicais do grupo que consiste em alquila C₁-C₆ e haloalquila C₁-C₆;

 R¹, R² são hidrogênio;

 R³ é alquila C₁-C₆;

10 R⁴ é hidrogênio, aminocarbonila, alquilaminocarbonila C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila,

 R⁵ e R⁶ juntos com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3-12 membros que é carbocíclico ou contém 1 a 3 átomos de nitrogênio, 0 a 3 átomos de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou enxofre, 0 a 2 átomos de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio e 1 átomo de enxofre,

 onde o anel é não substituído ou substituído por 1 a 3, no caso de halogênio também até o número máximo possível, substituintes do grupo que consiste em halogênio, alquila C₁-C₆, hidroxila, alcóxi C₁-C₆, trialquilsililóxi, alquilcarbonila C₁-C₆, alcoxicarbonila C₁-C₆, aminocarbonila, alquilaminocarbonila C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)aminocarbonila, amino, alquilamino C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)amino, hidroxiiimino, alcoxiimino, alquilcarbonilaminoimino C₁-C₆, alquilsulfonilaminoimino C₁-C₆,

25 onde os radicais alquila mencionados podem carregar um a

três dos seguintes grupos:

ciano, aminocarbonila, alquilamino C₁-C₄-carbonila, di-(alquil C₁-C₄)-aminocarbonila

5 e onde o anel é monocíclico ou fundido a um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 7 membros adicional que é carbocíclico ou contém 0 a 2 átomos de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 a 1 átomo de nitrogênio e 2 átomos de oxigênio ou átomos de enxofre,

onde o anel fundido é não substituído,

10 e onde o anel é não ligado ou ligado por uma cadeia saturada ou insaturada de 1 a 4 membros que não contém nenhum heteroátomo,

onde a ponte é não substituída;

ou um sal agricolamente usado deste.

15 2. Compostos sendo serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I), de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de que o heteroarila é pirazolila e podem carregar 1 a 2 radicais selecionados do grupo que consiste em alquila C₁-C₆ e haloalquila C₁-C₆.

20 3. Compostos sendo serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I), de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizados pelo fato de que R¹, R² e R⁴ são hidrogênio.

4. Compostos sendo serinamidas substituídas por heteroarila da fórmula (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 3,

25 caracterizados pelo fato de que R⁵ e R⁶ juntos com o átomo de carbono ao qual eles são anexados são um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 7 membros que é carbocíclico ou contém 1 ou 2 átomos de nitrogênio, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 0 ou 1 átomo de nitrogênio e 1 oxigênio e 1 átomo de enxofre ou 2 átomos de oxigênio ou enxofre,

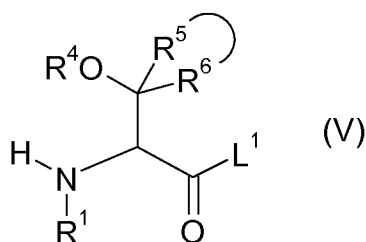
onde o anel é não substituído ou substituído da forma indicada na fórmula (I) da reivindicação 1,

e onde o anel é monocíclico ou fundido a um anel saturado ou parcialmente insaturado de 3 a 6 membros adicional, que é carbocíclico ou contém 0 a 1 átomo de nitrogênio ou 1 átomo de oxigênio ou átomo de enxofre, 2 átomos de oxigênio ou átomos de enxofre,

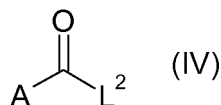
5 onde o anel fundido é não substituído,

e onde o anel é não ligado ou ligado por uma cadeia saturada ou insaturada de 1 a 3 membros que não contém nenhum heteroátomo, onde a ponte é não substituída.

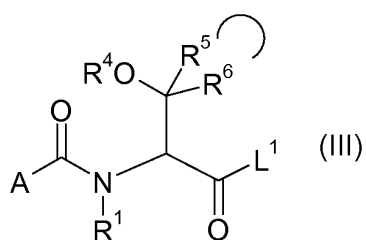
5. Processo para preparar compostos sendo serinamidas
10 substituídas por heteroarila da fórmula (I), como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 4, caracterizado pelo fato de que os derivados de serina da fórmula (V)



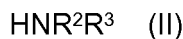
onde R¹, R⁴, R⁵ e R⁶ são da forma definida na fórmula (I) e L¹
é hidróxi ou alcóxi C₁-C₆, reagem com o ácido de heteroarila (derivados) da
15 fórmula (IV)



onde A é da forma definida na fórmula (I) e L² é hidróxi, halogênio, alquilcarbonila C₁-C₆, alcoxicarbonila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₄, fosfonila ou isoureila, para dar os derivados de heteroarila correspondentes da fórmula (III)

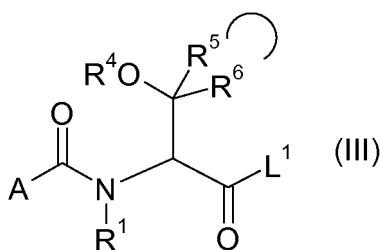


onde A, R¹, R⁴, R⁵ e R⁶ são da forma definida na fórmula (I) e L¹ é hidróxi ou alcóxi C₁-C₆, e os derivados resultantes de heteroaróila da fórmula (III) então reagem com uma amina da fórmula (II)



onde R² e R³ são da forma definida na fórmula (I).

- 5 6. Composto sendo derivado de heteroaróila para preparação de serinamidas substituídas por heteroaróila da fórmula (I) de acordo com a reivindicação 1 por um processo de acordo com a reivindicação 5, caracterizado pelo fato de ser da fórmula (III)



- 10 em que A, R¹, R⁴, R⁶ e R⁶ são da forma definida na fórmula (I) da reivindicação 1 e L¹ é um grupo de saída deslocável nucleofílicamente.

7. Composição compreendendo compostos sendo serinamidas substituídas por heteroaróila da fórmula (I) como definidas em qualquer uma das reivindicações 1 a 4, ou um sal farmacologicamente aceitável dos mesmos, caracterizados pelo fato de ter auxiliares costumeiros para a formulação de agentes de proteção de planta como e quando usados para preparar uma composição herbicida, compreendendo um ou mais auxiliares selecionados a partir do grupo que consiste de auxiliares inertes, veículos sólidos, agentes tensoativos do grupo que consiste de dispersantes, colóides protetores, emulsificantes, agentes umectantes e agentes de pegajosidade, espessantes orgânicos e inorgânicos, bactericidas, agentes anticongelamento, antiespumantes, corantes, e adesivos.