

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

(21) **PI 0713833-4 A2**

(22) Data de Depósito: 27/07/2007
(43) Data da Publicação: 11/12/2012
(RPI 2188)



(51) *Int.Cl.:*
A61K 31/454

(54) Título: COMPOSTO, MÉTODO DE CONTROLE DE DOENÇAS DE PLANTAS E COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS

(30) Prioridade Unionista: 27/07/2006 US 60/883,824, 24/01/2007 US 60/897,173, 22/06/2007 US PCT/US2007/014647, 27/07/2006 US 60/883,824, 22/06/2007 US PCT/US2007/014647, 24/01/2007 US 60/897,173

(73) Titular(es): E.I DU PONT DE MOURS AND COMPANY

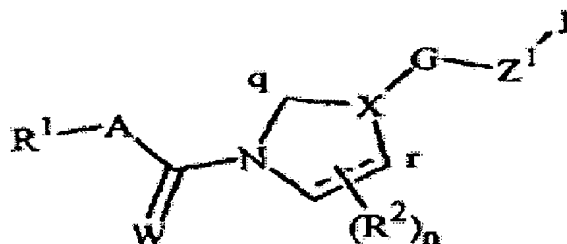
(72) Inventor(es): Mary Ann Hanagan, RAFAEL SHAPIRO, Robert James Pasteris

(74) Procurador(es): Cristiane Araújo Rodrigues

(86) Pedido Internacional: PCT US2007016875 de 27/07/2007

(87) Publicação Internacional: WO 2008/013925de 31/01/2008

(57) Resumo: COMPOSTOS, MÉTODO DE CONTROLE DE DOENÇAS DE PLANTAS E COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS. São descritos compostos das Fórmulas 1, 1A, 1B e 1C que incluem todos os seus isômeros geométricos, estereoisômeros, N-óxidos e sais, em que R^1 , R^2 , R^{4a1} , R^{4a2} , A, A^a, G, M, W, Z¹, Z³, X, J, J¹ e n são conforme definido no relatório descritivo. Também são descritas composições que contêm os compostos da Fórmula 1 e métodos de controle de doenças das plantas causadas por patógenos fúngicos, que compreendem a aplicação de uma quantidade eficaz de um composto ou composição de acordo com a presente invenção.



“COMPOSTOS, MÉTODO DE CONTROLE DE DOENÇAS DE PLANTAS E COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS”

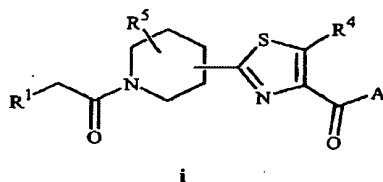
CAMPO DA INVENÇÃO

A presente invenção refere-se a certas carboxamidas, seus *N*-
óxidos, sais e composições, bem como métodos de sua utilização como
fungicidas.

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

O controle de doenças das plantas causadas por patógenos
vegetais fúngicos é extremamente importante para atingir alta eficiência de
produção. Danos por doenças de plantas a safras ornamentais, de legumes, de
campo, cereais e frutas podem causar redução significativa da produtividade e,
desta forma, resultar em aumento de custos para o consumidor. Muitos
produtos são disponíveis comercialmente com estes propósitos, mas
permanece a necessidade de novos compostos que sejam mais eficazes,
menos caros, menos tóxicos, ambientalmente mais seguros ou possuam
diferentes locais de ação.

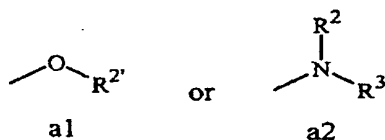
A Patente Internacional nº WO 05/003128 descreve derivados de
tiazolilpiperidina da Fórmula i como inibidores de MTP (proteína de
transferência de triglicérides microssomais):



em que:

- A é um radical selecionado a partir dos radicais a1 e a2

abaixo:

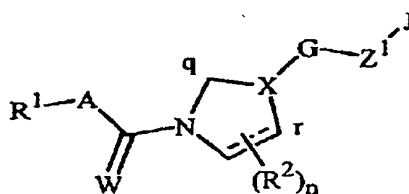


e R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são conforme definido no relatório descritivo.

A Patente Internacional nº WO 04/058751 descreve derivados de piperidinil-tiazol carboxamida para alteração da tonalidade vascular.

DESCRIÇÃO RESUMIDA DA INVENÇÃO

A presente invenção refere-se a compostos da Fórmula 1, incluindo todos os seus isômeros geométricos, estereoisômeros, *N*-óxidos e sais, composições agrícolas que os contêm e seu uso como fungicidas:



1

em que:

- R^1 é fenila opcionalmente substituído, naftalenila ou anel heteroaromático com cinco ou seis membros;

- A is CHR^{15} ou NR^{16} ;

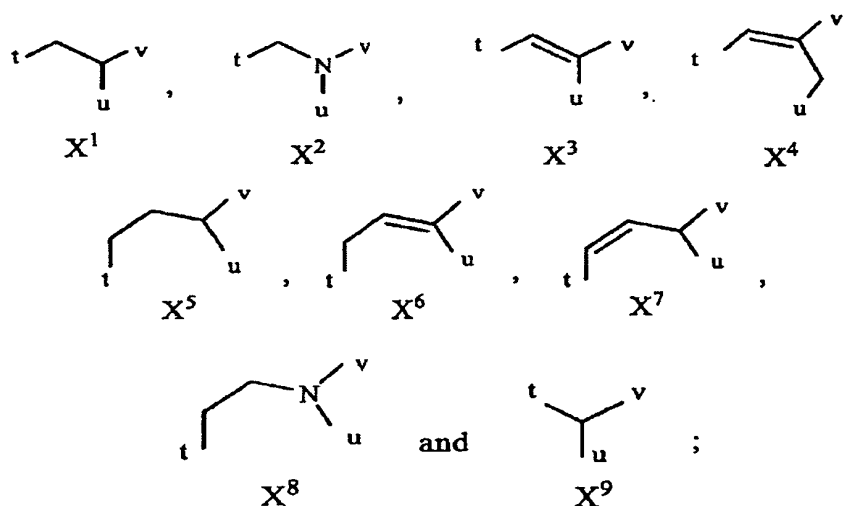
- R^{15} é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 , haloalquinila C_2-C_4 , alcoxialquila C_2-C_4 , alquiltioalquila C_2-C_4 , alquilsulfinilalquila C_2-C_4 , alquilsulfonilalquila C_2-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , haloalquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxycarbonila C_2-C_5 , alcoxycarbonilalquila C_3-C_5 , alquilaminocarbonila C_2-C_5 , dialquilaminocarbonila C_3-C_5 , alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou haloalquilsulfonila C_1-C_4 ;

- R^{16} é H, alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 , haloalquinila C_2-C_4 , alcoxialquila C_2-C_4 , alquiltioalquila C_2-C_4 , alquilsulfinilalquila C_2-C_4 , alquilsulfonilalquila C_2-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , haloalquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxycarbonila C_2-C_5 ,

alcoxicarbonilalquila C₃-C₅, alquilaminocarbonila C₂-C₅, dialquilaminocarbonila C₃-C₅, alquilsulfonila C₁-C₄ ou haloalquilsulfonila C₁-C₄;

- W é O ou S;

- X é um radical selecionado a partir de:



em que a união de X¹, X², X³, X⁴, X⁵, X⁶, X⁷, X⁸ ou X⁹ que é identificada com “t” é conectada ao átomo de carbono identificado com “q” da Fórmula 1, a união que é identificada com “u” é conectada ao átomo de carbono identificado com “r” da Fórmula 1 e a união que é identificada com “v” é conectada a G;

- cada R² é independentemente alquila C₁-C₄, alquenila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, halogênio, ciano ou hidróxi; ou

- dois R² são tomados em conjunto como alquilenos C₁-C₃ ou alquilenos C₂-C₃ para formar um sistema de anéis bicíclicos em ponte ou bicíclicos fundidos; ou

- dois R² ligados a átomos de carbono de anéis adjacentes unidos por uma união dupla são tomados em conjunto como -CH=CH-CH=CH- opcionalmente substituído com um a três substituintes selecionados a partir de alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, halogênio, hidróxi, amino, ciano e nitro;

- G é um anel heteroaromático com cinco membros
opcionalmente substituído ou um anel heterocíclico saturado ou parcialmente
saturado com cinco membros;

- J é um anel com cinco, seis ou sete membros, sistema de
anéis bicíclicos com oito a onze membros ou um sistema de anéis
espirocíclicos com sete a onze membros, em que cada anel ou sistema de
anéis contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e,
opcionalmente, um a quatro heteroátomos selecionados a partir de até 2 O, até
2 S e até 4 N e que inclui opcionalmente de um a três membros de anéis
selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂ e
SiR¹⁷R¹⁸, em que cada anel ou sistema de anéis é opcionalmente substituído
com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁵;

- cada R⁵ é independentemente H, halogênio, ciano, hidróxi,
amino, nitro, -CHO, -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, -NR²⁵R²⁶, alquila C₁-C₆, alquenila
C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-
C₆, cicloalquila C₃-C₈, halocicloalquila C₃-C₈, alquilocicloalquila C₄-C₁₀,
cicloalquilalquila C₄-C₁₀, cicloalquilocicloalquila C₆-C₁₄, halocicloalquilalquila C₄-
C₁₀, alquilocicloalquilalquila C₅-C₁₀, cicloalquenila C₃-C₈, halocicloalquenila C₃-
C₈, alcoxialquila C₂-C₆, cicloalcoxialquila C₄-C₁₀, alcoxialcoxialquila C₃-C₈,
alquiltioalquila C₂-C₆, alquilsulfinilalquila C₂-C₆, alquilsulfonilalquila C₂-C₆,
alquilaminoalquila C₂-C₆, dialquilaminoalquila C₃-C₈, haloalquilaminoalquila C₂-
C₆, cicloalquilaminoalquila C₄-C₁₀, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-
C₆, cicloalquilcarbonila C₄-C₈, alcoxicarbonila C₂-C₆, cicloalcoxicarbonila C₄-C₈,
cicloalquilalcoxicarbonila C₅-C₁₀, alquilaminocarbonila C₂-C₆,
dialquilaminocarbonila C₃-C₈, cicloalquilaminocarbonila C₄-C₈, haloalcoxialquila
C₂-C₆, hidroxialquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈,
halocicloalcóxi C₃-C₈, cicloalquilalcóxi C₄-C₁₀, alquenilóxi C₂-C₆, haloalquenilóxi
C₂-C₆, alquililóxi C₂-C₆, haloalquililóxi C₂-C₆, alcoxialcóxi C₂-C₆,

- alquilcarbonilóxi C₂-C₆, haloalquilcarbonilóxi C₂-C₆, cicloalquilcarbonilóxi C₄-C₈,
 alquilcarbonilalcóxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-
 C₈, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆,
 haloalquilsulfonila C₁-C₆, cicloalquilsulfonila C₃-C₈, trialquilsilila C₃-C₁₀,
 5 alquilsulfonilamino C₁-C₆, haloalquilsulfonilamino C₁-C₆ ou -Z²Q;
 - R²⁵ é H, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈,
 alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₆ ou
 haloalcóxicarbonila C₂-C₆;
 - R²⁶ é alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈,
 10 alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₆,
 haloalcóxicarbonila C₂-C₆ ou -Z⁴Q;
 - cada R¹⁷ e R¹⁸ é independentemente alquila C₁-C₅,
 alquenila C₂-C₅, alquinila C₂-C₅, cicloalquila C₃-C₅, halocicloalquila C₃-C₆,
 cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquila C₄-C₇, alquilocicloalquilalquila C₅-C₇,
 15 haloalquila C₁-C₅, alcóxi C₁-C₅ ou haloalcóxi C₁-C₅;
 - cada Q é independentemente fenila, benzila, naftalenila,
 um anel heteroaromático com cinco ou seis membros ou um sistema de anéis
 bicíclicos heteroaromáticos com oito a onze membros, cada qual
 opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados
 20 independentemente a partir de R⁷ sobre membros de anéis de átomos de
 carbono e R¹² sobre membros de anéis de átomos de nitrogênio; ou
 - cada Q é independentemente um anel carbocíclico não
 aromático de três a sete membros, um anel heterocíclico não aromático com
 cinco, seis ou sete membros ou um sistema de anéis bicíclicos não aromáticos
 25 com oito a onze membros, em que cada qual inclui opcionalmente membros de
 anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂
 e SiR¹⁷R¹⁸ e opcionalmente substituído com um a cinco substituintes
 selecionados independentemente a partir de R⁷ sobre membros de anéis de

átomos de carbono e R^{12} sobre membros de anéis de átomos de nitrogênio;

- cada R^7 é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilocicloalquila C_4-C_{10} , alquilocicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialquilsilila C_3-C_6 ; ou

- R^5 e R^7 são tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído que contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N e que incluem opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$, $S(O)_2$ e $SiR^{17}R^{18}$;

- R^{12} é H, alquila C_1-C_3 , alquilcarbonila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_3 ou alcoxicarbonila C_1-C_3 ;

- cada Z^1 e Z^2 é independentemente uma união direta, O, $C(=O)$, $S(O)_m$, CHR^{20} ou NR^{21} ;

- cada Z^4 é independentemente O, $C(=O)$, $S(O)_m$ ou CHR^{20} ;

- cada R^{20} é independentemente H, alquila C_1-C_4 ou haloalquila C_1-C_4 ;

- cada R^{21} é independentemente H, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , alquilcarbonila C_2-C_6 , haloalquilcarbonila C_2-C_6 ,

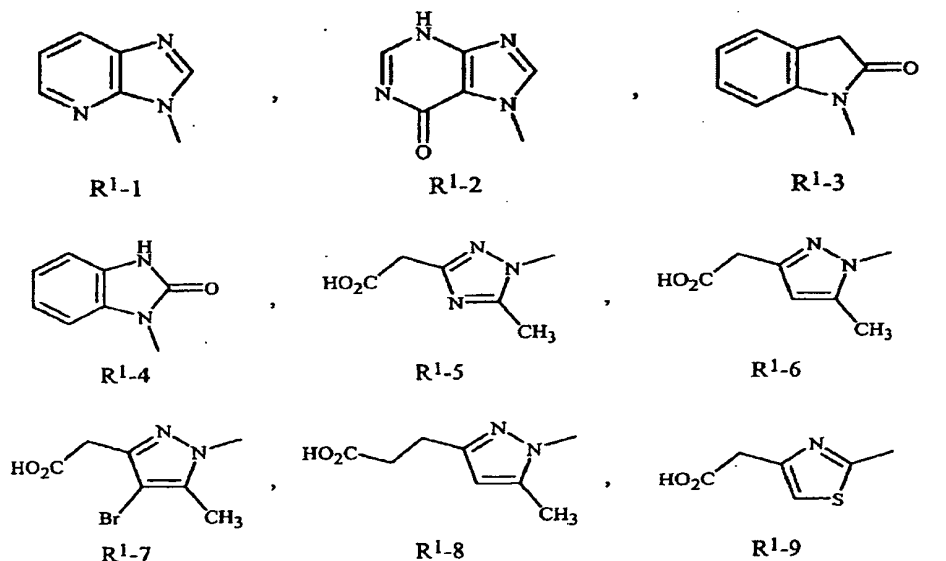
alcoxicarbonila C₂-C₆ ou haloalcoxicarbonila C₂-C₆;

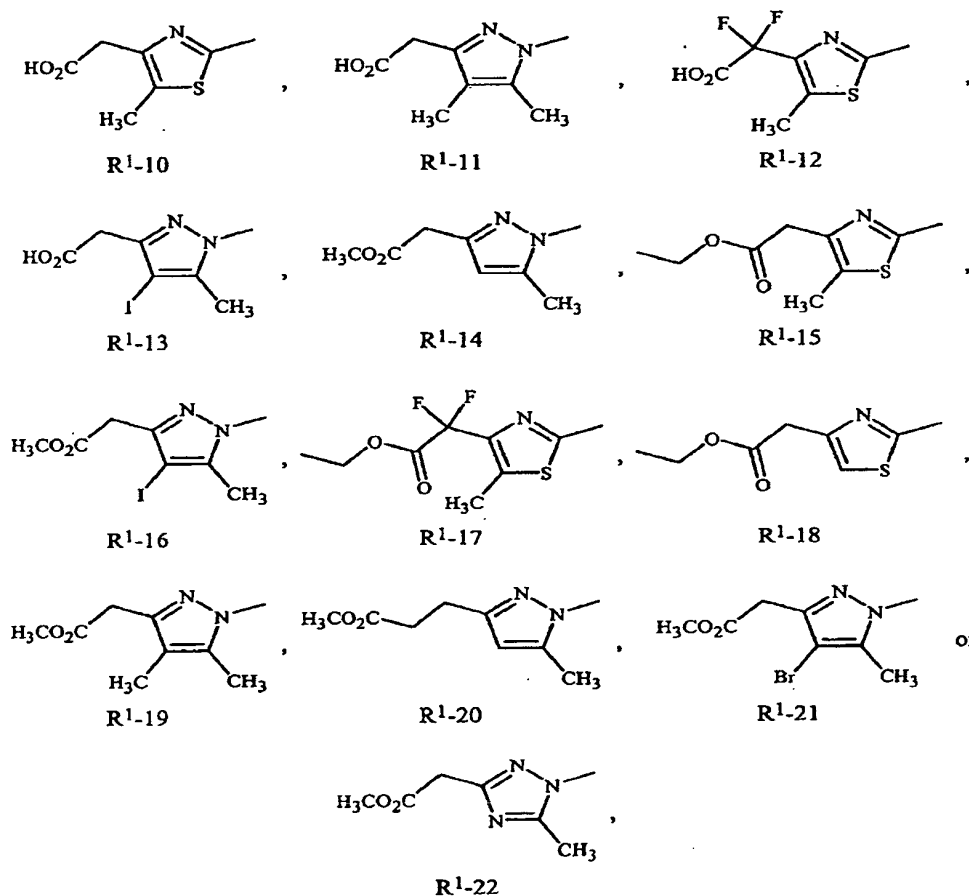
- cada m é independentemente 0, 1 ou 2; e
- n é 0, 1 ou 2;

desde que:

- 5 (a) quando R¹ for tienila não substituído, X for X¹ e o anel que contém X for saturado, G for um anel tiazol não substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z¹ na Fórmula 1, A for CHR¹⁵, R¹⁵ for H e J for um anel isoxazol conectado na sua posição 4 a Z¹, substituído na sua posição 5 com metila e na sua posição 3 com fenila meta-substituído, Z¹ é O,
- 10 C(=O), S(O)_m, CHR²⁰ ou NR²¹.

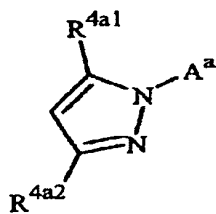
Mais especificamente, a presente invenção refere-se a compostos da Fórmula 1 que incluem todos os seus isômeros geométricos e estereoisômeros, N-óxidos e sais; desde que (b) quando A for NR¹⁶, X for X¹ ou X², Z¹ for uma união direta e J for fenila, J é substituído com pelo menos um R⁵ diferente de H, F, Cl, CN, OCH₃, CF₃ e CH₃; e (c) quando A for CHR¹⁵, R¹⁵ for H, W for O, X for X¹, n for 0, G for um anel tiazol conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z¹ na Fórmula 1 e unido na sua posição 5 a H, F, Cl ou Br, Z¹ for uma união direta e R¹ for:





quando J for um fenila substituído ou pirimidin-4-ila substituído, ele é substituído com pelo menos um R⁵ diferente de H, SCF₃, OCF₃, C(CH₃)₃, S(O)₂CF₃, OCH₃, CF₃, Br, ciclopropila, 1-metilciclopropila, OH ou CF₂CH₃ e, quando J for um 2,3-di-hidro-1H-inden-4-ila ou 5,6,7,8-tetraidronaftalen-2-ila, ele é substituído com pelo menos um R⁵ diferente de H, CH₃ ou C(CH₃)₃.

A presente invenção também se refere a um composto da Fórmula 1A:



em que:

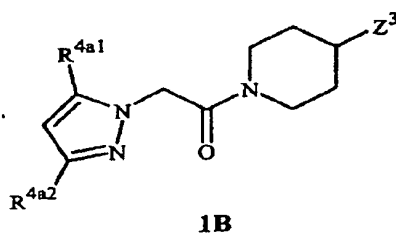
- cada R^{4a1} e R^{4a2} é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , haloalquinila C_2-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_2 , haloalcóxi C_1-C_2 , alquiltio C_1-C_2 , haloalquiltio C_1-C_2 , alcoxialquila C_2-C_3 , alquilcarbonila C_2-C_3 , alcoxycarbonila C_2-C_3 , alquilaminocarbonila C_2-C_3 ou dialquilaminocarbonila C_3-C_4 ;

- A^a é H, CH_2CO_2H , $CH_2CO_2R^{30}$ ou $CH_2C(=O)Cl$; e

- R^{30} é alquila C_1-C_3 .

A presente invenção também se refere a um composto da

10 Fórmula 1B:

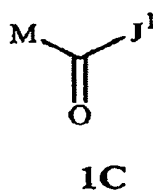


em que:

- cada R^{4a1} e R^{4a2} é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , haloalquinila C_2-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_2 , haloalcóxi C_1-C_2 , alquiltio C_1-C_2 , haloalquiltio C_1-C_2 , alcoxialquila C_2-C_3 , alquilcarbonila C_2-C_3 , alcoxycarbonila C_2-C_3 , alquilaminocarbonila C_2-C_3 ou dialquilaminocarbonila C_3-C_4 ; e

- Z^3 é CN ou $C(=S)NH_2$.

20 A presente invenção refere-se ainda a um composto da Fórmula 1C:



em que:

- M é alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, hidróxi, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₂, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, 1-piperidinila, 1-pirrolidinila ou 4-morfolinila; e

5 - J¹ é J-29-1 até J-29-58 exibidos na Ilustração A conforme descrito abaixo.

Mais especificamente, a presente invenção refere-se a compostos das Fórmulas 1A, 1B e 1C, incluindo todos os seus isômeros geométricos e estereoisômeros, *N*-óxidos ou sais (exceto pelo fato de que os compostos da
10 Fórmula 1C de acordo com a presente invenção são limitados às realizações de estereoisômeros ilustradas para J¹ na Descrição Resumida da Invenção acima).

A presente invenção também se refere a uma composição fungicida que compreende uma quantidade eficaz como fungicida de um
15 composto da Fórmula 1 e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativos, diluentes sólidos ou diluentes líquidos.

A presente invenção também se refere a uma composição fungicida que compreende uma mistura de um composto da Fórmula 1
20 (incluindo todos os seus isômeros geométricos, estereoisômeros, *N*-óxidos e sais) e pelo menos um outro fungicida (tal como pelo menos um outro fungicida que possui um local de ação diferente).

A presente invenção refere-se ainda a um método de controle de doenças de plantas causadas por patógenos vegetais fúngicos que
25 compreende a aplicação à planta ou parte dela, ou à semente de planta, de uma quantidade eficaz como fungicida da Fórmula 1 (incluindo todos os isômeros geométricos, estereoisômeros, *N*-óxidos e sais) (tais como na forma de composição descrita no presente).

A presente invenção também se refere a métodos e composições fungicidas de controle de doenças de plantas conforme descrito acima, exceto pela ressalva de que (a) é removido da definição do escopo da Fórmula 1.

DESCRIÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO

Da forma utilizada no presente, as expressões “compreende”, “que compreende”, “inclui”, “que inclui”, “contém”, “que contém” ou qualquer outra de suas variações, destinam-se a cobrir uma inclusão não exclusiva. Uma composição, processo, método, artigo ou aparelho que compreende uma lista de elementos, por exemplo, não se limita necessariamente a apenas aqueles elementos, mas pode incluir outros elementos não relacionados expressamente ou inerentes a essa composição, processo, método, artigo ou aparelho. Além disso, a menos que indicado expressamente em contrário, “ou” indica ou inclusivo e não ou exclusivo. Condição A ou B, por exemplo, é satisfeita por qualquer um dos seguintes: A é verdadeiro (ou presente) e B é falso (ou ausente), A é falso (ou ausente) e B é verdadeiro (ou presente) e ambos, A e B, são verdadeiros (ou presentes).

Além disso, o uso de “um” ou “uma” é empregado para descrever elementos e componentes de acordo com a presente invenção. Isso é feito meramente por conveniência e para fornecer um sentido geral da presente invenção. O presente relatório descritivo deverá ser lido como incluindo um ou pelo menos um e o singular também inclui o plural, a menos que seja óbvio que indica em contrário.

Conforme indicado no presente relatório descritivo e nas reivindicações, “planta” inclui membros do reino vegetal, particularmente plantas de sementes (Spermatopsida), em todos os estágios da vida, incluindo plantas jovens (tais como sementes em germinação que se desenvolvem em mudas) e estágios reprodutores maduros (tais como plantas produtoras de flores e sementes). Partes de plantas incluem membros geotrópicos que

7 crescem tipicamente abaixo da superfície do meio de crescimento (tal como
 2 solo), como raízes, tubérculos, bulbos e caules subterrâneos, bem como
 membros que crescem acima do meio de crescimento, tais como folhagem
 (incluindo hastes e folhas), flores, frutos e sementes.

5 Nas descrições acima, o termo “alquila”, utilizado isoladamente ou
 em palavras compostas tais como “alquiltio” ou “haloalquila”, inclui alquila de
 cadeia linear ou ramificado, tal como metila, etila, *n*-propila, *i*-propila ou os
 diferentes isômeros de butila, pentila ou hexila. “Alquenila” inclui alquenos de
 cadeia linear ou ramificados tais como etenila, 1-propenila, 2-propenila e os
 10 diferentes isômeros de butenila, pentenila e hexenila. “Alquenila” também inclui
 polienos tais como 1,2-propadienila e 2,4-hexadienila. “Alquinila” inclui alquinas
 de cadeia linear ou ramificadas tais como etinila, 1-propinila, 2-propinila e os
 diferentes isômeros de butinila, pentinila e hexinila. “Alquinila” pode também
 incluir porções compostas de diversas uniões triplas tais como 2,5-hexadiinila.
 15 “Alquilenos” indica alcanodiila de cadeia linear ou ramificado. Exemplos de
 “alquilenos” incluem CH_2 , CH_2CH_2 , $\text{CH}(\text{CH}_3)$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ e os
 diferentes isômeros de butileno. “Alquenilenos” indica alquenodiila de cadeia
 linear ou ramificado que contém uma união olefínica. Exemplos de
 “alquenilenos” incluem $\text{CH}=\text{CH}$, $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$, $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$, $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$ e
 20 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$. “Alcóxi” inclui, por exemplo, metóxi, etóxi, *n*-propilóxi,
 isopropilóxi e os diferentes isômeros butóxi, pentóxi e hexilóxi. “Alcoxialquila”
 indica substituição alcóxi sobre alquila. Exemplos de “alcoxialquila” incluem
 CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ e
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$. “Alquiltio” inclui porções alquiltio de cadeia linear ou
 25 ramificada tais como metiltio, etiltio e os diferentes isômeros propiltio, butiltio,
 pentiltio e hexiltio. “Alquilsulfinila” inclui os dois enantiômeros de um grupo
 alquilsulfinila. Exemplos de “alquilsulfinila” incluem $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$,
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})$ e os diferentes isômeros de butilsulfinila,

pentilsulfonila e hexilsulfonila. Exemplos de “alquilsulfonila” incluem $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$ e os diferentes isômeros de butilsulfonila, pentilsulfonila e hexilsulfonila. Exemplos de “alquilcarbonila” incluem $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ e $\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$. Exemplos de “alcoxicarbonila” incluem $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ e os diferentes isômeros de butóxi ou pentoxicarbonila. Exemplos de “alquilaminocarbonila” incluem $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})-$ e os diferentes isômeros de butilamino ou pentilaminocarbonila. Exemplos de “dialquilaminocarbonila” incluem $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})-$ e $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})-$. “Alquilamino”, “dialquilamino” e similares são definidos de forma análoga aos exemplos acima. “Trialkilsilila” inclui três radicais alquila de cadeia linear e/ou ramificada conectados e ligados por meio de um átomo de silício, tais como trimetilsilila, trietilsilila e *terc*-butildimetilsilila. “Cicloalquila” inclui, por exemplo, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila e ciclohexila. Exemplos de “cicloalquilalquila” incluem ciclopropilmetila, ciclopentiletila e outras porções cicloalquila unidas a grupos alquila ramificados ou de cadeia linear. “Alquilocicloalquila” inclui substituição alquila sobre uma porção cicloalquila. Exemplos incluem 4-metilciclohexila e 3-etilciclopentila.

A menos que indicado em contrário, “anel” ou “sistema de anéis” como um componente da Fórmula 1 (tal como tal como substituinte J e Q) é carbocíclico ou heterocíclico. A expressão “sistema de anéis” indica dois ou mais anéis conectados. A expressão “sistema de anéis espirocíclicos” indica um sistema de anéis que consiste de dois anéis conectados em um único átomo (de tal forma que os anéis contenham um único átomo em comum). Ilustra uma porção J^1 que é um sistema de anéis espirocíclicos é J-29-28 ilustrado na definição da Fórmula 1C. A expressão “sistema de anéis bicíclicos”

indica um sistema de anéis que consiste de dois anéis que compartilham dois ou mais átomos comuns. Em um “sistema de anéis bicíclicos fundidos”, os átomos comuns são adjacentes e, portanto, os anéis compartilham dois átomos adjacentes e a união que os conecta. Em um “sistema de anéis bicíclicos em ponte”, os átomos comuns não são adjacentes (ou seja, não há união entre os átomos de cabeça de ponte). Um “sistema de anéis bicíclicos em ponte” é formado conceitualmente pela união de um segmento de um ou mais átomos a membros de anéis não adjacentes de um anel.

Um anel, sistema de anéis bicíclicos ou sistema de anéis espirocíclicos podem ser parte de um sistema de anéis estendidos que contém mais de dois anéis em que substituintes sobre o anel, sistema de anéis bicíclicos ou espirocíclicos são tomados em conjunto para formar os anéis adicionais, que podem possuir relacionamentos bicíclicos e/ou espirocíclicos com outros anéis no sistema de anéis estendidos. A porção J¹ específica J-29-26 ilustrada na definição da Fórmula 1C, por exemplo, consiste de um anel di-hidro isoxazolina que contém um substituinte R⁵ como Z²Q, que é um anel ciclobutila substituído com dois grupos metila como R⁷ e também um grupo R⁷ tomado em conjunto com um outro substituinte R⁵ sobre o anel di-hidro isoxazolina como -CH₂CH₂- para formar o componente de anel com seis membros adicional no sistema de anéis.

A expressão “membro de anel” indica um átomo (tal como C, O, N ou S) ou outra porção (tal como C(=O), C(=S), S(O) ou S(O)₂) que forma a cadeia principal de um anel ou sistema de anéis. A expressão “anel carbocíclico” indica um anel em que os átomos que formam a cadeia principal de anel são selecionados apenas a partir de carbono. A expressão “sistema de anéis carbocíclicos” indica dois ou mais anéis fundidos em que os átomos que formam a cadeia principal dos anéis são selecionados apenas a partir de carbono. A expressão “anel heterocíclico” indica um anel em que pelo menos

um dos átomos que formam a cadeia principal de anel é diferente de carbono.

A expressão “sistema de anéis heterocíclicos” indica dois ou mais anéis fundidos em que pelo menos um dos átomos que formam a cadeia principal dos anéis é diferente de carbono. “Aromático” indica que cada um dos átomos

de anéis encontra-se essencialmente no mesmo plano e possui *p*-orbital perpendicular ao plano de anel, em que $(4n + 2) \pi$ elétrons, em que *n* é um número inteiro positivo, são associados ao anel para atender à lei de Hückel. A expressão “anel heteroaromático” indica um anel heterocíclico que é aromático.

A expressão “anel heterocíclico saturado” indica um anel heterocíclico que contém apenas uniões simples entre membros de anéis. A expressão “anel heterocíclico parcialmente saturado” indica um anel heterocíclico que contém pelo menos uma união dupla mas que não é aromática.

A linha pontilhada na Fórmula 1 e em outros anéis ilustrados no presente relatório descritivo (tais como J-44, J-45, J-48 e J-49 na Ilustração 3)

representam que a união indicada pode ser uma união simples ou uma união dupla. A menos que indicado em contrário, anéis heterocíclicos e sistemas de anéis são ligados ao restante da Fórmula 1 por meio de qualquer carbono ou nitrogênio disponível por substituição de um hidrogênio sobre o mencionado carbono ou nitrogênio e todos os substituintes sobre os anéis heterocíclicos e sistemas de anéis são ligados por meio de qualquer carbono ou nitrogênio disponível por substituição de um hidrogênio sobre o mencionado carbono ou nitrogênio.

Conforme já descrito, J é um anel com cinco, seis ou sete membros, um sistema de anéis bicíclicos com oito a onze membros ou um sistema de anéis espirocíclicos com sete a onze membros, em que cada anel ou sistema de anéis contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e, opcionalmente, um a quatro heteroátomos selecionados a partir de até 2 O, até 2 S e até 4 N e que inclui opcionalmente um a três membros de

anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂ e SiR¹⁷R¹⁸, em que cada anel ou sistema de anéis é opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁵. Como os heteroátomos são opcionais, zero a quatro heteroátomos podem estar presentes. No presente relatório descritivo, os heteroátomos selecionados a partir de até 2 S são átomos e não as porções S(O) ou S(O)₂. Os heteroátomos selecionados a partir de até 4 N podem ser oxidados na forma de *N*-óxidos, pois a presente invenção também se refere a derivados de *N*-óxido dos compostos da Fórmula 1. Os um a três membros de anéis opcionais selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂ e SiR¹⁷R¹⁸ são, portanto, adicionais aos um a quatro heteroátomos opcionais selecionados a partir de até 2 O, até 2 S e até 4 N. Merece observação o fato de que, quando a quantidade total de átomos de enxofre não oxidados (ou seja, S) e porções de enxofre oxidado (ou seja, S(O) e S(O)₂) não exceder 2, de forma que no máximo dois membros de anéis sejam selecionados a partir de S, S(O) e S(O)₂ estão presentes no anel ou sistema de anéis. Quando nenhum dos heteroátomos opcionais e nenhum dos membros de anéis opcionais selecionados a partir de S(O), S(O)₂ e SiR¹⁷R¹⁸ estiver presente, o anel ou sistema de anéis é carbocíclico. Os substituintes R⁵ podem ser ligados a membros de anéis de átomos de carbono e a membros de anéis de átomos de nitrogênio que possuem um ponto de ligação disponível. Os membros de anéis com base em carbono C(=O) e C(=S) não possuem pontos de ligação disponíveis. Além disso, em sistemas de anéis SiR¹⁷R¹⁸, os substituintes R¹⁷ e R¹⁸ são definidos separadamente de outra forma e esses membros de anéis não podem ser adicionalmente substituídos com R⁵. Como os substituintes R⁵ são opcionais, zero a cinco substituintes podem estar presentes, limitados pelo número de pontos de ligação disponíveis.

De forma similar, R⁵ e R⁷ podem ser tomados em conjunto com os

átomos que ligam R^5 a R^7 para formar um anel com cinco a sete membros
opcionalmente substituído que contém membros de anéis selecionados a partir
de carbono e opcionalmente de um a três heteroátomos selecionados a partir
de até 1 O, até 1 S e até 1 N e que incluem opcionalmente de um a três
5 membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de $C(=O)$,
 $C(=S)$, $S(O)$, $S(O)_2$ e $SiR^{17}R^{18}$. Como os heteroátomos são opcionais, zero a
três heteroátomos podem estar presentes. No presente relatório descritivo, o
heteroátomo selecionado a partir de até 1 S é um átomo e não as porções $S(O)$
ou $S(O)_2$. O heteroátomo selecionado a partir de até 1 N pode ser oxidado
10 como um *N*-óxido, pois a presente invenção também se refere a derivados de
N-óxido dos compostos da Fórmula 1. Os um a três membros de anéis
opcionais selecionados a partir do grupo que consiste de $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$,
 $S(O)_2$ e $SiR^{17}R^{18}$ são, portanto, adicionais aos um a três heteroátomos
opcionais selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N. Merece
15 observação que, quando a quantidade total de átomos de enxofre não oxidados
(ou seja, S) e porções de enxofre oxidadas (ou seja, $S(O)$ e $S(O)_2$) não exceder
1, no máximo um membro de anel selecionado a partir de S, $S(O)$ e $S(O)_2$ está
presente no anel. Quando nenhum dos heteroátomos opcionais e nenhum dos
membros de anéis opcionais selecionado a partir de $S(O)$, $S(O)_2$ e $SiR^{17}R^{18}$
20 estiver presente, o anel é carbocíclico. O anel com cinco a sete membros é
opcionalmente substituído. Os substituintes sobre os átomos que ligam R^5 e R^7
são descritos na definição dos componentes que ligam R^5 e R^7 . Quando o
componente de ligação Z^2 for CHR^{20} , por exemplo, o substituinte R^{20} é definido
como sendo H, alquila C_1-C_4 ou haloalquila C_1-C_4 . Com referência a
25 substituintes opcionais ligados à parte do anel que consiste de R^5 e R^7 tomados
em conjunto, um substituinte opcional é um substituinte não de hidrogênio que
não elimina a atividade fungicida. Substituintes opcionais podem ser ligados a
membros de anéis de átomos de carbono e a membros de anéis de átomos de

nitrogênio que possuem um ponto de ligação disponível. Os membros de anéis com base em carbono $C(=O)$ e $C(=S)$ não possuem pontos de ligação disponíveis. Além disso, em membros de anéis $SiR^{17}R^{18}$, os substituintes R^{17} e R^{18} , de outra forma, são definidos separadamente e esses membros de anéis não podem ser adicionalmente substituídos.

O termo “halogênio”, isoladamente ou em palavras compostas tais como “haloalquila”, inclui flúor, cloro, bromo ou iodo. Além disso, quando utilizado em palavras compostas tais como “haloalquila”, o mencionado alquila pode ser total ou parcialmente substituído com átomos de halogênio que podem ser idênticos ou diferentes. Exemplos de “haloalquila” incluem F_3C , $ClCH_2$, CF_3CH_2 e CF_3CCl_2 . Os termos “haloalquenila”, “haloalquinila”, “halocicloalquila”, “haloalcóxi”, “haloalquiltio” e similares são definidos de forma análoga ao termo “haloalquila”. Exemplos de “haloalquenila” incluem $(Cl)_2C=CHCH_2$ e $CF_3CH_2CH=CHCH_2$. Exemplos de “haloalquinila” incluem $HC\equiv CCHCl$, $CF_3C\equiv C$, $CCl_3C\equiv C$ e $FCH_2C\equiv CCH_2$. Exemplos de “haloalcóxi” incluem CF_3O , CCl_3CH_2O , $HCF_2CH_2CH_2O$ e CF_3CH_2O . Exemplos de “haloalquiltio” incluem CCl_3S , CF_3S , CCl_3CH_2S e $ClCH_2CH_2CH_2S$. Exemplos de “haloalquilsulfonila” incluem $CF_3S(O)$, $CCl_3S(O)$, $CF_3CH_2S(O)$ e $CF_3CF_2S(O)$. Exemplos de “haloalquilsulfonila” incluem $CF_3S(O)_2$, $CCl_3S(O)_2$, $CF_3CH_2S(O)_2$ e $CF_3CF_2S(O)_2$.

O número total de átomos de carbono em grupo substituinte é indicado pelo sufixo “ C_i-C_j ” em que i e j são números de 1 a 10. Alquilsulfonila C_1-C_4 designa, por exemplo, metilsulfonila até butilsulfonila; alcóxialquila C_2 designa CH_3OCH_2 ; alcóxialquila C_3 designa, por exemplo, $CH_3CH(OCH_3)$, $CH_3OCH_2CH_2$ ou $CH_3CH_2OCH_2$; e alcóxialquila C_4 designa os vários isômeros de um grupo alquila substituído com um grupo alcóxi que contém um total de quatro átomos de carbono, em que exemplos incluem $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ e $CH_3CH_2OCH_2CH_2$.

Quando um composto for substituído com um substituinte que contém um subscrito que indica que a quantidade dos mencionados substituintes pode variar, quando a quantidade dos mencionados substituintes for maior que 1, os mencionados substituintes são selecionados independentemente a partir do grupo de substituintes definidos. Além disso, quando for indicada uma faixa (tal como i-j substituintes), o número de substituintes pode ser selecionado a partir dos números inteiros de i a j, inclusive. Quando um grupo (tal como J) contiver um substituinte (tal como R^5) que pode ser hidrogênio, quando esse substituinte for tomado como hidrogênio, reconhece-se que ele é equivalente ao mencionado grupo não substituído. Quando se exibir um grupo variável como opcionalmente ligado a uma posição, tal como $(R^2)_n$ em que n pode ser 0 ou, como exemplo adicional, $(R^4)_k$ em que k pode ser 0 na Ilustração 1, hidrogênio pode estar na posição mesmo se não for indicado na definição do grupo variável (tal como R^2 e R^4). Quando se afirmar que uma posição sobre um grupo é “não substituída”, os átomos de hidrogênio são ligados para absorver qualquer valência livre. A expressão “opcionalmente substituído”, com relação a grupos relacionados para R^1 , R^2 , R^5 , R^7 , G, J e Q, designa grupos que não são substituídos ou que contêm pelo menos um substituinte não de hidrogênio. A menos que indicado em contrário, esses grupos podem ser substituídos com tantos substituintes opcionais quantos possam ser acomodados por meio da substituição de um átomo de hidrogênio com um substituinte não de hidrogênio sobre qualquer átomo de nitrogênio ou carbono disponível. Comumente, o número de substituintes opcionais (quando presentes) varia de 1 a 3. Quando uma faixa especificada para o número de substituintes (tal como em que x é um número inteiro de 0 a 5 na Ilustração 3) exceder a quantidade de posições disponíveis para substituintes sobre um anel (tal como duas posições disponíveis para $(R^5)_x$ sobre J-1 na Ilustração 3), a extremidade superior real da faixa é reconhecida como sendo o número de

posições disponíveis. A expressão “opcionalmente substituído” indica que a quantidade de substituintes pode ser zero. A expressão “opcionalmente substituído com até dois substituintes selecionados a partir de R^3 sobre membros de anéis de carbono e selecionados a partir de R^{11} sobre membros de anéis de nitrogênio”, por exemplo, indica que podem estar presentes zero, um ou dois substituintes (caso o número de pontos de conexão potencial o permita) e, desta forma, o número de substituintes R^3 e R^{11} pode ser zero. De forma similar, a expressão “opcionalmente substituído com um a cinco substituintes” indica que 0, 1, 2, 3, 4 ou 5 substituintes podem estar presentes caso a quantidade de pontos de conexão disponíveis o permita. A expressão “não substituído”, com relação a um grupo tal como um anel ou sistema de anéis, indica que o grupo não contém nenhum substituinte além das suas uma ou mais ligações ao restante da Fórmula 1. A expressão “fenila meta-substituído” indica um anel fenila substituído com um substituinte não de hidrogênio em uma posição meta com relação à ligação do anel fenila ao restante da Fórmula 1.

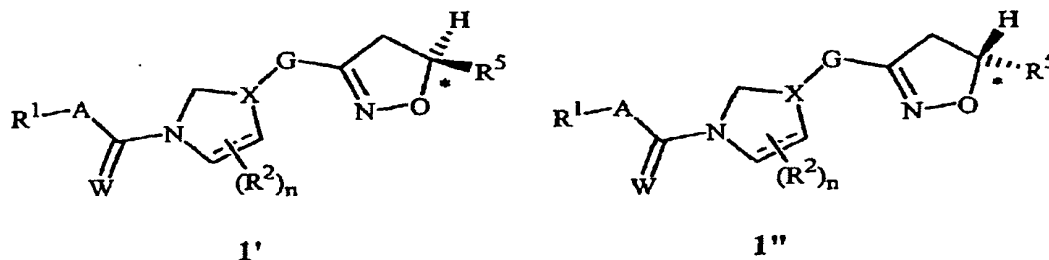
Conforme indicado acima, R^1 é um fenila opcionalmente substituído, naftalenila ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros; G é um anel heteroaromático com cinco membros opcionalmente substituído ou um anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado com cinco membros; e R^5 e R^7 podem ser tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído que contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e opcionalmente um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N e que inclui opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$, $S(O)_2$ e $SiR^{17}R^{18}$. O termo “substituído”, com relação às definições de R^1 , G, R^5 e R^7 , designa grupos que possuem pelo menos um substituinte não de hidrogênio

que não elimina a atividade fungicida. Como esses grupos são opcionalmente substituídos, eles não necessitam conter nenhum substituinte não de hidrogênio. Como esses grupos são “opcionalmente substituídos” sem o número de substituintes indicados, estes grupos podem ser substituídos com
5 tantos substituintes opcionais quantos podem ser acomodados por meio de substituição de um átomo de hidrogênio com um substituinte não de hidrogênio sobre qualquer átomo de carbono ou nitrogênio disponível.

A nomenclatura de substituintes no presente relatório descritivo utiliza terminologia reconhecida que fornece concisão na condução precisa da
10 estrutura química para os técnicos no assunto. Para fins de concisão, descrições de locais podem ser omitidas; “pirazol-1-ila” indica “1*H*-pirazol-1-ila” de acordo com o sistema de nomenclatura *Chemical Abstracts*. O termo “piridila” é sinônimo de “piridinila”. A ordem de relação dos substituintes pode ser diferente do sistema *Chemical Abstracts* caso a diferença não afete o
15 significado.

Os compostos de acordo com a presente invenção podem existir na forma de um ou mais estereoisômeros. Os vários estereoisômeros incluem enantiômeros, diaestereômeros, atropisômeros e isômeros geométricos. Os técnicos no assunto apreciarão que um estereoisômero pode ser mais ativo
20 e/ou pode exibir efeitos benéficos quando enriquecido com relação ao(s) outro(s) estereoisômero(s) ou quando separado do(s) outro(s) estereoisômero(s). Além disso, os técnicos no assunto sabem como separar, enriquecer e/ou preparar seletivamente os mencionados estereoisômeros. Os compostos de acordo com a presente invenção podem estar presentes na
25 forma de uma mistura de estereoisômeros, estereoisômeros individuais ou como forma opticamente ativa. Quando J for J-29 (vide Ilustração 3) unido na posição 3 ao restante da Fórmula 1 e J-29 contiver um substituinte R⁵ diferente de H na posição 5, por exemplo, a Fórmula 1 possui um centro quiral no átomo

de carbono ao qual R^5 está ligado. Os dois enantiômeros são ilustrados como Fórmula 1' e Fórmula 1'' com o centro quiral identificado com um asterisco (*).



A presente invenção compreende misturas racêmicas, tais como de quantidades iguais dos enantiômeros das Fórmulas 1' e 1''. Além disso, a presente invenção inclui compostos que são enriquecidos em comparação com a mistura racêmica em um enantiômero da Fórmula 1. Também são incluídos os enantiômeros essencialmente puros de compostos da Fórmula 1, tais como Fórmula 1' e Fórmula 1''.

Quando enantiomericamente enriquecido, um enantiômero está presente em quantidades maiores que o outro e a extensão do enriquecimento pode ser definida por uma expressão de excesso enantiomérico ("ee"), que é definido como $(2x-1) \cdot 100\%$, em que x é a fração molar do enantiômero dominante na mistura (ee de 20%, por exemplo, corresponde a uma razão 60:40 de enantiômeros).

Preferencialmente, as composições de acordo com a presente invenção possuem excesso enantiomérico de pelo menos 50%; de maior preferência, excesso enantiomérico de pelo menos 75%; de preferência ainda maior, excesso enantiomérico de pelo menos 90% e, de preferência superior, excesso enantiomérico de pelo menos 94% do isômero mais ativo. Merecem observação específicas realizações enantiomericamente puras do isômero mais ativo.

Os compostos da Fórmula 1 podem compreender centros quirais adicionais. Substituintes e outros componentes moleculares tais como R^4 , R^5 ,

R⁷, G, J, Q e X¹ até X⁹, por exemplo, podem conter centros quirais. A presente invenção compreende misturas racêmicas, bem como estereoconfigurações enriquecidas e essencialmente puras nesses centros quirais adicionais.

Os compostos de acordo com a presente invenção podem existir na forma de um ou mais isômeros de conformação devido à rotação restrita em volta da união de amida (tal como C(W)-N) na Fórmula 1. A presente invenção compreende misturas de isômeros de conformação. Além disso, a presente invenção inclui compostos que são enriquecidos em um conformador com relação aos demais.

Alguns dos anéis e sistemas de anéis insaturados exibidos nas Ilustrações 1, 2, 3 e 4 podem possuir uma disposição de uniões simples e duplas entre membros de anéis diferentes da ilustrada. Essas disposições diferentes de uniões para uma disposição específica de átomos de anéis correspondem a tautômeros diferentes. Para esses anéis e sistemas de anéis insaturados, o tautômero específico ilustrado deve ser considerado representativo de todos os tautômeros possíveis para a disposição de átomos de anéis exibida. As tabelas que relacionam compostos específicos que incorporam o anel e sistemas de anéis exibidos nas Ilustrações podem envolver um tautômero diferente do tautômero exibido nas Ilustrações.

Os compostos de acordo com a presente invenção incluem derivados de *N*-óxidos. Os técnicos no assunto apreciarão que nem todos os heterociclos que contêm nitrogênio podem formar *N*-óxidos, pois o nitrogênio necessita de um par de elétrons isolado disponível para oxidação no óxido; os técnicos no assunto reconhecerão os heterociclos que contêm nitrogênio que podem formar *N*-óxidos. Os técnicos no assunto também reconhecerão que aminas terciárias podem formar *N*-óxidos. Métodos sintéticos de preparação de *N*-óxidos de heterociclos e aminas terciárias são muito bem conhecidos dos técnicos no assunto, incluindo a oxidação de heterociclos e aminas terciárias

com ácidos peróxi tais como ácido peracético e *m*-cloroperbenzóico (MCPBA), peróxido de hidrogênio, hidroperóxidos de alquila tais como hidroperóxido de *tert*-butila, perborato de sódio e dioxiranos tais como dimetildioxirano. Estes métodos de preparação de *N*-óxidos foram extensamente descritos e analisados na literatura; vide, por exemplo: T. L. Gilchrist em *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, págs. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler e B. Stanovnik em *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, págs. 18-20, A. J. Boulton e A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett e B. R. T. Keene em *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, págs. 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler e B. Stanovnik em *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, págs. 285-291, A. R. Katritzky e A. J. Boulton, Eds., Academic Press; e G. W. H. Cheeseman e E. S. G. Werstiuk em *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, págs. 390-392, A. R. Katritzky e A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Os compostos da Fórmula 1 do presente podem apresentar-se na forma de sais apropriados para uso agrícola. Os técnicos no assunto reconhecem que, como no ambiente e sob condições fisiológicas os sais de compostos químicos encontram-se em equilíbrio com suas formas não de sais correspondentes, os sais compartilham a utilidade biológica das formas não de sais. Desta forma, uma ampla variedade de sais dos compostos da Fórmula 1 é útil para o controle de doenças de plantas causadas por patógenos vegetais fúngicos (ou seja, são apropriados para uso agrícola). Os sais dos compostos da Fórmula 1 incluem sais de adição de ácidos com ácidos orgânicos ou inorgânicos tais como ácidos bromídrico, clorídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malônico, oxálico, propiônico, salicílico, tartárico, 4-toluenossulfônico ou valérico. Quando um composto da Fórmula 1 contém uma porção ácida tal como ácido carboxílico ou fenol, os sais também incluem os formados com bases orgânicas ou inorgânicas tais

como piridina, trietilamina ou amônia, ou amidas, hidretos, hidróxidos ou carbonatos de sódio, potássio, lítio, cálcio, magnésio ou bário. Conseqüentemente, a presente invenção compreende compostos selecionados a partir das Fórmulas 1, 1A, 1B e 1C, seus *N*-óxidos e sais.

5 As realizações da presente invenção incluem:

Realização 1. Composto da Fórmula 1 em que A é CHR^{15} .

Realização 1a. Composto de acordo com a Realização 1 em que R^{15} é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquila $\text{C}_1\text{-C}_4$ ou alcóxicarbonila $\text{C}_2\text{-C}_5$.

10 Realização 1b. Composto de acordo com a Realização 1a em que R^{15} é H, ciano, hidróxi, metila ou metóxicarbonila.

Realização 1c. Composto de acordo com a Realização 1b em que R^{15} é H.

Realização 2. Composto da Fórmula 1 em que A é NR^{16} .

15 Realização 2a. Composto de acordo com a Realização 2 em que R^{16} é H, alquila $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquila $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquilcarbonila $\text{C}_2\text{-C}_4$, haloalquilcarbonila $\text{C}_2\text{-C}_4$ ou alcóxicarbonila $\text{C}_2\text{-C}_4$.

Realização 2b. Composto de acordo com a Realização 2a em que R^{16} é H, metila, metilcarbonila ou metóxicarbonila.

20 Realização 2c. Composto de acordo com a Realização 2b, em que R^{16} é H.

Realização 3. Composto da Fórmula 1 em que W é O.

Realização 4. Composto da Fórmula 1 em que W é S.

25 Realização 5. Composto da Fórmula 1 em que cada R^2 é independentemente alquila $\text{C}_1\text{-C}_2$, haloalquila $\text{C}_1\text{-C}_2$, alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_2$, halogênio, ciano ou hidróxi.

Realização 5a. Composto de acordo com a Realização 5 em que cada R^2 é independentemente metila, metóxi, ciano ou hidróxi.

Realização 5b. Composto de acordo com a Realização 5a em que cada R^2 é metila.

Realização 6. Composto da Fórmula 1 em que n é 0 ou 1.

Realização 7. Composto de acordo com a Realização 6 em que n é 0.

Realização 7a. Composto de acordo com a Realização 6 em que n é 1.

Realização 8. Composto da Fórmula 1 em que X é X^1 , X^2 ou X^3 .

Realização 9. Composto de acordo com a Realização 8 em que X é X^1 ou X^2 .

Realização 10. Composto de acordo com a Realização 9 em que X é X^1 .

Realização 11. Composto da Fórmula 1 em que o anel que compreende X é saturado (ou seja, contém apenas uniões simples).

Realização 12. Composto da Fórmula 1 em que R^1 é um anel fenila ou heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituído com substituintes que não se ligam para tornar R^1 um sistema de anéis fundidos.

Realização 12a. Composto de acordo com a Realização 12, em que:

- R^1 é fenila ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituídos com um a três substituintes selecionados independentemente a partir de R^{4a} sobre membros de anéis de carbono e R^{4b} sobre membros de anéis de nitrogênio;

- cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano,

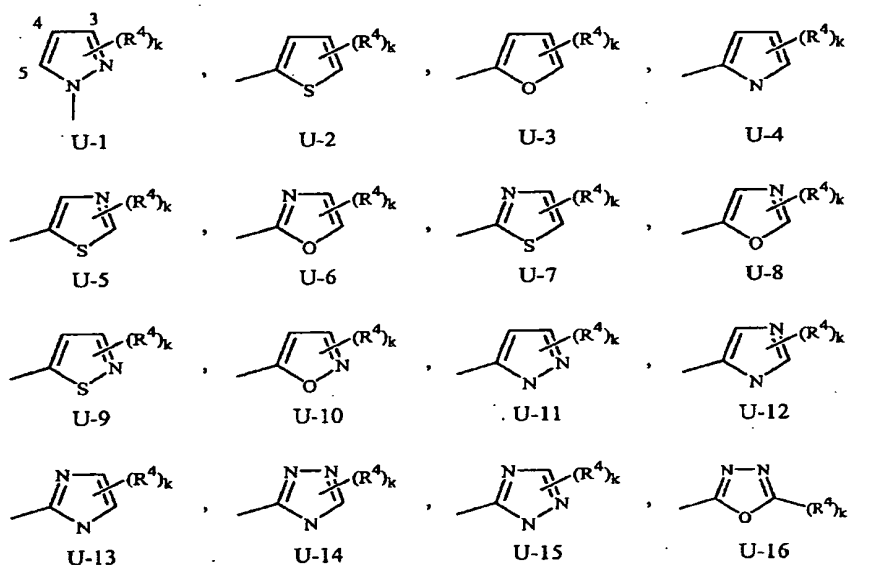
nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄,
 alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄,
 haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈,
 cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila
 5 C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆,
 alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;
 e

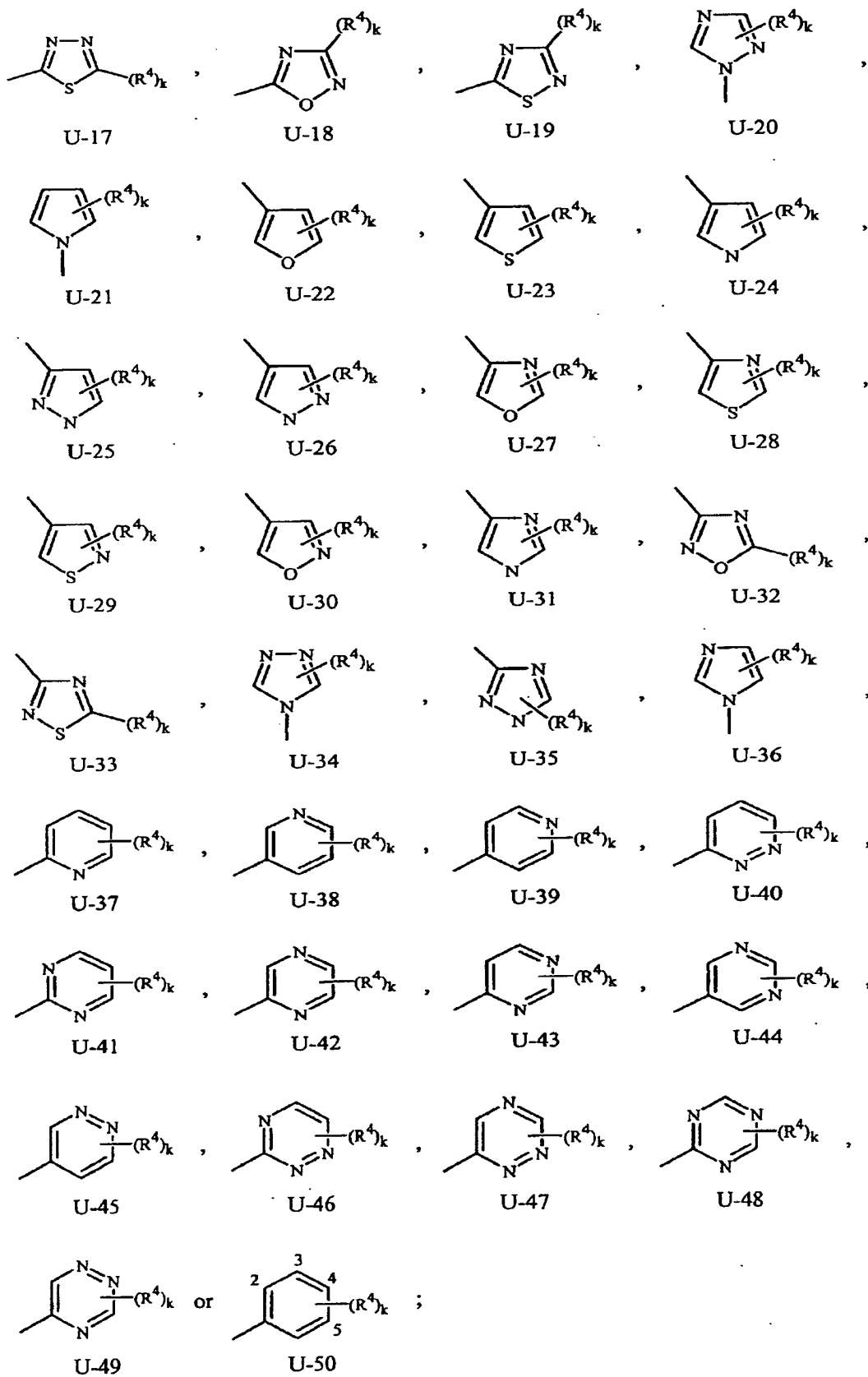
- cada R^{4b} é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₃-
 C₆, alquinila C₃-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₃-C₆,
 10 haloalquinila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆ ou alcoxialquila C₂-C₄.

Realização 12b. Composto de acordo com a Realização 12a em
 que R¹ é fenila ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros
 opcionalmente substituído com um ou dois substituintes selecionados
 independentemente a partir de R^{4a} sobre membros de anéis de carbono e R^{4b}
 15 sobre membros de anéis de nitrogênio.

Realização 13. Composto de acordo com a Realização 12b, em
 que R¹ é um dentre U-1 a U-50 exibidos na Ilustração 1;

ILUSTRAÇÃO 1





em que:

- quando R^4 for ligado a um membro de anel de carbono, o mencionado R^4 é selecionado a partir de R^{4a} e, quando R^4 for ligado a um membro de anel de nitrogênio (tal como em U-4, U-11 a U-15, U-24 a U-26, U-31 ou U-35), o mencionado R^4 é selecionado a partir de R^{4b} ; e
- k é 0, 1 ou 2.

Realização 14. Composto de acordo com a Realização 13, em que R^1 é selecionado a partir de U-1 a U-5, U-8, U-11, U-13, U-15, U-20 a U-28, U-31, U-36 a U-39 e U-50.

10 Realização 15. Composto de acordo com a Realização 14, em que R^1 é selecionado a partir de U-1 a U-3, U-5, U-8, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, U-25 a U-28, U-36 a U-39 e U-50.

Realização 16. Composto de acordo com a Realização 15, em que R^1 é selecionado a partir de U-1 a U-3, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, 15 U-36 a U-39 e U-50.

Realização 17. Composto de acordo com a Realização 16, em que R^1 é U-1 ou U-50.

Realização 18. Composto de acordo com a Realização 17, em que R^1 é U-1.

20 Realização 19. Composto de acordo com a Realização 17, em que R^1 é U-50.

Realização 20. Composto de acordo com qualquer das Realizações 12 e 13, em que cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , haloalquinila C_2-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, 25 nitro, alcóxi C_1-C_2 , haloalcóxi C_1-C_2 , alquiltio C_1-C_2 , haloalquiltio C_1-C_2 , alcoxialquila C_2-C_3 , alquilcarbonila C_2-C_3 , alcoxicarbonila C_2-C_3 , alquilaminocarbonila C_2-C_3 ou dialquilaminocarbonila C_3-C_4 .

Realização 21. Composto de acordo com a Realização 20, em que cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , haloalquinila C_2-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

Realização 22. Composto de acordo com a Realização 21, em que cada R^{4a} é independentemente halogênio, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

Realização 23. Composto de acordo com a Realização 21, em que cada R^{4a} é independentemente halogênio, alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 ou alcóxi C_1-C_2 .

Realização 24. Composto de acordo com a Realização 23, em que cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_2 , trifluorometila, Cl, Br, I ou metóxi.

Realização 25. Composto de acordo com a Realização 24, em que cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_2 , trifluorometila, Cl ou Br.

Realização 26. Composto de acordo com qualquer das Realizações 12 e 13, em que cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_3 (tal como alila), alquinila C_3 (tal como propargila), ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_3 , haloalquinila C_3 , halociclopropila ou alcoxialquila C_2-C_3 .

Realização 27. Composto de acordo com a Realização 26, em que cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_3 , alquinila C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_3 ou halociclopropila.

Realização 28. Composto de acordo com a Realização 27, em que cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 .

Realização 29. Composto de acordo com a Realização 28, em que cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_2 ou trifluorometila.

Realização 30. Composto de acordo com a Realização 29, em que cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_2 .

Realização 31. Composto de acordo com a Realização 13, em que k é 1 ou 2 e pelo menos um R^4 é Cl.

5 Realização 32. Composto de acordo com a Realização 13, em que k é 1 ou 2 e pelo menos um R^4 é Br.

Realização 33. Composto de acordo com a Realização 13, em que k é 1 ou 2 e pelo menos um R^4 é metila.

10 Realização 34. Composto de acordo com a Realização 13, em que k é 1 ou 2 e pelo menos um R^4 é etila.

Realização 35. Composto de acordo com a Realização 13, em que k é 1 ou 2 e pelo menos um R^4 é trifluorometila.

Realização 36. Composto de acordo com a Realização 13, em que k é 1 ou 2 e pelo menos um R^4 é metóxi.

15 Realização 37. Composto de acordo com a Realização 18, em que k é 1 e R^4 é conectado à posição 3 ou 5 de U-1.

Realização 38. Composto de acordo com a Realização 18, em que k é 2 e um R^4 é conectado à posição 3 e o outro R^4 é conectado à posição 5 de U-1.

20 Realização 39. Composto de acordo com a Realização 19, em que k é 1 e R^4 é conectado à posição 2 ou 3 de U-50.

Realização 40. Composto de acordo com a Realização 19, em que k é 2 e um R^4 é conectado à posição 2 e o outro R^4 é conectado à posição 5 de U-50.

25 Realização 41. Composto da Fórmula 1 em que:

- G é um anel heteroaromático com cinco membros ou um anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado com cinco membros, em que cada anel é opcionalmente substituído com até dois substituintes

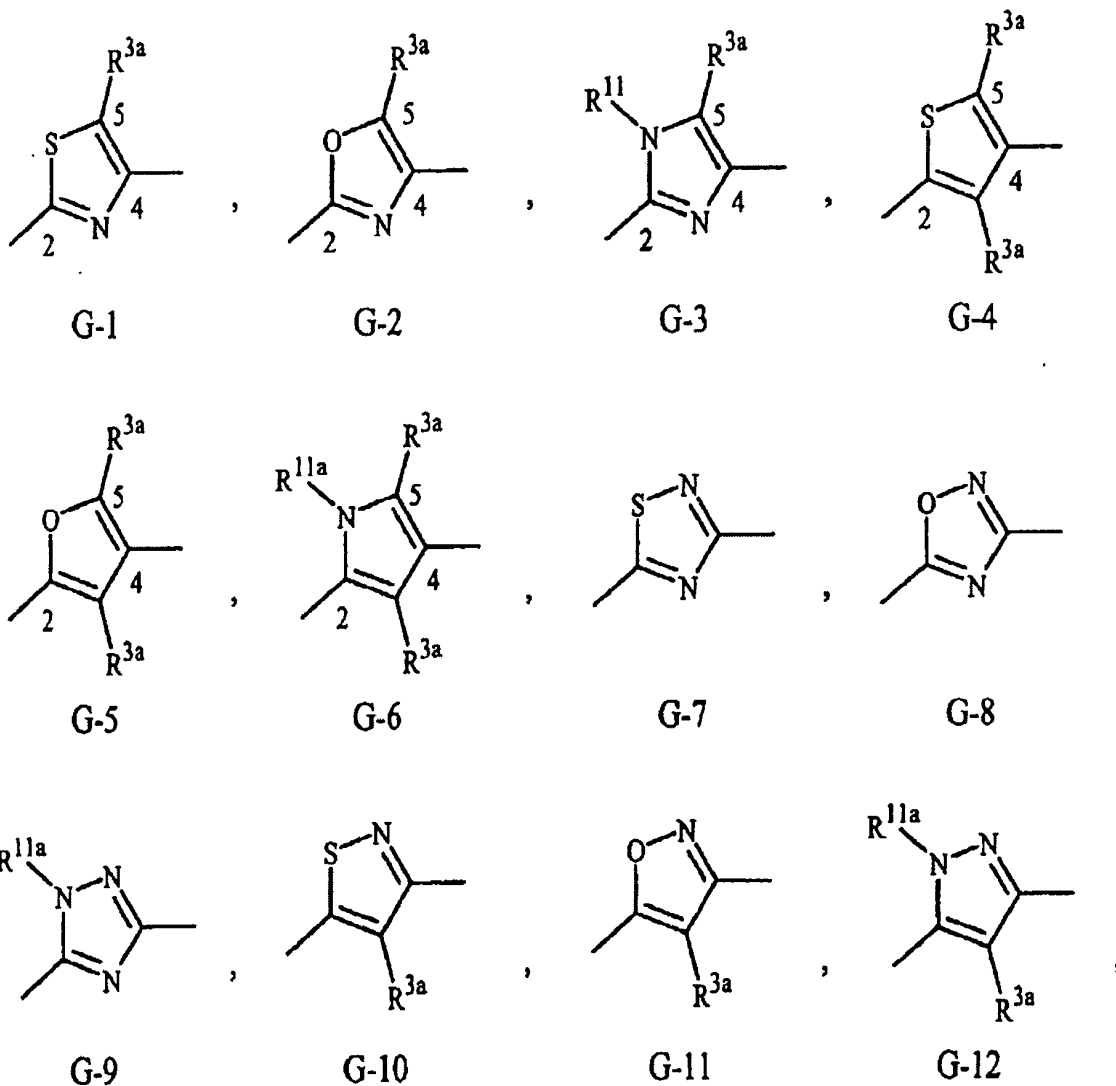
selecionados a partir de R^3 sobre membros de anéis de carbono e selecionados a partir de R^{11} sobre membros de anéis de nitrogênio;

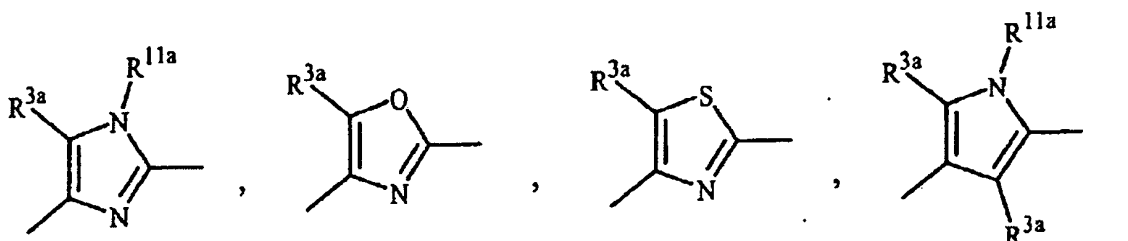
- cada R^3 é independentemente alquila C_1 - C_3 , haloalquila C_1 - C_3 ou halogênio; e

5 - cada R^{11} é independentemente alquila C_1 - C_3 .

Realização 42. Composto da Realização 41, em que G é um dentre G-1 a G-59 exibido na Ilustração 2:

ILUSTRAÇÃO 2



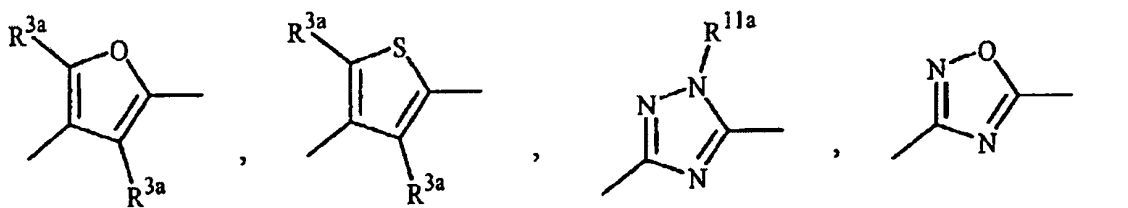


G-13

G-14

G-15

G-16

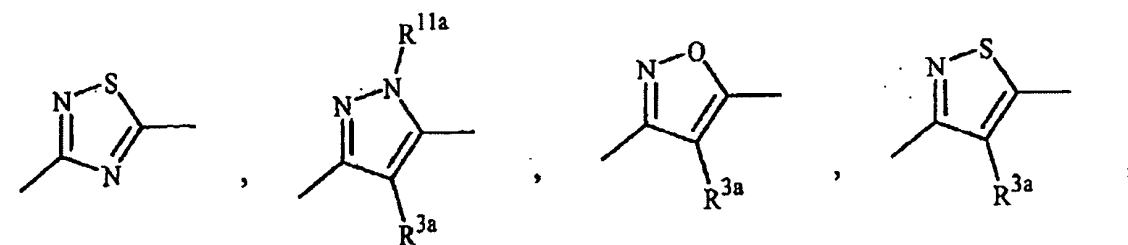


G-17

G-18

G-19

G-20

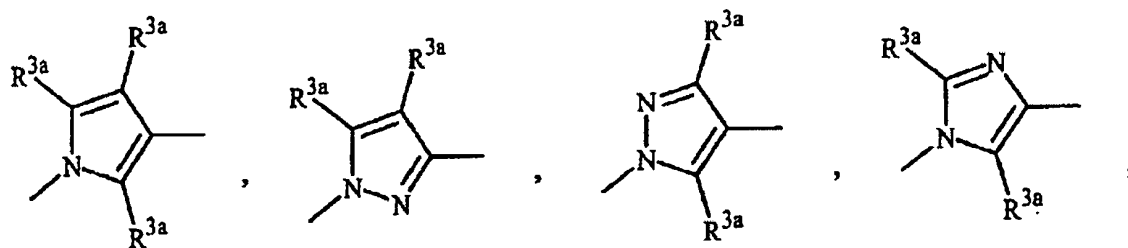


G-21

G-22

G-23

G-24

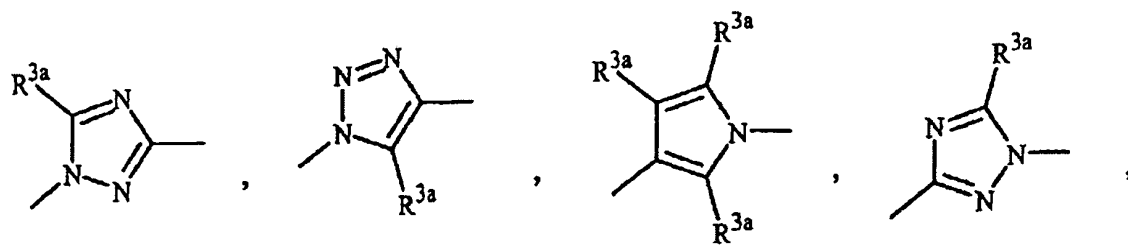


G-25

G-26

G-27

G-28

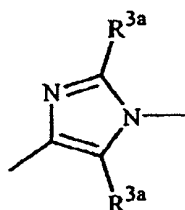


G-29

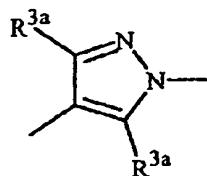
G-30

G-31

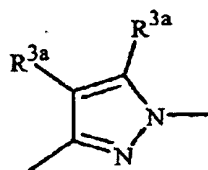
G-32



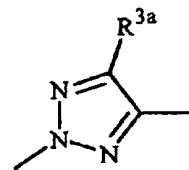
G-33



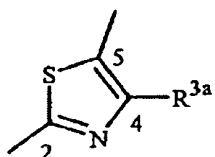
G-34



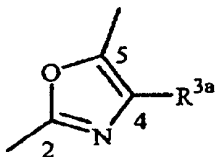
G-35



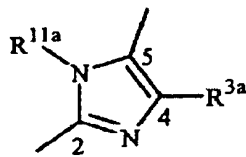
G-36



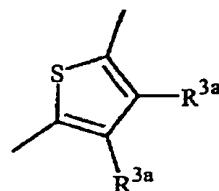
G-37



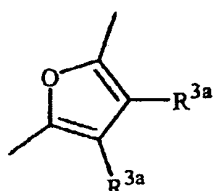
G-38



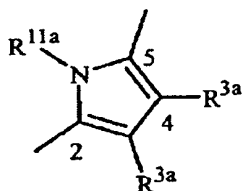
G-39



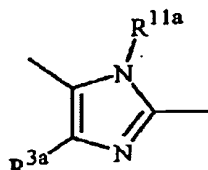
G-40



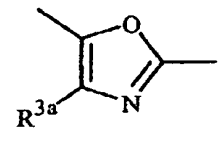
G-41



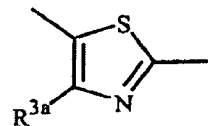
G-42



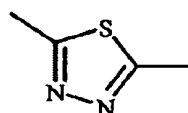
G-43



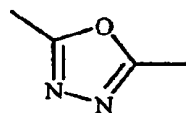
G-44



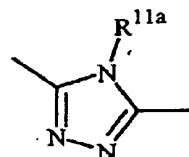
G-45



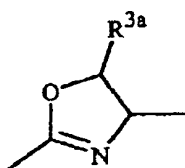
G-46



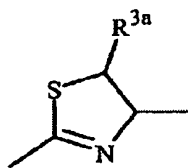
G-47



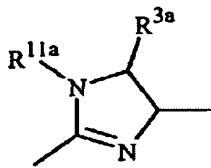
G-48



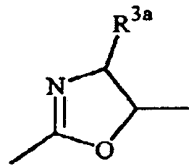
G-49



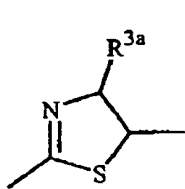
G-50



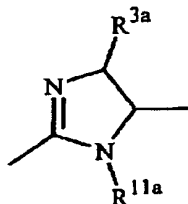
G-51



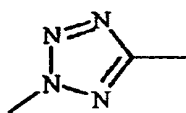
G-52



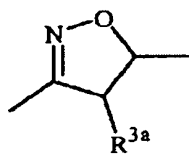
G-53



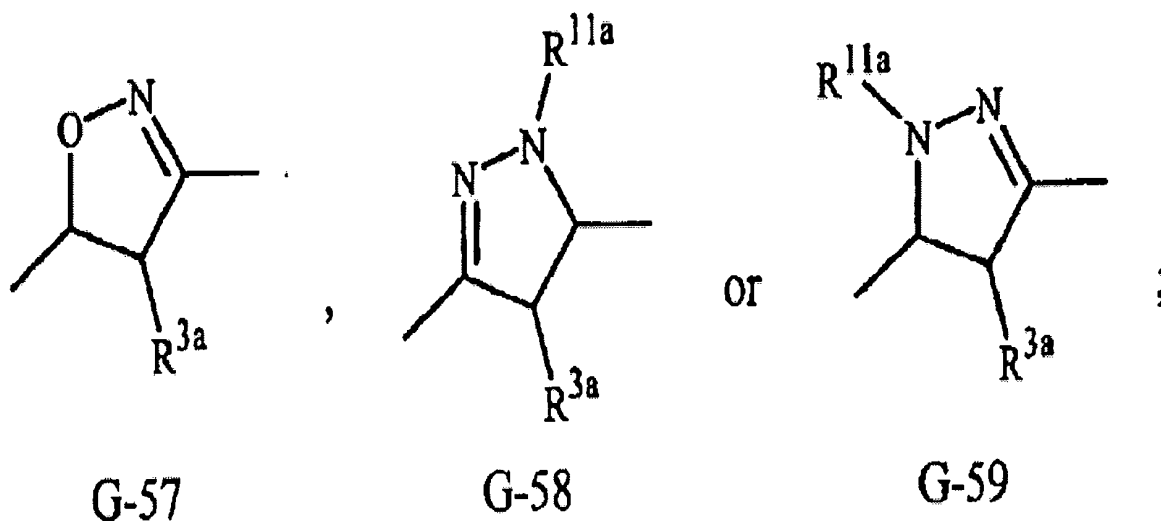
G-54



G-55



G-56



em que a união que se projeta à esquerda é unida a X e a união que se projeta à direita é unida a Z¹; cada R^{3a} é selecionado independentemente a partir de H ou R³; e R^{11a} é selecionado a partir de H e R¹¹;

desde que:

- quando G for G-6, G-16 ou G-42 e cada R^{3a} for diferente de H, R^{11a} é H;
- quando G for G-25 ou G-31, pelo menos um R^{3a} é H; e
- quando G for um dentre G-31 a G-35, Z¹ é uma união direta ou CHR²⁰.

Realização 43. Composto de acordo com a Realização 42, em que G é selecionado a partir de G-1 a G-3, G-7, G-8, G-10, G-11, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26 a G-28, G-30, G-36 a G-38 e G-49 a G-55.

Realização 44. Composto de acordo com a Realização 43, em que G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-36, G-37, G-38, G-49, G-50 e G-55.

Realização 45. Composto de acordo com a Realização 44, em que G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 e G-

38.

Realização 46. Composto de acordo com a Realização 45, em que G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26 e G-36.

Realização 47. Composto de acordo com a Realização 46, em que G é G-1. Merecem observação realizações destes compostos nas Realizações 1 a 40, Realizações 52 a 83 e Realizações A1 a A5.

Realização 48. Composto de acordo com a Realização 46, em que G é G-2. Merecem observação realizações destes compostos nas Realizações 1 a 40, Realizações 52 a 83 e Realizações A1 a A5.

Realização 49. Composto de acordo com a Realização 46, em que G é G-15. Merecem observação realizações destes compostos nas Realizações 1 a 40, Realizações 52 a 83 e Realizações A1 a A5.

Realização 50. Composto de acordo com a Realização 46, em que G é G-26. Merecem observação realizações destes compostos nas Realizações 1 a 40, Realizações 52 a 83 e Realizações A1 a A5.

Realização 51. Composto de acordo com a Realização 46, em que G é G-36. Merecem observação realizações destes compostos nas Realizações 1 a 40, Realizações 52 a 83 e Realizações A1 a A5.

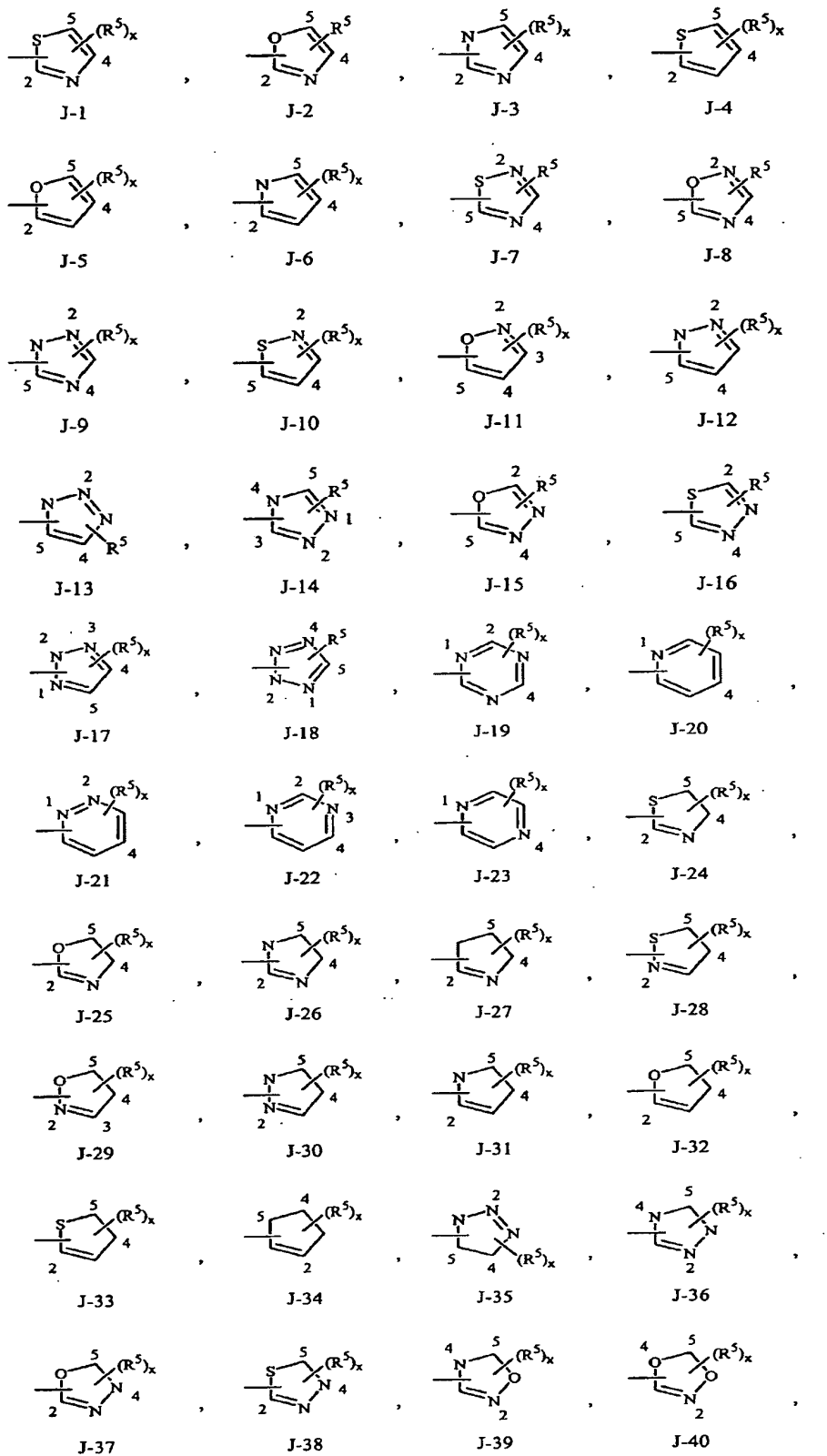
Realização 52. Composto de acordo com qualquer das Realizações 41 a 51, em que R^{3a} é H, alquila C_1-C_3 ou halogênio.

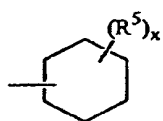
Realização 53. Composto de acordo com a Realização 52, em que R^{3a} é H ou metila.

Realização 54. Composto de acordo com qualquer das Realizações 41 a 51, em que R^{3a} é H e R^{11a} é H ou metila.

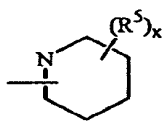
Realização 55. Composto de acordo com qualquer dentre a Fórmula 1 e Realizações 41 a 51, em que G é não substituído.

Realização 56. Composto da Fórmula 1, em que J é um dentre J-1 a J-82 exibido na Ilustração 3:

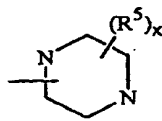
ILUSTRAÇÃO 3



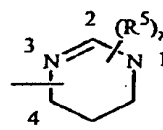
J-41



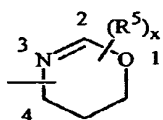
J-42



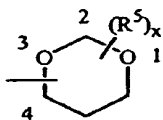
J-43



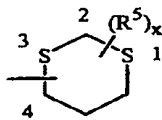
J-44



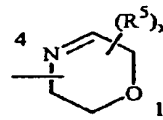
J-45



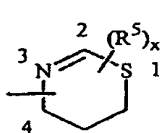
J-46



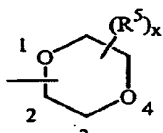
J-47



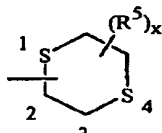
J-48



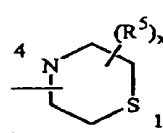
J-49



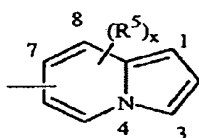
J-50



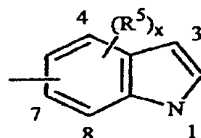
J-51



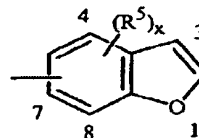
J-52



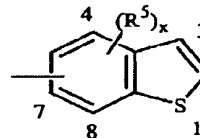
J-53



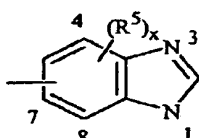
J-54



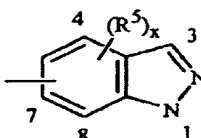
J-55



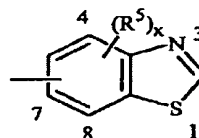
J-56



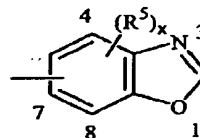
J-57



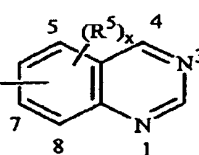
J-58



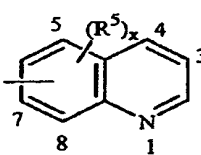
J-59



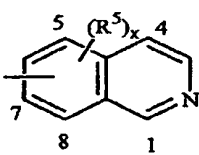
J-60



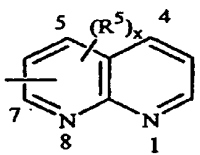
J-61



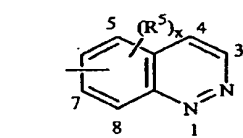
J-62



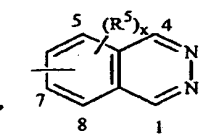
J-63



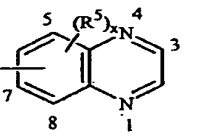
J-64



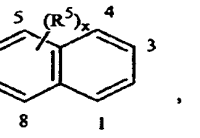
J-65



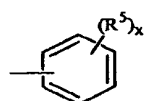
J-66



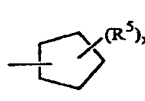
J-67



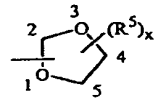
J-68



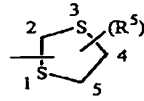
J-69



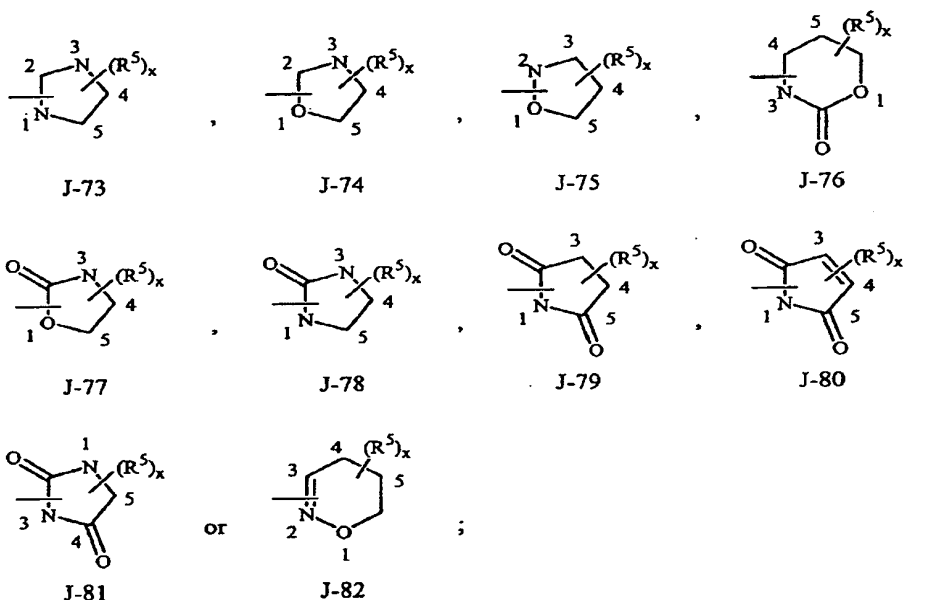
J-70



J-71



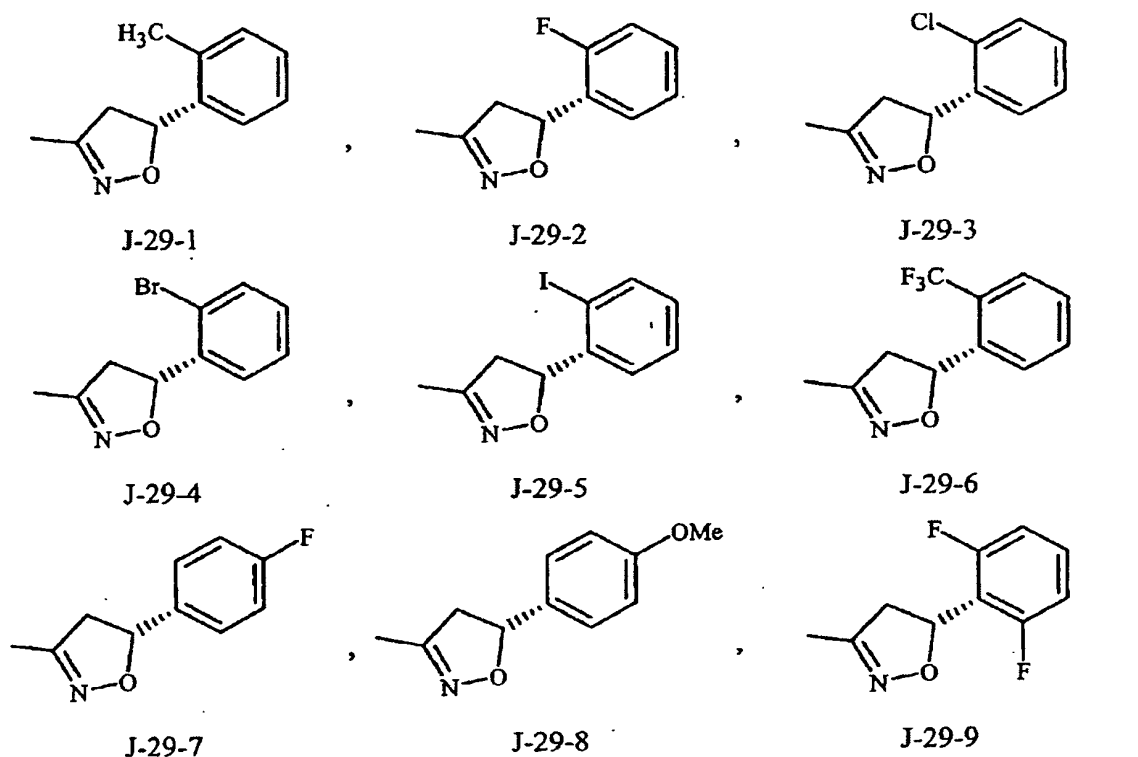
J-72

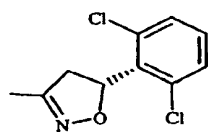


em que a união exibida projetando-se para a esquerda é unida a Z^1 ; e x é um número inteiro de 0 a 5.

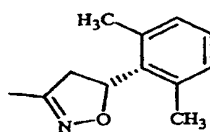
Realização 56a. Composto de acordo com a Realização 56, em que J é um dentre J-29-1 a J-29-58 exibidos na Ilustração A:

ILUSTRAÇÃO A

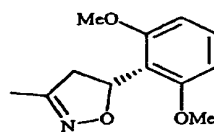




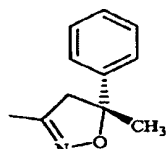
J-29-10



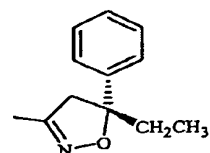
J-29-11



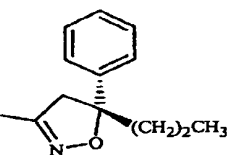
J-29-12



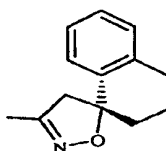
J-29-13



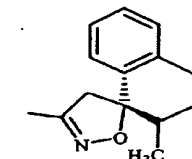
J-29-14



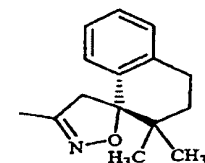
J-29-15



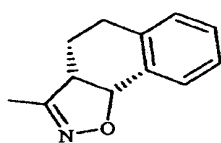
J-29-16



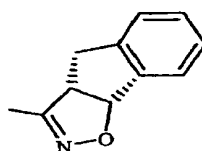
J-29-17



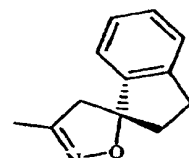
J-29-18



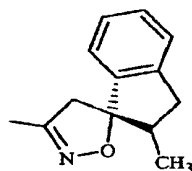
J-29-19



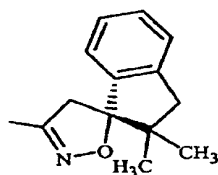
J-29-20



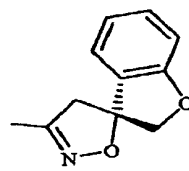
J-29-21



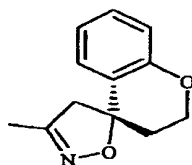
J-29-22



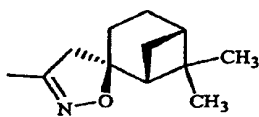
J-29-23



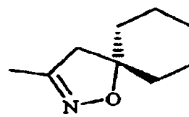
J-29-24



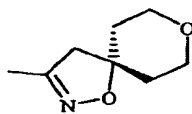
J-29-25



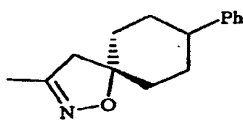
J-29-26



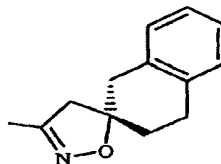
J-29-27



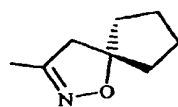
J-29-28



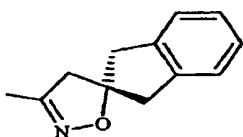
J-29-29



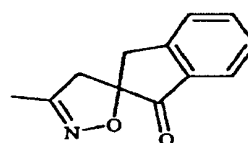
J-29-30



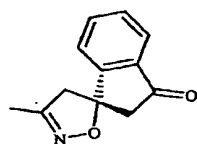
J-29-31



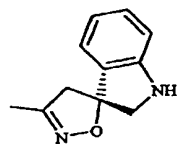
J-29-32



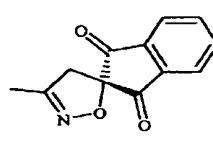
J-29-33



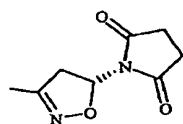
J-29-34



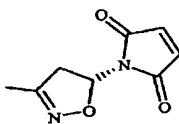
J-29-35



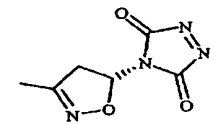
J-29-36



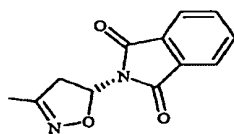
J-29-37



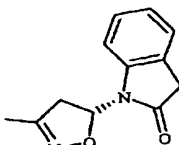
J-29-38



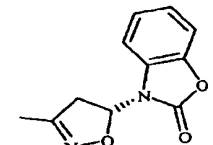
J-29-39



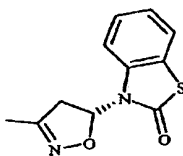
J-29-40



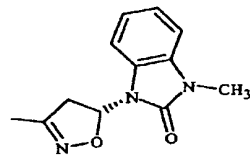
J-29-41



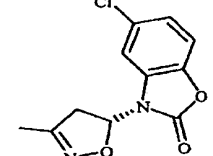
J-29-42



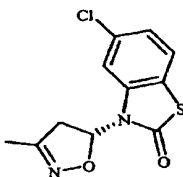
J-29-43



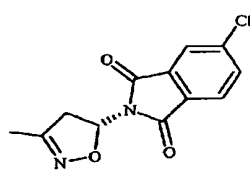
J-29-44



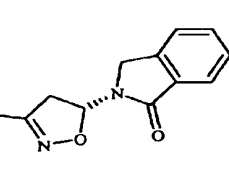
J-29-45



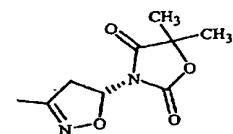
J-29-46



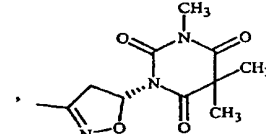
J-29-47



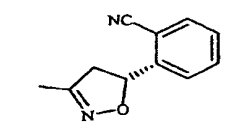
J-29-48



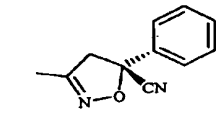
J-29-49



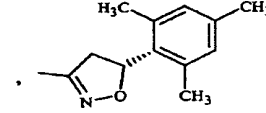
J-29-50



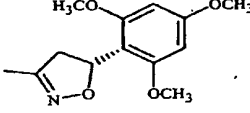
J-29-51



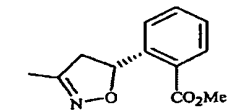
J-29-52



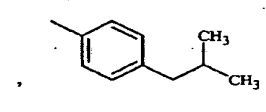
J-29-53



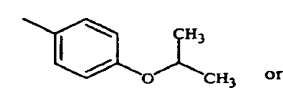
J-29-54



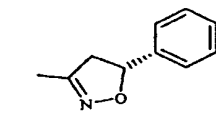
J-29-55



J-29-56



J-29-57



J-29-58

Realização 57. Composto de acordo com a Realização 56, em que J é selecionado a partir de J-1, J-2, J-3, J-4, J-5, J-7, J-8, J-9, J-10, J-11, J-12, J-14, J-15, J-16, J-20, J-24, J-25, J-26, J-29, J-30, J-37, J-38, J-45 e J-69.

Realização 58. Composto de acordo com a Realização 57, em que J é selecionado a partir de J-4, J-5, J-8, J-11, J-15, J-16, J-20, J-29, J-30, J-37, J-38 e J-69.

Realização 59. Composto de acordo com a Realização 58, em que J é selecionado a partir de J-4, J-5, J-11, J-20, J-29, J-37, J-38 e J-69.

Realização 60. Composto de acordo com a Realização 59, em que J é J-11.

Realização 61. Composto de acordo com a Realização 59, em que J é J-29.

Realização 61a. Composto de acordo com a Realização 61, em que J é qualquer dentre J-29-1 a J-29-58 (ilustrado com a Tabela 8).

Realização 62. Composto de acordo com a Realização 59, em que J é J-69.

Realização 63. Composto de acordo com a Realização 60, em que a posição 3 de J-11 é conectada a Z^1 e a posição 5 de J-11 é conectada a R^5 diferente de H.

Realização 63a. Composto de acordo com a Realização 63, em que a posição 3 de J-11 é conectada a Z^1 e a posição 5 de J-11 é conectada a Z^2Q .

Realização 64. Composto de acordo com a Realização 61, em que a posição 3 de J-29 é conectada a Z^1 e a posição 5 de J-29 é conectada a R^5 diferente de H.

Realização 64a. Composto de acordo com a Realização 65, em que a posição 3 de J-29 é conectada a Z^1 e a posição 5 de J-29 é conectada a Z^2Q .

Realização 65. Composto da Fórmula 1 ou Realização 56, em que cada R^5 é independentemente H, ciano, alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , halocicloalquila C_3-C_8 , alquilocicloalquila C_4-C_{10} , cicloalquilalquila C_4-C_{10} ,
 5 alcoxialquila C_2-C_6 , cicloalcoxialquila C_4-C_{10} , alcoxialcoxialquila C_3-C_8 , alquiltioalquila C_2-C_6 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , cicloalcóxi C_3-C_8 , halocicloalcóxi C_3-C_8 , cicloalquilalcóxi C_4-C_{10} , alquenilóxi C_2-C_6 , haloalquenilóxi C_2-C_6 , alquinilóxi C_2-C_6 , haloalquinilóxi C_2-C_6 , alcoxialcóxi C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , haloalquilcarbonilóxi C_2-C_6 , cicloalquilcarbonilóxi C_4-C_8 , alquilcarbonilalcóxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 ,
 10 cicloalquiltio C_3-C_8 , trialquilsilila C_3-C_{10} , $-NR^{25}R^{26}$ ou Z^2Q .

Realização 66. Composto de acordo com a Realização 65, em que cada R^5 é independentemente H, ciano, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , halocicloalquila C_3-C_8 , alcoxialquila C_2-C_6 , alcóxi C_1-C_6 ,
 15 haloalcóxi C_1-C_6 , cicloalcóxi C_3-C_8 , alquenilóxi C_2-C_6 , haloalquenilóxi C_2-C_6 , alquinilóxi C_2-C_6 , alcoxialcóxi C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , haloalquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , trialquilsilila C_3-C_{10} , $-NR^{25}R^{26}$ ou Z^2Q .

Realização 67. Composto de acordo com a Realização 66, em que cada R^5 é independentemente H, ciano, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , $-NR^{25}R^{26}$ ou Z^2Q .
 20

Realização 68. Composto da Fórmula 1 ou de acordo com a Realização 56, em que, em um caso, R^5 é Z^2Q e, em outros casos, R^5 é selecionado independentemente a partir de H, ciano, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_1-C_4 e halogênio.
 25

Realização 69. Composto de acordo com a Realização 68, em que, nos outros casos, R^5 é selecionado independentemente a partir de H e alquila C_1-C_3 .

Realização 70. Composto de acordo com a Realização 56, em que x é 1 ou 2.

Realização 71. Composto de acordo com a Realização 70, em que x é 1.

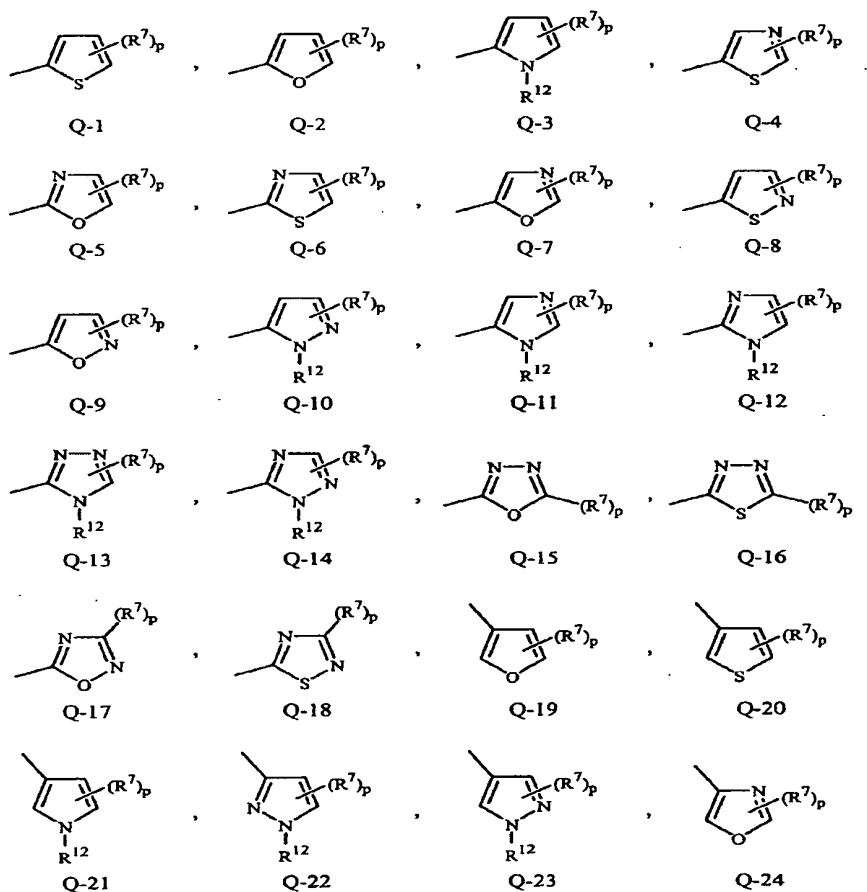
5 Realização 72. Composto de acordo com a Realização 71, em que R^5 é Z^2Q .

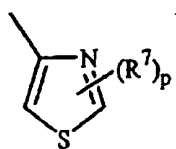
Realização 73. Composto da Fórmula 1 em que Z^1 é uma união direta.

10 Realização 74. Composto da Fórmula 1 em que Z^2 é uma união direta.

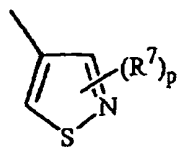
Realização 75. Composto da Fórmula 1 em que Q é um dentre Q-1 a Q-102 exibidos na Ilustração 4:

ILUSTRAÇÃO 4

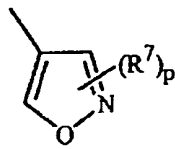




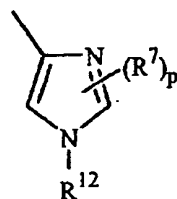
Q-25



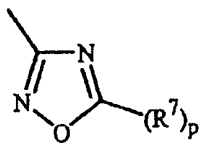
Q-26



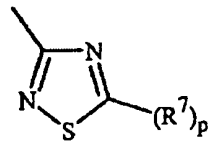
Q-27



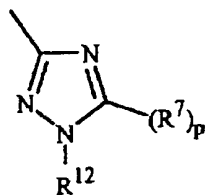
Q-28



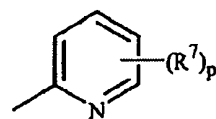
Q-29



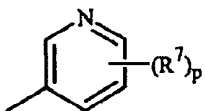
Q-30



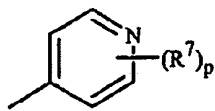
Q-31



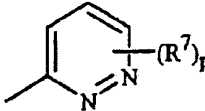
Q-32



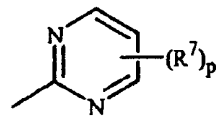
Q-33



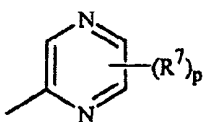
Q-34



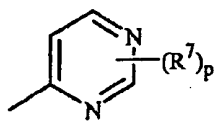
Q-35



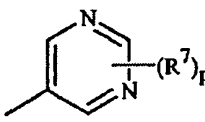
Q-36



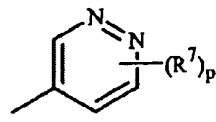
Q-37



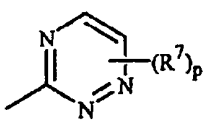
Q-38



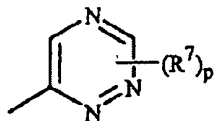
Q-39



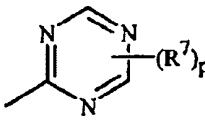
Q-40



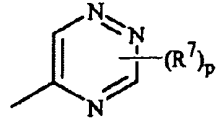
Q-41



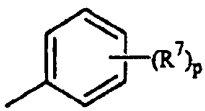
Q-42



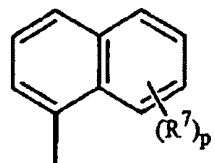
Q-43



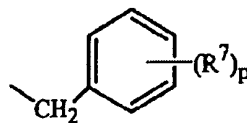
Q-44



Q-45



Q-46



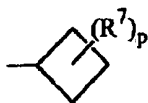
Q-47



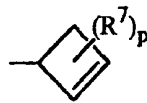
Q-48



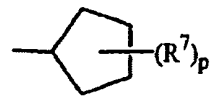
Q-49



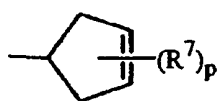
Q-50



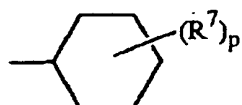
Q-51



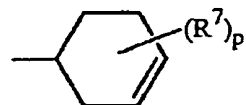
Q-52



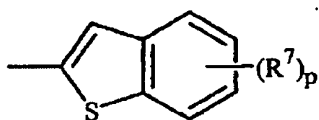
Q-53



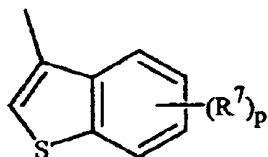
Q-54



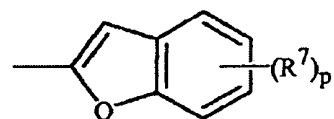
Q-55



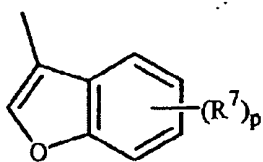
Q-56



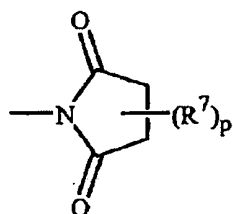
Q-57



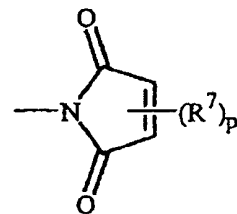
Q-58



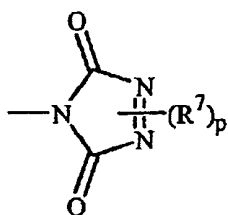
Q-59



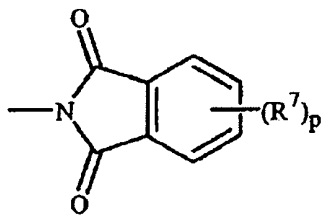
Q-60



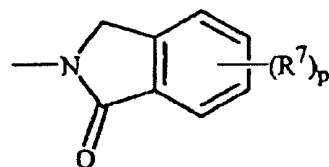
Q-61



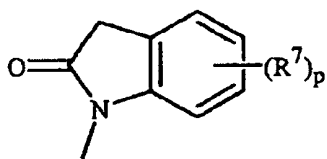
Q-62



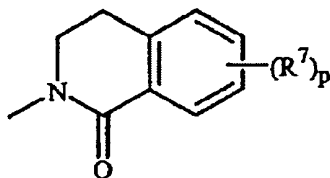
Q-63



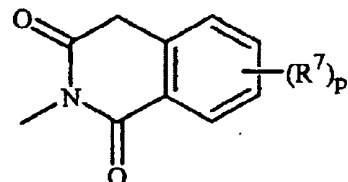
Q-64



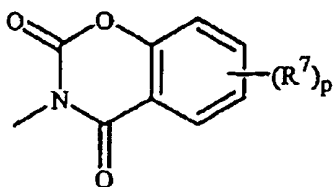
Q-65



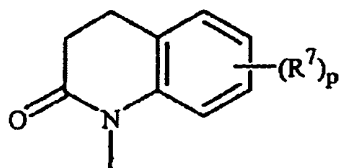
Q-66



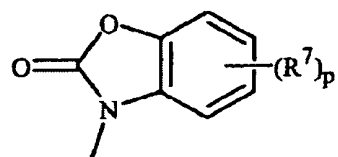
Q-67



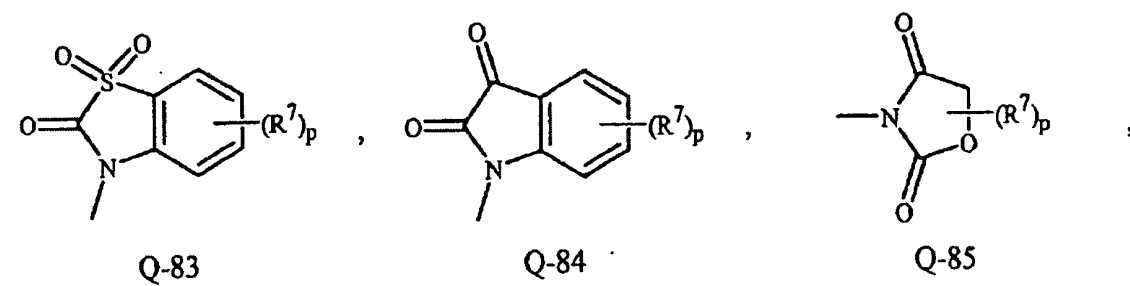
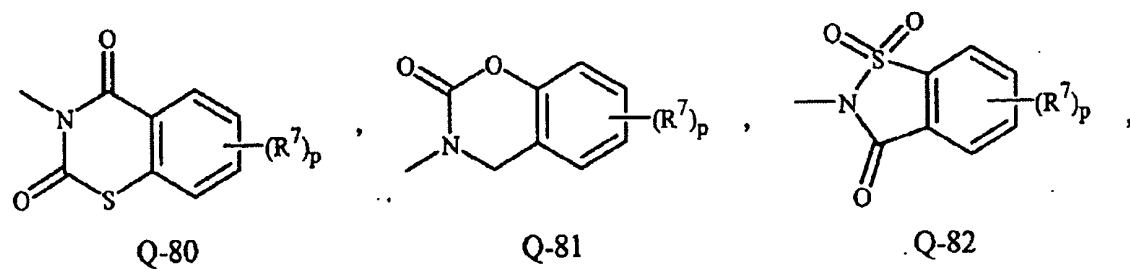
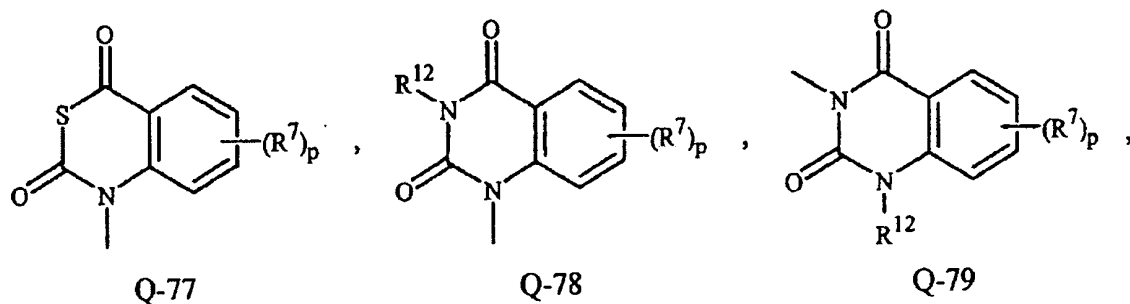
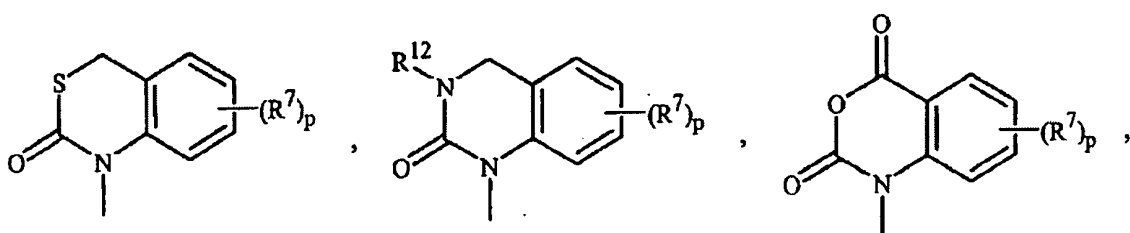
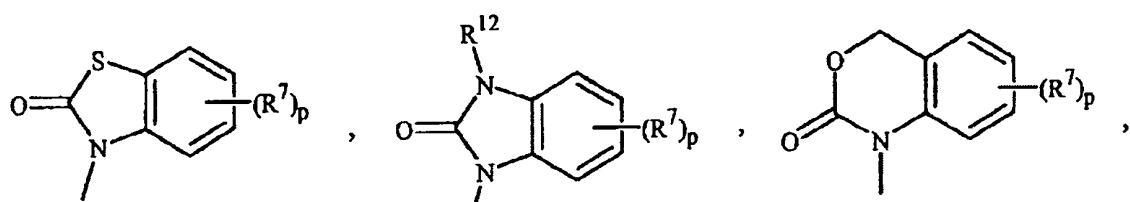
Q-68

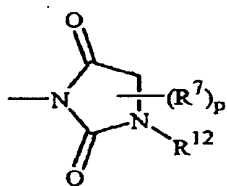


Q-69

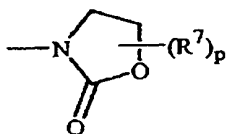


Q-70

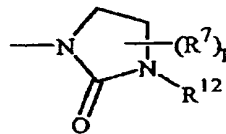




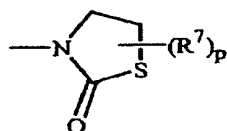
Q-86



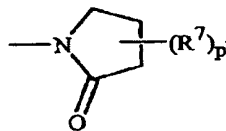
Q-87



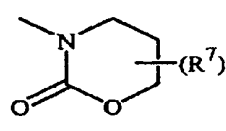
Q-88



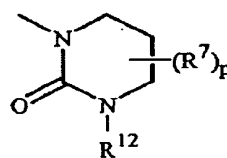
Q-89



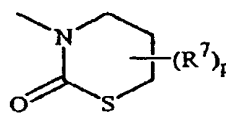
Q-90



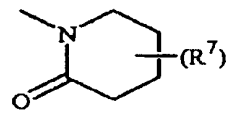
Q-91



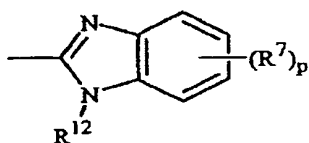
Q-92



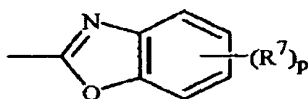
Q-93



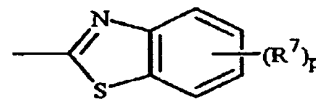
Q-94



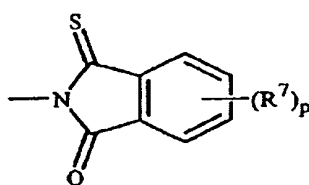
Q-95



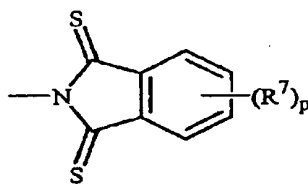
Q-96



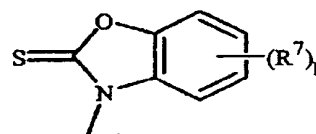
Q-97



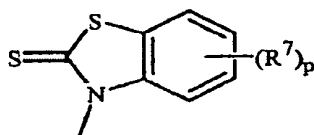
Q-98



Q-99

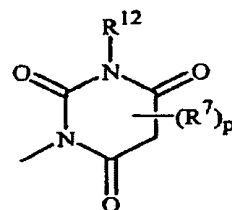


Q-100



Q-101

or



Q-102

em que p é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5.

Realização 76. Composto de acordo com a Realização 75, em que Q é seleccionado a partir de Q-1, Q-20, Q-32 a Q-34, Q-45 a Q-47, Q-60 a

Q-73, Q-76 a Q-79, Q-84 a Q-94 e Q-98 a Q-102.

Realização 77. Composto de acordo com a Realização 76, em que Q é Q-1, Q-45, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-73, Q-76, Q-78, Q-79, Q-84, Q-85, Q-98, Q-99, Q-100, Q-101 ou Q-102.

5 Realização 78. Composto de acordo com a Realização 77, em que Q é Q-45, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72 ou Q-85.

Realização 78a. Composto de acordo com a Realização 78, em que Q é Q-45, Q-63, Q-65, Q-70, Q-71, Q-72 ou Q-85.

10 Realização 78b. Composto de acordo com a Realização 78, em que Q é Q-45, Q-63, Q-65 ou Q-70.

Realização 79. Composto da Fórmula 1 ou de acordo com a Realização 75, em que cada R^7 é independentemente alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

15 Realização 80. Composto de acordo com a Realização 79, em que cada R^7 é independentemente alquila C_1-C_3 , halogênio, hidróxi, ciano ou alcóxi C_1-C_2 .

Realização 81. Composto de acordo com a Realização 80, em que cada R^7 é independentemente metila, F, Cl, Br, hidróxi, ciano ou metóxi.

20 Realização 82. Composto da Fórmula 1 em que, quando R^5 e R^7 forem tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído, os membros de anéis são selecionados a partir de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N e incluem opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo
25 que consiste de $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$, $S(O)_2$ e $SiR^{17}R^{18}$.

Realização 82a. Composto de acordo com a Realização 82, em que, quando R^5 e R^7 forem tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente

substituído, R^5 e R^7 são tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros que contém como membros de anéis átomos de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N e incluem opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$, $S(O)_2$ e $SiR^{17}R^{18}$, opcionalmente substituídos com até dois substituintes selecionados a partir de R^8 ; e cada R^8 é independentemente alquila C_1-C_3 .

Realização 82b. Composto da Fórmula 1, em que, quando R^5 e R^7 forem tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído, R^5 e R^7 são tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros que contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N e incluem opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$, $S(O)_2$ e $SiR^{17}R^{18}$, em que o anel é opcionalmente substituído sobre membros de anéis diferentes dos átomos que ligam R^5 e R^7 com substituintes selecionados a partir de R^8 ; e cada R^8 é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8

ou trialquilsilila C₃-C₆;

Realização 82c. Composto da Fórmula 1, em que, quando R⁵ e R⁷ forem tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído, R⁵ e R⁷ são tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros que contém como membros de anéis dois a sete átomos de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S, até 1 Si e até 1 N, o anel é opcionalmente substituído sobre membros de anéis diferentes dos átomos que ligam R⁵ e R⁷ com substituintes selecionados a partir de R⁸; e cada R⁸ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆.

Realização 82d. Composto de acordo com qualquer das Realizações 82b ou 82c, em que o anel é opcionalmente substituído sobre membros de anéis diferentes dos átomos que ligam R⁵ e R⁷ com até quatro substituintes selecionados a partir de R⁸.

Realização 82e. Composto de acordo com a Realização 82d, em que o anel é opcionalmente substituído sobre membros de anéis diferentes dos átomos que ligam R⁵ e R⁷ com até dois substituintes selecionados a partir de R⁸.

Realização 82f. Composto de acordo com qualquer das Realizações 82b ou 82c, em que cada R^8 é independentemente alquila C_1-C_3 .

Realização 82g. Composto de acordo com a Realização 82b, em que, quando R^5 e R^7 forem tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído, R^5 e R^7 são tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros que contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e opcionalmente de um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N e que incluem
5
10
opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$, $S(O)_2$ e $SiR^{17}R^{18}$, opcionalmente substituídos com até dois substituintes selecionados a partir de R^8 ; e cada R^8 é alquila C_1-C_3 .

Realização 82h. Composto de acordo com a Realização 82c, em
15
que, quando R^5 e R^7 forem tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído, R^5 e R^7 são tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros que contém como membros de anéis dois a sete átomos de carbono e opcionalmente de um a três
20
heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N, opcionalmente substituídos com até dois substituintes selecionados a partir de R^8 ; e cada R^8 é alquila C_1-C_3 .

Realização 83. Composto da Fórmula 1 ou de acordo com a Realização 75, em que p é 0, 1, 2 ou 3.

25
Realização 84. Composto da Fórmula 1 em que R^1 é fenila opcionalmente substituído ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros.

Realização 85. Composto da Fórmula 1 em que A é CH_2 ou NH.

Realização 86. Composto da Fórmula 1 em que X é selecionado a partir de X^1 , X^2 , X^3 , X^4 , X^5 , X^6 , X^7 e X^8 .

Realização 87. Composto da Fórmula 1 em que J é um anel com cinco ou seis membros, um sistema de anéis bicíclicos com oito a onze membros ou um sistema de anéis espirocíclicos com sete a onze membros, em que cada anel ou sistema de anéis contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e, opcionalmente, de um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 3 N e que inclui opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O) e S(O)₂, cada anel ou sistema de anéis opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁵.

Realização 88. Composto da Fórmula 1 em que J é fenila, anel heteroaromático com cinco ou seis membros, naftalenila ou um sistema de anéis bicíclicos heteroaromáticos com oito a onze membros, em que cada anel ou sistema de anéis é opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁵; ou J é um anel não aromático com cinco, seis ou sete membros, um sistema de anéis bicíclicos não aromáticos com oito a onze membros ou espirocíclicos com sete a onze membros, em que cada anel ou sistema de anéis inclui opcionalmente um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂ e SiR¹⁷R¹⁸, opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁵.

Realização 89. Composto da Fórmula 1, em que cada R⁵ é independentemente H, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆,

alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆,
haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈,
cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₆, haloalcoxialquila C₂-C₆,
hidroxialquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₆, alcoxicarbonila C₂-C₆,
5 alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆,
dialquilaminocarbonila C₃-C₈, trialquilsilila C₃-C₆ ou $-Z^2Q$; cada R⁷ é
independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila
C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquila
C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆,
10 halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄,
haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄,
haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄,
alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-
C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆,
15 alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆,
dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆; ou R⁵ e R⁷ são tomados em
conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a
sete membros opcionalmente substituído que contém, como membros de
anéis, dois a sete átomos de carbono e, opcionalmente, um a três
20 heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N.

Realização 90. Composto da Fórmula 1 em que cada Q é
independentemente um fenila, benzila, naftalenila, cicloalquila C₃-C₆,
cicloalquenila C₃-C₆ ou anel heteroaromático com cinco ou seis membros
opcionalmente substituído, cada qual opcionalmente substituído com um a três
25 substituintes selecionados a partir de R⁷ sobre membros de anéis de carbono e
R¹² sobre membros de anéis de nitrogênio.

Realização 90a. Composto da Fórmula 1 em que cada Q é
independentemente um anel carbocíclico não aromático com três a sete

membros, um anel heterocíclico não aromático com cinco, seis ou sete membros ou um sistema de anéis bicíclicos não aromáticos com oito a onze membros, em que cada qual inclui opcionalmente membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂ e SiR¹⁷R¹⁸, opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁷ sobre membros de anéis de átomos de carbono e R¹² sobre membros de anéis de átomos de nitrogênio.

Realização 91. Composto da Fórmula 1 em que cada Z¹ e Z² é independentemente uma união direta, O, C(=O), S(O)_m, CHR²⁰ ou NR²¹.

Realização 92. Composto da Fórmula 1 em que R²¹ é H, alquila C₁-C₃, alquilcarbonila C₁-C₃ ou alcóxicarbonila C₂-C₃.

Realização 93. Composto da Fórmula 1 em que, quando G for um anel tiazol opcionalmente substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z¹ na Fórmula 1, A for CHR¹⁵ e J for um anel isoxazol opcionalmente substituído conectado na sua posição 4 a Z¹, Z¹ é O, C(=O), S(O)_m, CHR²⁰ ou NR²¹.

Realização 94. Composto da Fórmula 1 em que, quando G for um anel tiazol opcionalmente substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z¹ na Fórmula 1 e J for um anel isoxazol opcionalmente substituído conectado na sua posição 4 a Z¹, Z¹ é O, C(=O), S(O)_m, CHR²⁰ ou NR²¹.

Realização 95. Composto da Fórmula 1 em que, quando G for um anel tiazol opcionalmente substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z¹ na Fórmula 1, A for CHR¹⁵, Z¹ for uma união direta e J for um anel isoxazol opcionalmente substituído, J é conectado ao restante da Fórmula 1 na posição 3 ou 5 do anel isoxazol.

Realização 96. Composto da Fórmula 1 em que, quando G for um anel tiazol opcionalmente substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z¹ na Fórmula 1, A for CHR¹⁵, Z¹ for uma união direta e J for um

anel isoxazol opcionalmente substituído, J é conectado ao restante da Fórmula 1 na posição 3 do anel isoxazol.

Realização 97. Composto da Fórmula 1 em que, quando G for um anel tiazol opcionalmente substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua
 5 posição 4 a Z^1 na Fórmula 1, Z^1 for uma união direta e J for um anel isoxazol opcionalmente substituído, J é conectado ao restante da Fórmula 1 na posição 3 do anel isoxazol.

Realização 98. Composto da Fórmula 1 em que, quando X for X^2 e o anel que contém X for saturado, A for CHR^{15} , G for um anel
 10 heteroaromático com cinco membros opcionalmente substituído, Z^1 for uma união direta e J for fenila, anel heteroaromático com cinco ou seis membros, naftalenila ou um sistema de anéis bicíclicos heteroaromáticos com oito a onze membros, o anel J ou sistema de anéis é substituído com pelo menos um R^5 que é diferente de H.

Realização 99. Composto da Fórmula 1 em que, quando X for X^2 e o anel que contém X for saturado, A for CHR^{15} , G for um anel
 15 heteroaromático com cinco membros opcionalmente substituído, Z^1 for uma união direta e J for fenila, anel heteroaromático com cinco ou seis membros, naftalenila ou um sistema de anéis bicíclicos heteroaromáticos com oito a onze
 20 membros, o anel J ou sistema de anéis é substituído com pelo menos um R^5 que é Z^2Q .

Realização 100. Composto da Fórmula 1 em que, quando X for X^1 e o anel que contém X for saturado, A for NH, G for um anel tiazol
 25 opcionalmente substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z^1 na Fórmula 1 e J for um anel imidazol opcionalmente substituído conectado na sua posição 2 ao restante da Fórmula 1, Z^1 é O, $C(=O)$, $S(O)_m$, CHR^{20} ou NR^{21} .

Realização 101. Composto da Fórmula 1 em que, quando X for X^1

e o anel que contém X for saturado, A for NR^{16} , G for um anel tiazol
 opcionalmente substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4
 a Z^1 na Fórmula 1 e J for um anel imidazol opcionalmente substituído
 conectado na sua posição 2 ao restante da Fórmula 1, Z^1 é O, $\text{C}(=\text{O})$, $\text{S}(\text{O})_m$,
 5 CHR^{20} ou NR^{21} .

Realização 102. Composto da Fórmula 1 em que, quando G for
 um anel tiazol opcionalmente substituído conectado na sua posição 2 a X e na
 sua posição 4 a Z^1 na Fórmula 1, J é diferente de imidazolila opcionalmente
 substituído.

10 Realização 103. Composto da Fórmula 1 em que cada Z^4 é
 independentemente $\text{C}(=\text{O})$ ou $\text{S}(\text{O})_2$.

Realização 104. Composto de acordo com a Realização 103, em
 que cada Z^4 é $\text{C}(=\text{O})$.

Realização 105. Composto da Fórmula 1 em que:

- 15 - cada R^2 é independentemente alquila $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquênica $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquila $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, halogênio, ciano ou hidróxi; ou
- dois R^2 são tomados em conjunto como alquênico $\text{C}_1\text{-C}_3$ ou alquênico $\text{C}_2\text{-C}_3$ para formar um sistema de anéis bicíclicos em ponte; ou
- dois R^2 ligados a átomos de carbono de anéis adjacentes
 20 unidos por uma união dupla são tomados em conjunto como -CH=CH-CH=CH-
 opcionalmente substituído com um a três substituintes selecionados a partir de
 alquila $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquila $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcóxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, halogênio,
 hidróxi, amino, ciano e nitro.

As combinações das Realizações 1 a 105 são ilustradas por:

25 Realização A1. Composto da Fórmula 1 em que:

- G é um anel heteroaromático com cinco membros ou um
 anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado com cinco membros, em
 que cada anel é opcionalmente substituído com até dois substituintes

selecionados a partir de R^3 sobre membros de anéis de carbono e selecionado a partir de R^{11} sobre membros de anéis de nitrogênio;

- R^1 é fenila ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituído com um a dois substituintes selecionados independentemente a partir de R^{4a} sobre membros de anéis de carbono e R^{4b} sobre membros de anéis de nitrogênio;

- cada R^2 é independentemente alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , alcóxi C_1-C_2 , halogênio, ciano ou hidróxi;

- cada R^3 é independentemente alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 ou halogênio;

- cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilocicloalquila C_4-C_{10} , alquilocicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialquilsilila C_3-C_6 ;

- cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_3-C_6 , haloalquinila C_3-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 ou alcoxialquila C_2-C_4 ;

- cada R^{11} é independentemente alquila C_1-C_3 ;

- R^{15} é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 ou alcoxicarbonila C_2-C_5 ;

- R^{16} é H, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , haloalquilcarbonila C_2-C_4 ou alcoxicarbonila C_2-C_4 ;

- quando R^5 e R^7 forem tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído, R^5 e R^7 são tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros que contém

5 membros de anéis selecionados a partir de carbono e opcionalmente um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N e que incluem opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂ e SiR¹⁷R¹⁸, em que o anel é

10 opcionalmente substituído sobre membros de anéis diferentes dos átomos que ligam R^5 e R^7 com até quatro substituintes selecionados a partir de R^8 ;

- cada R^8 é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano,

15 nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆,

20 alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;

e

- cada Z^4 é independentemente C(=O) ou S(O)₂.

Realização A2. Composto de acordo com a Realização A1, em que:

25 - G é um dentre G-1 a G-59 (conforme exibido na Ilustração 2), em que a união que se projeta para a esquerda é unida a X e a união que se projeta para a direita é unida a Z^1 ;

- J é um dentre J-1 a J-82 (conforme exibido na Ilustração 3),

em que a união exibida projetando-se para a esquerda é unida a Z^1 ;

- Q é um dentre Q-1 a Q-102 (conforme exibido na Ilustração 4);

- R^1 é um dentre U-1 a U-50 (conforme exibido na Ilustração 1);

- cada R^2 é independentemente metila, metóxi, ciano ou hidróxi;

- cada R^{3a} é selecionado independentemente a partir de H e R^3 ;

- cada R^5 é independentemente H, ciano, alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , halocicloalquila C_3-C_8 , alquilocicloalquila C_4-C_{10} , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alcoxialquila C_2-C_6 , cicloalcoxialquila C_4-C_{10} , alcoxialcoxialquila C_3-C_8 , alquiltioalquila C_2-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , cicloalcóxi C_3-C_8 , halocicloalcóxi C_3-C_8 , cicloalquilalcóxi C_4-C_{10} , alquenilóxi C_2-C_6 , haloalquenilóxi C_2-C_6 , alquinilóxi C_2-C_6 , haloalquinilóxi C_2-C_6 , alcoxialcóxi C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , haloalquilcarbonilóxi C_2-C_6 , cicloalquilcarbonilóxi C_4-C_8 , alquilcarbonilalcóxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , cicloalquiltio C_3-C_8 , trialquilsilila C_3-C_{10} , - $NR^{25}R^{26}$ ou Z^2Q ;

- R^{11a} é selecionado a partir de H e R^{11} ;

- R^{15} é H, ciano, hidróxi, metila ou metoxicarbonila;

- R^{16} é H, metila, metilcarbonila ou metoxicarbonila;

- cada Z^4 é $C(=O)$;

- k é 0, 1 ou 2;

- p é 0, 1, 2 ou 3; e

- x é um número inteiro de 0 a 5;

desde que:

(a) quando R^4 for ligado a um membro de anel de carbono, o mencionado R^4 é selecionado a partir de R^{4a} ;

(b) quando R^4 for ligado a um membro de anel de nitrogênio (tal como em U-4, U-11 a U-15, U-24 a U-26, U-31 ou U-35), o mencionado R^4 é selecionado a partir de R^{4b} ;

(c) quando G for G-6, G-16 ou G-42 e cada R^{3a} for diferente de H, R^{11a} é H;

(d) quando G for G-25 ou G-31, pelo menos um R^{3a} é H; e

(e) quando G for um dentre G-31 a G-35, Z^1 é uma união direta ou CHR^{20} .

Realização A3. Composto da Realização A2, em que:

- G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-36, G-37, G-38, G-49, G-50 e G-55;

- J é selecionado a partir de J-1, J-2, J-3, J-4, J-5, J-7, J-8, J-9, J-10, J-11, J-12, J-14, J-15, J-16, J-20, J-24, J-25, J-26, J-29, J-30, J-37, J-38, J-45 e J-69;

- cada Q é independentemente Q-1, Q-20, Q-32 a Q-34, Q-45 a Q-47, Q-60 a Q-73, Q-76 a Q-79, Q-84 a Q-94 e Q-98 a Q-102;

- A é CH_2 ou NH;

- W é O;

- X é X^1 , X^2 ou X^3 ;

- cada R^5 é independentemente H, ciano, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , halocicloalquila C_3-C_8 , alcoxialquila C_2-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , cicloalcóxi C_3-C_8 , alquenilóxi C_2-C_6 , haloalquenilóxi C_2-C_6 , alquinióxi C_2-C_6 , alcoxialcóxi C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , haloalquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , trialquilsilila C_3-C_{10} , $-NR^{25}R^{26}$ ou Z^2Q ;

- Z^1 é uma união direta;

- Z^2 é uma união direta ou NR^{21} ;
- R^1 é selecionado a partir de U-1 a U-3, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, U-36 a U-39 e U-50;
- cada R^3 é independentemente metila ou halogênio;
- 5 - cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , halogênio, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;
- cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 ;
- cada R^7 é independentemente halogênio, ciano, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , hidróxi, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;
- 10 - k é 1 ou 2; e
- n é 0.

Merecem observação compostos da Realização A3 em que um R^5 é Z^2Q e quaisquer outros substituintes R^5 são selecionados independentemente a partir de H, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , halocicloalquila C_3-C_8 , alcoxialquila C_2-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , cicloalcóxi C_3-C_8 , alquenilóxi C_2-C_6 , haloalquenilóxi C_2-C_6 , alquinilóxi C_2-C_6 , alcoxialcóxi C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , haloalquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquitio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , trialquilsilila C_3-C_{10} e $-NR^{25}R^{26}$. Também merecem

20 observação compostos da Realização A3 em que todos os substituintes R^5 são diferentes de Z^2Q (cada R^5 é selecionado independentemente, por exemplo, a partir de H, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , halocicloalquila C_3-C_8 , alcoxialquila C_2-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , cicloalcóxi C_3-C_8 , alquenilóxi C_2-C_6 , haloalquenilóxi C_2-C_6 , alquinilóxi C_2-C_6 , alcoxialcóxi C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , haloalquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquitio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , trialquilsilila C_3-C_{10} e $-NR^{25}R^{26}$).

25

Realização A4. Composto de acordo com a Realização A3, em que:

- A é CH₂;
- G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 e G-38; e G é não substituído;
- J é selecionado a partir de J-4, J-5, J-8, J-11, J-15, J-16, J-20, J-29, J-30, J-37, J-38 e J-69;
- Q é selecionado a partir de Q-1, Q-45, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-73, Q-76, Q-78, Q-79, Q-84, Q-85, Q-98, Q-99, Q-100, Q-101 e Q-102;
- X é X¹ ou X²; e o anel que compreende X é saturado;
- R¹ é U-1 ou U-50;
- cada R^{4a} é independentemente alquila C₁-C₂, trifluorometila, Cl, Br, I ou metóxi;
- cada R^{4b} é independentemente alquila C₁-C₂ ou trifluorometila; e
- cada R⁵ é independentemente H, ciano, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₄, -NR²⁵R²⁶ ou Z²Q.

Realização A5. Composto de acordo com a Realização A4, em que:

- G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26 e G-36;
- J é selecionado a partir de J-4, J-5, J-11, J-20, J-29, J-37, J-38 e J-69;
- Q é selecionado a partir de Q-45, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72 e Q-85; e
- X é X¹.

Realização A6. Composto da Fórmula 1 em que:

- R¹ é fenila opcionalmente substituído ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros;
- A é CH₂ ou NH;

- X é X¹, X², X³, X⁴, X⁵, X⁶, X⁷ ou X⁸;
- cada R² é independentemente alquila C₁-C₄, alquenila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, halogênio, ciano ou hidróxi; ou
- dois R² são tomados em conjunto como alquilenos C₁-C₃ ou alquenilenos C₂-C₃ para formar um sistema de anéis bicíclicos em ponte; ou
- dois R² ligados a átomos de carbono de anéis adjacentes unidos por uma união dupla são tomados em conjunto como -CH=CH-CH=CH- opcionalmente substituído com um a três substituintes selecionados a partir de alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, halogênio, hidróxi, amino, ciano e nitro;
- G é um anel heteroaromático com cinco membros opcionalmente substituído ou anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado com cinco membros;
- J é um anel com cinco ou seis membros ou um sistema de anéis bicíclicos com oito a onze membros, em que cada anel ou sistema de anéis contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 3 N e que inclui opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O) ou S(O)₂, em que cada anel ou sistema de anéis é opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁵;
- cada R⁵ é independentemente H, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈,

cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₆, haloalcoxialquila C₁-C₆, hidroxialquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₆, alcoxycarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈, trialquilsilila C₃-C₆ ou -Z²Q;

- cada Q é independentemente fenila, benzila, naftalenila, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquenila C₃-C₆ ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituído, cada qual opcionalmente substituído com um a três substituintes selecionados independentemente a partir de R⁷ sobre membros de anéis de carbono e R¹² sobre membros de anéis de nitrogênio;

- cada R⁷ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, nitrogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxycarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆; ou

- R⁵ e R⁷ são tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído que contém como membros de anéis dois a sete átomos de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N;

- R¹² é alquila C₁-C₃;

- cada Z¹ e Z² é independentemente uma união direta, O,

S(O)_m, CHR²⁰ ou NR²¹; e

- R²¹ é H ou alquila C₁-C₃.

Realização A7. Composto de acordo com a Realização A6, em que:

5 - G é um anel heteroaromático com cinco membros ou anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado com cinco membros, cada anel opcionalmente substituído com até dois substituintes selecionados a partir de R³ sobre membros de anéis de carbono e selecionados a partir de R¹¹ sobre membros de anéis de nitrogênio;

10 - R¹ é fenila ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituído com um a dois substituintes selecionados independentemente a partir de R^{4a} sobre membros de anéis de carbono e R^{4b} sobre membros de anéis de nitrogênio;

- cada R³ é independentemente alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃ ou halogênio;

15 - cada R^{4a} é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;

25 - cada R^{4b} é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₃-C₆, alquinila C₃-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₃-C₆, haloalquinila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆ ou alcoxialquila C₂-C₄;

- cada R^{11} é independentemente alquila C_1-C_3 ; e
- quando R^5 e R^7 forem tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído, R^5 e R^7 são tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros que contém como membros de anéis dois a sete átomos de carbono e opcionalmente um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N opcionalmente substituídos com até dois substituintes selecionados a partir de R^8 ; e cada R^8 é independentemente alquila C_1-C_3 .

Realização A8. Composto de acordo com a Realização A7, em que:

- G é um dentre G-1 a G-55 (conforme exibido na Ilustração 2), em que a união que se projeta para a esquerda é unida a X e a união que se projeta para a direita é unida a Z^1 ;

- J é um dentre J-1 a J-82 (conforme exibido na Ilustração 3) em que a união exibida que se projeta para a esquerda é unida a Z^1 ;

- Q é um dentre Q-1 a Q-55 (conforme exibido na Ilustração 4);

- R^1 é um dentre U-1 a U-50 (conforme exibido na Ilustração 1);

- cada R^{3a} é selecionado independentemente a partir de H e R^3 ;

- R^{11a} é selecionado a partir de H e R^{11} ;

- k é 0, 1 ou 2;

- p é 0, 1 ou 2; e

- x é um número inteiro de 0 a 5;

desde que:

(a) quando R^4 for ligado a um membro de anel de carbono, o

5 mencionado R^4 é selecionado a partir de R^{4a} ;

(b) quando R^4 for ligado a um membro de anel de nitrogênio (tal como em U-4, U-11 a U-15, U-24 a U-26, U-31 ou U-35), o mencionado R^4 é selecionado a partir de R^{4b} ;

5 (c) quando G for G-6, G-16 ou G-42 e cada R^{3a} for diferente de H, R^{11a} é H;

(d) quando G for G-25 ou G-31, o pelo menos um R^{3a} é H; e

(e) quando G for um dentre G-31 a G-35, Z^1 é uma união direta ou CHR^{20} .

10 Realização A9. Composto de acordo com a Realização A8, em que:

- G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 e G-38;

15 - J é selecionado a partir de J-1, J-2, J-3, J-4, J-5, J-7, J-8, J-9, J-10, J-11, J-12, J-14, J-15, J-16, J-20, J-24, J-25, J-26, J-29, J-30, J-45 e J-69;

- cada Q é independentemente Q-1, Q-20, Q-32 a Q-34, Q-45, Q-46 ou Q-47;

- W é O;

20 - X é X^1 , X^2 ou X^3 ;

- cada Z^1 e Z^2 é uma união direta;

- R^1 é selecionado a partir de U-1 a U-3, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, U-36 a U-39 e U-50;

- cada R^3 é independentemente metila ou halogênio;

25 - cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , halogênio ou alcóxi C_1-C_2 ;

- cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 ;

- um caso de R^5 é Z^2Q e os outros casos de R^5 são selecionados independentemente a partir de H, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 e halogênio;

- cada R^7 é independentemente halogênio, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , hidróxi, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;

- k é 1 ou 2; e

- n é 0.

Realização A10. Composto de acordo com a Realização A9, em

que:

- A é CH_2 ;

- G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26 e G-36; e

G é não substituído;

- J é selecionado a partir de J-11, J-25, J-26, J-29 e J-30;

- Q é selecionado a partir de Q-1 e Q-45;

- X é X^1 ou X^2 ; e o anel que compreende X é saturado;

- R^1 é U-1 ou U-50;

- cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_2 , trifluorometila, Cl, Br, I ou metóxi; e

- cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_2 ou trifluorometila.

Realização A11. Composto de acordo com a Realização A10, em

que:

- J é selecionado a partir de J-11 e J-29;

- X é X^1 ; e

- cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_2 , trifluorometila ou Cl.

Realização A12. Composto da Fórmula 1, em que:

- R^1 é U-1 ou U-50 (conforme exibido na Ilustração 1) em

que, quando R^4 for ligado a um membro de anel de carbono, o mencionado R^4 é selecionado a partir de R^{4a} e, quando R^4 for ligado a um membro de anel de nitrogênio, o mencionado R^4 é selecionado a partir de R^{4b} ;

- cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_2 , trifluorometila, Cl, Br, I ou metóxi;

- cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_2 ou trifluorometila;

- A é CH_2 ;

- W é O;

- X é X^1 ou X^2 e o anel que compreende X é saturado;

- cada R^2 é independentemente etila, metóxi, ciano ou hidróxi;

- G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26 e G-36 (conforme exibido na Ilustração 2), em que a união que se projeta para a esquerda é unida a X e a união que se projeta para a direita é unida a Z^1 ; e G é não substituído;

- cada R^{3a} é selecionado independentemente a partir de H e R^3 ;

- cada R^3 é independentemente metila ou halogênio;

- J é selecionado a partir de J-11, J-25, J-26, J-29 e J-30 (conforme exibido na Ilustração 3), em que a união exibida projetando-se para a esquerda é unida a Z^1 ;

- cada R^5 é independentemente H, ciano, hidróxi, amino, nitro, -CHO, -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, -NR²⁵R²⁶, alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , halocicloalquila C_3-C_8 , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , cicloalquilcicloalquila C_6-C_{14} , halocicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , cicloalquenila C_3-C_8 , halocicloalquenila C_3-

C₈, alcoxialquila C₂-C₆, cicloalcoxialquila C₄-C₁₀, alcoxialcoxialquila C₃-C₈, alquiltioalquila C₂-C₆, alquilsulfinilalquila C₂-C₆, alquilsulfonilalquila C₂-C₆, alquilaminoalquila C₂-C₆, dialquilaminoalquila C₃-C₈, haloalquilaminoalquila C₂-C₆, cicloalquilaminoalquila C₄-C₁₀, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, cicloalquilcarbonila C₄-C₈, alcoxycarbonila C₂-C₆, cicloalcoxycarbonila C₄-C₈, cicloalquilalcoxycarbonila C₅-C₁₀, alquilaminocarbonila C₄-C₈, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈, halocicloalcóxi C₃-C₈, cicloalquilalquilóxi C₄-C₁₀, alquenilóxi C₂-C₆, haloalquenilóxi C₂-C₆, alquinilóxi C₂-C₆, haloalquinilóxi C₂-C₆, alcoxialcóxi C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, haloalquilcarbonilóxi C₂-C₆, cicloalquilcarbonilóxi C₄-C₈, alquilcarbonilalcóxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, cicloalquilsulfonila C₃-C₈, alquilsulfonilamino C₁-C₆, haloalquilsulfonilamino C₁-C₆ ou -Z²Q;

- R²⁵ é H, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, alcoxycarbonila C₂-C₆ ou haloalcoxycarbonila C₂-C₆;

- R²⁶ é alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, alcoxycarbonila C₂-C₆, haloalcoxycarbonila C₂-C₆ ou -Z⁴Q;

- cada Q é selecionado a partir de Q-1, Q-45 e Q-63 (conforme exibido na Ilustração 4);

- cada R⁷ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄,

haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxycarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;

5 ou

- R⁵ e R⁷ são tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros que contém como membros de anéis dois a sete átomos de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S, até 1 Si e até 1 N, em que o anel é opcionalmente substituído sobre membros de anéis diferentes dos átomos que ligam R⁵ e R⁷ com até quatro substituintes selecionados a partir de R⁸;

- cada R⁸ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxycarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;

- R¹² é alquila C₁-C₃;

- cada Z¹ e Z² é uma união direta;

- cada Z⁴ é independentemente C(=O) ou S(O)₂;

- n é 0, 1 ou 2;

- k é 0, 1 ou 2;

- p é 0, 1 ou 2; e

- x é um número inteiro de 0 a 5;

desde que, quando R^1 for tienila não substituído, X for X^1 , G for um anel tiazol não substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z^1 na Fórmula 1 e J for um anel isoxazol conectado na sua posição 4 a Z^1 e substituído na sua posição 5 com metila, J é não substituído na sua posição 3 com fenila meta-substituído.

As realizações da presente invenção também incluem:

Realização B1. Composto da Fórmula 1A em que cada R^{4a1} e R^{4a2} é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

Realização B2. Composto da Realização B1 em que cada R^{4a1} e R^{4a2} é independentemente alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , halogênio, ciano, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

Realização B3. Composto de acordo com a Realização B2 em que cada R^{4a1} e R^{4a2} são independentemente alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 ou halogênio.

Realização B4. Composto da Fórmula 1A em que A^a é H.

Realização B5. Composto da Fórmula 1A em que A^a é CH_2CO_2H .

Realização B6. Composto da Fórmula 1A em que A^a é $CH_2CO_2R^{30}$.

Realização B7. Composto da Fórmula 1A em que A^a é $CH_2C(=O)Cl$.

Realização B8. Composto da Fórmula 1B em que cada R^{4a1} e R^{4a2} é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

Realização B9. Composto de acordo com a Realização B8, em

que cada R^{4a1} e R^{4a2} é independentemente alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , halogênio, ciano, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

Realização B10. Composto de acordo com a Realização B9, em que cada R^{4a1} e R^{4a2} é independentemente alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 ou halogênio.

Realização B11. Composto da Fórmula 1B em que Z^3 é CN.

Realização B12. Composto da Fórmula 1B em que Z^3 é $C(=S)NH_2$.

Com relação aos compostos da Fórmula 1C de acordo com a presente invenção, observa-se que várias realizações de J-29 podem estar presentes em duas ou mais formas enantioméricas. As formas enantioméricas de realizações J-29 para compostos da Fórmula 1C de acordo com a presente invenção são as exibidas na Ilustração A acima. Todos os enantiômeros de J-29 são incluídos em compostos da Fórmula 1C na presente invenção para realizações nas quais nenhuma forma enantiomérica de J-29 específica é ilustrada (tais como enantiômeros J-29-33 e enantiômeros J-29-22 com base na posição do grupo metila).

Realização B13. Composto da Fórmula 1C em que M é alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , hidróxi, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_2 , alquilamino C_1-C_3 , dialquilamino C_2-C_6 , 1-piperidinila, 1-pirrolidinila ou 4-morfolinila.

Realizações específicas incluem compostos da Fórmula 1 selecionados a partir do grupo que consiste de:

- 4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]piperidina e seu enantiômero (Composto 1);

- 1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-[4-(5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]piperidina (Composto 2);

- 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-metil-5-fenil-3-isoxazolil]-2-

tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 15);

- 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(3*aS*, 9*bR*),3*a*,4,5,9*b*-tetraidronaft[2,1-*d*]isoxazol-3-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero (Composto 16);

- 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-etil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 19);

- 2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero (Composto 22);

- 1-[4-[4-[(5*R*)-3',4'-di-hidrospiro[isoxazol-5 (4*H*),1',(2'*H*)-naftalen]-3-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 37);

- 1-[4-[4-[(5*R*)-2,3-di-hidrospiro[1*H*-indeno-1,5'(4'*H*)-isoxazol]-3'-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 44);

- 2-[5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero (Composto 107);

- 2-[(5*R*)-4,5-di-hidro-3-[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil-5-isoxazolil]-1*H*-isoindol-1,3(2*H*)-diona e seu enantiômero (Composto 129);

- 2-[5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(1*R*)-2,3-di-hidrospiro[1*H*-indeno-1,5'(4'*H*)-isoxazol]-3'-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero (Composto 232);

- 2-[5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(1'*R*)-3',4'-di-hidrospiro[isoxazol-5(4*H*),1'(2'*H*)naftalen]-3-il]-2-tiazolil]-1-

piperidinil]etanona e seu enantiômero (Composto 230);

- 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(3*R*)-espiro[benzofuran-3(2*H*),5'(4'*H*)-isoxazol-3'-il-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero (Composto 185);

5 - 1-[4-[4-[(1*R*)-2,3-di-hidrospiro[1*H*-indeno-1,5'(4'*H*)-isoxazol]-3'-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil-2-(3,5-dimetil-1*H*-pirazol-1-il)etanona e seu enantiômero (Composto 165);

- 2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(1'*R*)-3',4'-di-hidrospiro[isoxazol-5(4*H*),1'(2'*H*)-naftalen]-3-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero (Composto 229);

- 2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(1*R*)-2,3-di-hidrospiro[1*H*-indeno-1,5'(4'*H*)-isoxazol]-3'-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero (Composto 231);

15 - 1-[4-[4-[(5*R*)-5-(2,6-diclorofenil)-4,5-di-hidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 135);

- 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-[2-(trifluorometil)fenil]-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 79);

20 - 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-(2-metilfenil)-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 161);

- 1-[4-[4-[(5*R*)-5-(2,6-dimetilfenil)-4,5-di-hidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 178);

25 - 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-(2,4,6-trimetilfenil)-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 179);

- 1-[4-[4-[(1'*R*)-3',4'-di-hidrospiro[isoxazol-5(4*H*),1'(2'*H*)-naftalen]-3-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-(3,5-dimetil-1*H*-pirazol-1-il) etanona e seu enantiômero (Composto 164);

5 - 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-(2,4,6-trimetoxifenil)-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 155);

- 3-[(5*R*)-4,5-di-hidro-3-[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil]-5-isoxazolil]-2(3*H*)benzoxazolona e seu enantiômero (Composto 225);

10 - 1-[4-[4-[(5*R*)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-di-hidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 214);

- 2-[(5*R*)-4,5-di-hidro-3-[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil]-5-isoxazolil]benzonitrila e seu enantiômero (Composto 220);

15 - 2-[5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-metil-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero (Composto 261);

- 2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-metil-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero (Composto 260);

- 1-[4-[4-[(5*R*)-5-(2-clorofenil)-4,5-di-hidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 8);

25 - 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[3-metil-5-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 128);

- 1-[4-[4-[(4*S*)-2,3-di-hidrospiro[4*H*-1-benzopiran-4,5'(4'*H*)-

isoxazol]-3'-il)-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero (Composto 137); e

- (5*R*)-4,5-di-hidro-3-[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil]-5-fenil-5-isoxazolocarbonitrila e seu enantiômero (Composto 265).

Realizações específicas também incluem compostos da Fórmula 1B selecionados a partir do grupo que consiste de:

- 1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbonitrila;

- 1-[2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbonitrila;

- 1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbonitrila; e

- 1-[2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbonitrila.

Merecem observação compostos da Fórmula 1, incluindo todos os seus isômeros geométricos, estereoisômeros, *N*-óxidos e sais apropriados para uso agrícola, composições agrícolas que os contêm e seu uso como fungicidas, em que:

- R^1 é um fenila opcionalmente substituído ou anel heteroaromático com cinco ou seis membros;

- A é CH₂ ou NH;

- X é X¹, X², X³, X⁴, X⁵, X⁶, X⁷ ou X⁸;

- cada R² é independentemente alquila C₁-C₄, alquenila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, halogênio, ciano ou hidróxi; ou

- dois R² são tomados em conjunto como alquilenos C₁-C₃ ou alquilenos C₂-C₃ para formar um sistema de anéis bicíclicos com ponte; ou

- dois R² ligados a átomos de carbono de anéis adjacentes

unidos por uma união dupla são tomados em conjunto como $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ opcionalmente substituídos com um a três substituintes selecionados a partir de alquila $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquila $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcóxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, halogênio, hidróxi, amino, ciano e nitro;

- 5 - J é um anel com cinco ou seis membros ou um sistema de anéis bicíclicos com oito a onze membros, em que cada anel ou sistema de anéis que contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 3 N e incluindo opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de $\text{C}(=\text{O})$, $\text{C}(=\text{S})$, $\text{S}(\text{O})$ ou $\text{S}(\text{O})_2$, em que cada anel ou sistema de anéis é opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R^5 ;

- cada R^5 é independentemente H, alquila $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquenila $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquinila $\text{C}_2\text{-C}_6$, cicloalquila $\text{C}_3\text{-C}_6$, cicloalquilalquila $\text{C}_4\text{-C}_{10}$, alquilcicloalquila $\text{C}_4\text{-C}_{10}$, alquilcicloalquilalquila $\text{C}_5\text{-C}_{10}$, haloalquila $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquenila $\text{C}_2\text{-C}_6$, haloalquinila $\text{C}_2\text{-C}_6$, halocicloalquila $\text{C}_3\text{-C}_6$, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalcóxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquiltio $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquilsulfinila $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquilsulfonila $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquiltio $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilsulfonila $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquilamino $\text{C}_1\text{-C}_6$, dialquilamino $\text{C}_2\text{-C}_8$, cicloalquilamino $\text{C}_3\text{-C}_6$, alcoxialquila $\text{C}_2\text{-C}_6$, haloalcoxialquila $\text{C}_2\text{-C}_6$, hidroxialquila $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquilcarbonila $\text{C}_2\text{-C}_6$, alcoxycarbonila $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquilcarbonilóxi $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquilcarboniltio $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquilaminocarbonila $\text{C}_2\text{-C}_6$, dialquilaminocarbonila $\text{C}_3\text{-C}_8$, trialquilsilila $\text{C}_3\text{-C}_6$ ou $-\text{Z}^2\text{Q}$;

- cada Q é independentemente fenila, benzila, naftalenila, cicloalquila $\text{C}_3\text{-C}_6$, cicloalquenila $\text{C}_3\text{-C}_6$ ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituído, cada qual opcionalmente substituído com um a três substituintes selecionados a partir de R^7 sobre membros de anéis de carbono e R^{12} sobre membros de anéis de nitrogênio;

- cada R^7 é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialkilsilila C_3-C_6 ; ou

- R^5 e R^7 são tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituídos que contém como membros de anéis dois a sete átomos de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N;

- R^{12} é alquila C_1-C_3 ;

- cada Z^1 e Z^2 é independentemente uma união direta, O, $S(O)_m$, CHR^{20} ou NR^{21} ;

- m é 0, 1 ou 2 (que se compreende como indicando que cada m é independentemente 0, 1 ou 2); e

- R^{21} é H ou alquila C_1-C_3 (sujeito à ressalva (b) e/ou ressalva (c) conforme aplicável).

Também merecem observação compostos da Fórmula 1, que incluem todos os seus isômeros geométricos e estereoisômeros, *N*-óxidos e sais, composições agrícolas que os contêm e seu uso como fungicidas, em que:

- cada R^5 é independentemente H, halogênio, ciano, hidróxi,

amino, nitro, -CHO, -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, -NR²⁵R²⁶, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₈, halocicloalquila C₃-C₈, alquilocicloalquila C₄-C₁₀, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, cicloalquilcicloalquila C₆-C₁₄, halocicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquila C₅-C₁₀, cicloalquenila C₃-C₈, halocicloalquenila C₃-C₈, alcoxialquila C₂-C₆, cicloalcoxialquila C₄-C₁₀, alcoxialcoxialquila C₃-C₈, alquiltioalquila C₂-C₆, alquilsulfinilalquila C₂-C₆, alquilsulfonilalquila C₂-C₆, alquilaminoalquila C₂-C₆, dialquilaminoalquila C₃-C₈, haloalquilaminoalquila C₂-C₆, cicloalquilaminoalquila C₄-C₁₀, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, cicloalquilcarbonila C₄-C₈, alcoxycarbonila C₂-C₆, cicloalcoxycarbonila C₄-C₈, cicloalquilalcoxycarbonila C₅-C₁₀, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈, cicloalquilaminocarbonila C₄-C₈, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈, halocicloalcóxi C₃-C₈, cicloalquilalcóxi C₄-C₁₀, alquenilóxi C₂-C₆, haloalquenilóxi C₂-C₆, alquinilóxi C₂-C₆, haloalquinilóxi C₂-C₆, alcoxialcóxi C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, haloalquilcarbonilóxi C₂-C₆, cicloalquilcarbonilóxi C₄-C₈, alquilcarbonilalcóxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, cicloalquilsulfonila C₃-C₈, alquilsulfonilalquila C₃-C₁₀, alquilsulfonilamino C₁-C₆, haloalquilsulfonilamino C₁-C₆ ou - Z²Q;

- cada R⁷ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila

C₂-C₄, alcóxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆; ou

- R⁵ e R⁷ são tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituídos que contém como membros de anéis dois a sete átomos de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S, até 1 Si e até 1 N; e

- R¹² é alquila C₁-C₃ (sujeito à ressalva (b) e/ou à ressalva (c) conforme aplicável).

A presente invenção fornece uma composição fungicida que compreende um composto da Fórmula 1 (que inclui todos os seus isômeros geométricos, estereoisômeros, *N*-óxidos e sais) e pelo menos um outro fungicida. Merecem observação como realizações destas composições as composições que compreendem um composto correspondente a qualquer das realizações de compostos descritas acima.

A presente invenção fornece uma composição fungicida que compreende uma quantidade eficaz como fungicida de um composto da Fórmula 1 (que inclui todos os seus isômeros geométricos e estereoisômeros, *N*-óxidos e sais apropriados para uso agrícola) e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos. Merecem observação como realizações dessas composições as composições que compreendem um composto correspondente a qualquer das realizações de compostos descritas acima.

A presente invenção fornece um método de controle de doenças das plantas causadas por patógenos vegetais fúngicos que compreende a aplicação à planta ou a uma parte dela, ou à semente da planta, de uma quantidade eficaz como fungicida de um composto da Fórmula 1 (que inclui

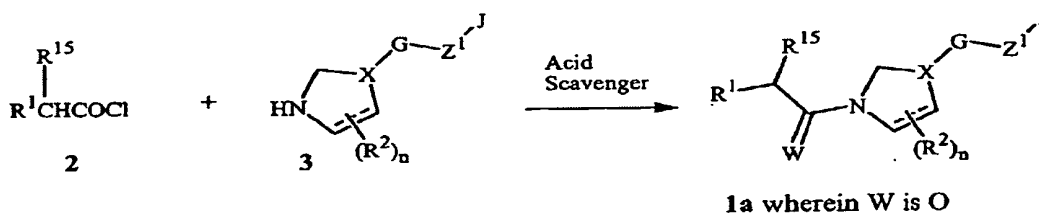
todos os seus isômeros geométricos, estereoisômeros, *N*-óxidos e sais apropriados para uso agrícola). Merecem observação como uma realização desses métodos os métodos que compreendem a aplicação de uma quantidade eficaz como fungicida de um composto correspondente a qualquer das realizações de compostos descritas acima. Merecem observações específicas as realizações em que os compostos são aplicados como composições da presente invenção.

Os compostos das Fórmulas 1, 1A, 1B e 1C podem ser preparados por meio de um dos métodos e variações a seguir, conforme descrito nos Esquemas 1 a 20. As definições de A, G, J, W, X, Q, Z¹, R¹, R², R¹⁵, R¹⁶ e n nos compostos das Fórmulas 1 a 38 abaixo são conforme descrito acima na Descrição Resumida da Invenção, a menos que indicado em contrário. As Fórmulas 1a a 1e e as Fórmulas 1Ba e 1Bb são vários subconjuntos da Fórmula 1 e 1B, respectivamente.

Conforme exibido no Esquema 1, os compostos da Fórmula 1a (Fórmula 1 em que A é CHR¹⁵) em que W é O podem ser preparados por meio de acoplamento de um cloreto ácido da Fórmula 2 com uma amina da Fórmula 3 na presença de um extrator ácido. Os extratores ácidos típicos incluem bases amina tais como trietilamina, *N,N*-diisopropiletilamina e piridina. Outros extratores incluem hidróxidos tais como hidróxido de sódio e potássio e carbonatos tais como carbonato de sódio e carbonato de potássio. Em certos casos, é útil empregar extratores ácidos sustentados por polímero tais como *N,N*-diisopropiletilamina unida por polímero e 4-(dimetilamino)piridina unida por polímero. Sais de ácidos das aminas da Fórmula 3 podem também ser utilizados nesta reação, desde que pelo menos dois equivalentes do extrator ácido estejam presentes. Os ácidos típicos utilizados para formar sais com aminas incluem ácido clorídrico, ácido oxálico e ácido trifluoroacético. Em uma etapa subsequente, amidas da Fórmula 1a em que W é O podem ser

convertidas em tioamidas da Fórmula 1a em que W é S utilizando uma série de reagentes tiantes padrão tais como pentassulfeto de fósforo ou 2,4-dissulfeto de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano (reagente de Lawesson).

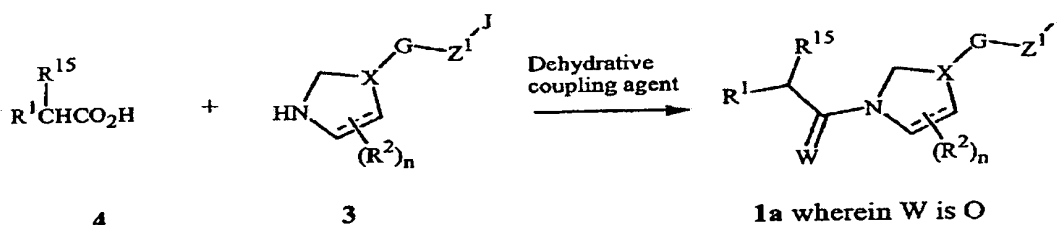
ESQUEMA 1



Um procedimento alternativo de preparação de compostos da Fórmula 1a em que W é O é ilustrado no Esquema 2 e envolve o acoplamento de um ácido da Fórmula 4 com uma amina da Fórmula 3 (ou seu sal) na presença de um reagente acoplador desidratante tal como diciclohexilcarbodiimida (DCC), cloridrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDC) ou hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il-N,N,N',N'-tetrametilurônio (HBTU). Reagentes sustentados por polímero são novamente úteis no presente, tais como ciclohexilcarbodiimida unida por polímero. Estas reações são tipicamente conduzidas a 0-40 °C em um solvente tal como diclorometano ou acetonitrila na presença de uma base tal como trietilamina ou N,N-diisopropiletilamina. Os ácidos da Fórmula 4 são conhecidos ou podem ser preparados por meio de métodos conhecidos dos técnicos no assunto. R¹CH₂COOH em que R¹ é um anel heteroaromático ligado por meio de nitrogênio pode ser preparado, por exemplo, por meio de reação do composto R¹H correspondente com um éster ou ácido haloacético na presença de base; vide, por exemplo, a Patente Norte-Americana nº 4.084.955. R¹CH₂COOH em que R¹ é fenila ou um anel heteroaromático ligado por meio de carbono pode ser preparado a partir dos compostos de R¹CH₂-halogênio correspondentes por meio de deslocamento do halogênio com cianeto seguido por hidrólise; vide, por exemplo, K. Adachi, *Yuki Gosei Kagaku Kyokaishi*, 1969, 27, 875-876; de

$R^1C(=O)CH_3$ por meio da reação de Willgerodt-Kindler; vide, por exemplo, H. R. Darabi et al, *Tetrahedron Letters* 1999, 40, 7549-7552 e M. M. Alam e S. R. Adapa, *Synthetic Communications* 2003, 33, 59-63 e referências ali mencionadas; ou de R^1Br ou R^1I por meio de acoplamento catalisado por paládio com acetato de *tert*-butila ou malonato de dietila, seguido por hidrólise de éster; vide, por exemplo, W. A. Moradi e S. L. Buchwald, *J. Am. Chem. Soc.* 2001, 123, 7996-8002 e J. F. Hartwig et al, *J. Am. Chem. Soc.* 2002, 124, 12557-12565.

ESQUEMA 2

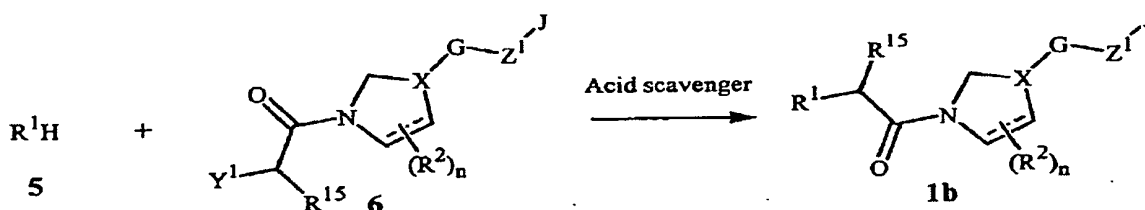


Como a literatura sintética inclui muitos métodos de formação de amida, os procedimentos sintéticos dos Esquemas 1 e 2 são apenas exemplos representativos de uma ampla variedade de métodos úteis de preparação de compostos da Fórmula 1. Os técnicos no assunto também compreendem que cloretos ácidos da Fórmula 2 podem ser preparados a partir de ácidos da Fórmula 4 por meio de diversos métodos bem conhecidos.

Certos compostos da Fórmula 1b (Fórmula 1 em que A é CHR^{15} e W é O) em que R^1 é um anel heteroaromático que contém nitrogênio com cinco membros ligado por meio do átomo de nitrogênio podem ser preparados por meio de reação do heterociclo original da Fórmula 5 e uma haloacetamida da Fórmula 6 conforme exibido no Esquema 3. A reação é conduzida na presença de uma base tal como hidreto de sódio ou carbonato de potássio em um solvente tal como tetraidrofuran, *N,N*-dimetilformamida ou acetonitrila a 0 até 80 °C. A haloacetamida da Fórmula 6 pode ser preparada por meio da reação de uma amina da Fórmula 3 com um haleto de ácido α -halo carboxílico ou um

ácido α -halo carboxílico ou seu anidrido, análogo às reações de formação de amida descritas nos Esquemas 1 e 2, respectivamente.

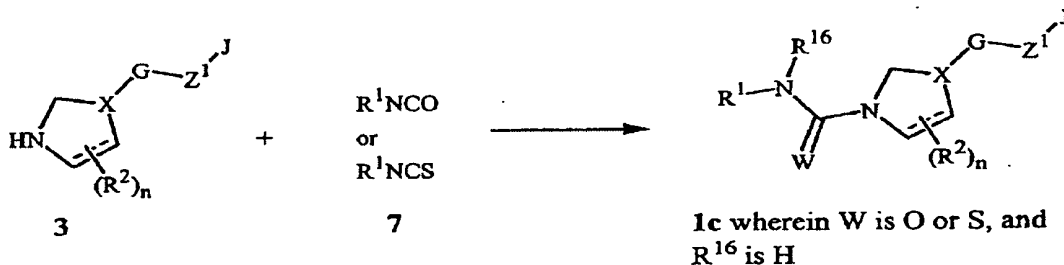
ESQUEMA 3



em que R^1 é um anel heteroaromático que contém nitrogênio com cinco membros não substituído sobre N; e Y^1 é Cl, Br ou I.

Compostos da Fórmula 1c (Fórmula 1 em que A é NH), em que R^1 é fenila, naftalenila ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros e W é O ou S, podem ser preparados por meio da reação de uma amina da Fórmula 3 com um isocianato ou isotiocianato, respectivamente, da Fórmula 7 conforme ilustrado no Esquema 4. Esta reação é tipicamente conduzida em uma temperatura ambiente em um solvente aprótico tal como diclorometano ou acetonitrila.

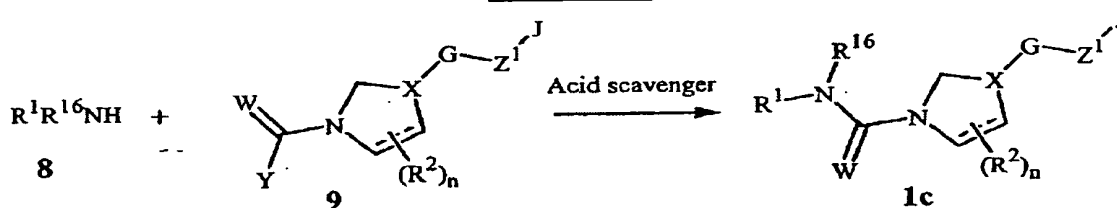
ESQUEMA 4



Os compostos da Fórmula 1c podem também ser preparados por meio de reação de uma amina da Fórmula 8 com um cloreto de carbamoila ou tiocarbamoila ou imidazol da Fórmula 9 conforme exibido no Esquema 5. Quando Y for cloro, a reação é tipicamente conduzida na presença de um extrator ácido. Extratores ácidos típicos incluem bases amina tais como trietilamina, *N,N*-diisopropiletilamina e piridina. Outros extratores incluem

hidróxidos tais como hidróxido de sódio e potássio e carbonatos tais como carbonato de sódio e carbonato de potássio. Os cloretos de carbamoila ou tiocarbamoila da Fórmula 9 (em que Y é Cl) podem ser preparados a partir de aminas da Fórmula 3 por meio de tratamento com fosgênio ou tiofosgênio, respectivamente, ou seus equivalentes, enquanto carbamoil ou tiocarbamoil imidazóis da Fórmula 9 (em que Y é imidazol-1-ila) podem ser preparados a partir de aminas da Fórmula 3 por meio de tratamento com 1,1'-carbonildiimidazol ou 1,1'-tiocarbonildiimidazol, respectivamente, de acordo com métodos gerais conhecidos dos técnicos no assunto.

ESQUEMA 5

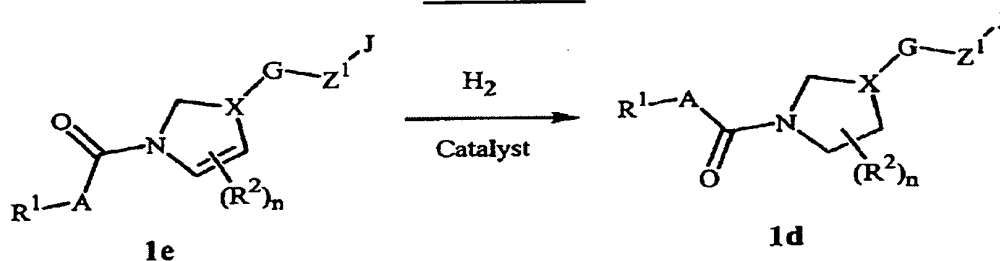


em que W é O ou S; e Y é Cl ou imidazol-1-ila.

Certos compostos da Fórmula 1d (ou seja, Fórmula 1 em que o anel que contém X é saturado) podem ser preparados a partir de compostos da Fórmula 1e em que o anel que contém X é insaturado por meio de hidrogenação catalítica, conforme exibido no Esquema 6. As condições típicas envolvem a exposição de um composto da Fórmula 1e a gás hidrogênio sob pressão de 70 a 700 kPa, preferencialmente 270 a 350 kPa, na presença de um catalisador metálico tal como paládio sustentado sobre um veículo inerte tal como carvão ativado, em uma razão em peso de 5 a 20% de metal para o veículo, suspenso em um solvente tal como etanol sob temperatura ambiente. Este tipo de redução é muito bem conhecido; vide, por exemplo, *Catalytic Hydrogenation*, L. Cerveny, Ed., Elsevier Science, Amsterdã, 1986. Os técnicos no assunto reconhecerão que algumas outras funcionalidades que podem estar presentes em compostos da Fórmula 1e podem também ser reduzidas sob

condições de hidrogenação catalítica, de forma a requerer uma seleção apropriada de catalisador e condições.

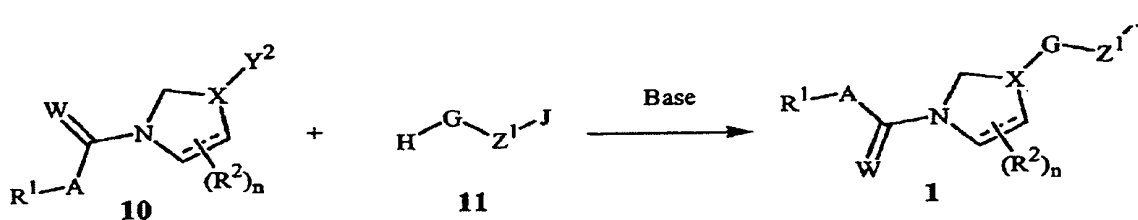
ESQUEMA 6



em que X é X¹, X², X⁵, X⁸ ou X⁹.

Certos compostos da Fórmula 1 em que X é X¹, X⁵, X⁷ ou X⁹ e G é ligado ao anel que contém X por meio de um átomo de nitrogênio podem ser preparados por meio de deslocamento de um grupo residual apropriado Y² sobre o anel que contém o X da Fórmula 10 com um heterociclo que contém nitrogênio da Fórmula 11 na presença de uma base conforme ilustrado no Esquema 7. Bases apropriadas incluem hidreto de sódio ou carbonato de potássio e a reação é conduzida em um solvente tal como *N,N*-dimetilformamida ou acetonitrila a 0 até 80 °C. Grupos residuais apropriados nos compostos da Fórmula 10 incluem brometo, iodeto, mesilato (OS(O)₂CH₃), triflato (OS(O)₂CF₃) e similares e compostos da Fórmula 10 podem ser preparados a partir dos compostos correspondentes em que Y² é OH, utilizando métodos gerais conhecidos na técnica.

ESQUEMA 7

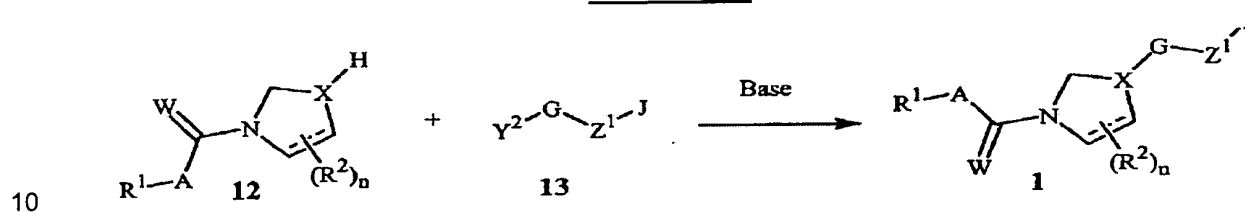


em que W é O ou S; X é X¹, X⁵, X⁷ ou X⁹; e Y² é um grupo residual tal como Br, I, OS(O)₂Me ou OS(O)₂CF₃.

Os compostos da Fórmula 1 em que X é X² ou X⁸ podem ser

preparados por meio de reação de um composto da Fórmula 12 com um triflato ou haleto heterocíclico ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$) da Fórmula 13 conforme exibido no Esquema 8. A reação é conduzida na presença de uma base tal como carbonato de potássio em um solvente como sulfóxido de dimetila, *N,N*-dimetilformamida ou acetonitrila a 0 até 80 °C. Os compostos da Fórmula 13 em que Y^2 é triflato podem ser preparados a partir de compostos correspondentes em que Y^2 é OH por meio de métodos conhecidos dos técnicos no assunto.

ESQUEMA 8



em que W é O ou S; X é X^2 ou X^8 ; e Y^2 é um grupo residual tal como Br, I, $\text{OS}(\text{O})_2\text{Me}$ ou $\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$.

Os compostos de amina da Fórmula 3 podem ser preparados a partir dos compostos de amina protegidos da Fórmula 14 em que Y^3 é um grupo protetor amina conforme exibido no Esquema 9. Uma ampla variedade de grupos protetores amina é disponível (vide, por exemplo, T. W. Greene e P. G. M. Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, segunda edição; Wiley: Nova Iorque, 1991) e o uso e seleção dos grupos protetores apropriados serão evidentes para os técnicos em síntese química. O grupo protetor pode ser removido e a amina isolada como seu sal ácido ou a amina livre por meio de métodos gerais conhecidos na técnica. Os técnicos no assunto também reconhecerão que as aminas protegidas da Fórmula 14 podem ser preparadas por meio de métodos análogos aos descritos nos Esquemas 6, 7 e 8 acima em que o grupo $\text{R}^1\text{AC}(=\text{W})$ é substituído por Y^3 para gerar intermediários úteis da Fórmula 14 para preparação de compostos da Fórmula 1.

15

20

25

em que Y^3 é um grupo protetor de amina.

Os compostos da Fórmula 14 podem também ser preparados por

5

15 com um composto adequadamente funcionalizado da Fórmula 16 conforme

exibido no Esquema 10. Os grupos funcionais Y^4 e Y^5 são selecionados, sem limitações, a partir de porções tais como aldeídos, cetonas, ésteres, ácidos,

amidas, tioamidas, nitrilas, aminas, álcoois, tióis, hidrazinas, oximas, amidinas,

10

metanossulfonatos, trifluorometanossulfonatos, ácidos borônicos, boronatos e

similares, que, sob as condições de reação apropriadas, permitirão a

construção dos vários anéis heterocíclicos G. A reação de um composto da

Fórmula 15 em que Y⁴ é um grupo tioamida com um composto da Fórmula 16

15

que G é um anel tiazol. A literatura sintética descreve muitos métodos

gerais de formação de anéis heteroaromáticos com cinco membros e anéis

heterocíclicos parcialmente saturados com cinco membros (tais como G-1

a G-59); vide, por exemplo, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, Vol. 4-

20

1984; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, Vol. 2-4, A. R. Katritzky, C.

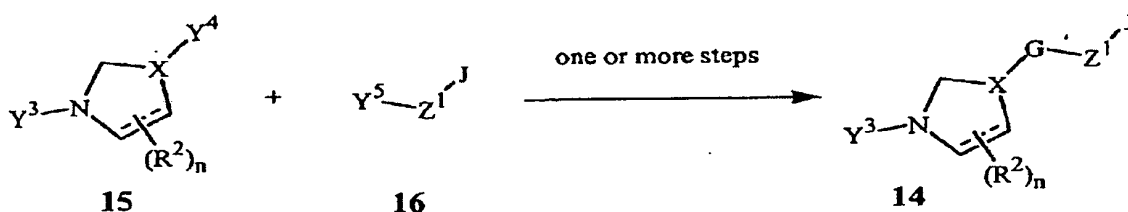
W. Rees e E. F. Scriven, editores, Pergamon Press, Nova Iorque, 1996; e a

série *The Chemistry of Heterocyclic Compounds*, E. C. Taylor, editor,

Wiley, Nova Iorque. Foi descrito o uso de intermediários da Fórmula 15 em

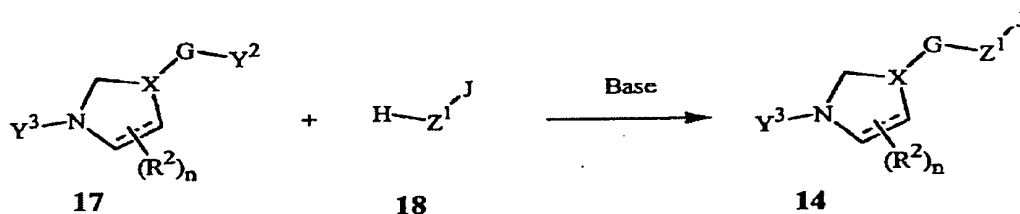
que X é X¹ e Y⁴ é Br, I, metanossulfonato ou trifluorometanossulfonato para preparar reagentes de organozinco para uso em reações de acoplamento cruzado com anéis aromáticos; vide, por exemplo, S. Bellotte, *Synlett* 1998, 379-380, e M. Nakamura et al, *Synlett* 2005, 1794-1798. Os técnicos no assunto sabem como selecionar os grupos funcionais apropriados para construir os anéis heterocíclicos desejados tais como G. Os compostos das Fórmulas 15 e 16 são conhecidos ou podem ser preparados pelos técnicos no assunto.

ESQUEMA 10



em que Y⁴ e Y⁵ são grupos funcionais apropriados para construção do heterociclo desejado G.

Certos compostos da Fórmula 14 em que Z¹ é O, S ou NR²¹ podem ser preparados por meio de deslocamento de um grupo residual apropriado Y² sobre G da Fórmula 17 com um composto da Fórmula 18 na presença de uma base conforme ilustrado no Esquema 11. As bases apropriadas incluem hidreto de sódio ou carbonato de potássio e a reação é conduzida em um solvente tal como *N,N*-dimetilformamida ou acetonitrila a 0 até 80 °C. Os grupos residuais apropriados nos compostos da Fórmula 17 incluem brometo, iodeto, mesilato (OS(O)₂CH₃), triflato (OS(O)₂CF₃) e similares. Os compostos da Fórmula 17 podem ser preparados a partir de compostos correspondentes em que Y² é OH por meio de métodos gerais conhecidos na técnica. Muitos dos compostos da Fórmula 18 são conhecidos ou podem ser preparados por meio de métodos gerais conhecidos na técnica.

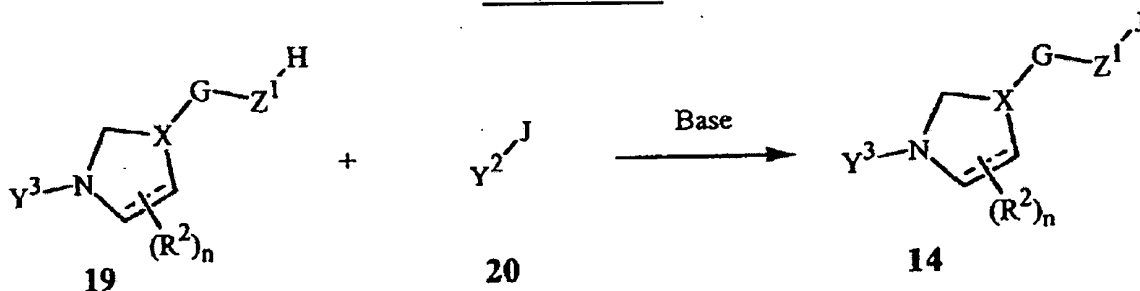
ESQUEMA 11

em que Y^2 é um grupo residual tal como Br, I, $\text{OS}(\text{O})_2\text{Me}$ ou $\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$; e Z^1 é O, S ou NR^{21} .

5 Certos compostos da Fórmula 14 em que Z^1 é O, S ou NR^{21} podem também ser preparados por meio de deslocamento de um grupo residual apropriado Y^2 sobre J da Fórmula 20 com um composto da Fórmula 19 na presença de uma base conforme ilustrado no Esquema 12. As bases apropriadas incluem hidreto de sódio ou carbonato de potássio e a reação é

10 conduzida em um solvente tal como *N,N*-dimetilformamida ou acetonitrila a 0 até 80 °C. Os grupos residuais apropriados nos compostos da Fórmula 20 incluem brometo, iodeto, mesilato ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CH}_3$), triflato ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$) e similares. Os compostos da Fórmula 20 podem ser preparados a partir de compostos correspondentes em que Y^2 é OH utilizando métodos gerais

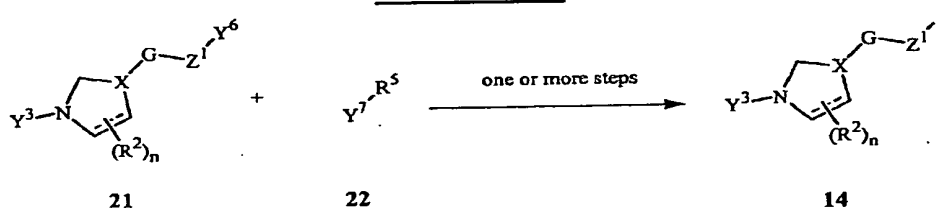
15 conhecidos na técnica.

ESQUEMA 12

em que Y^2 é um grupo residual tal como Br, I, $\text{OS}(\text{O})_2\text{Me}$ ou $\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$; e Z^1 é O, S ou NR^{21} .

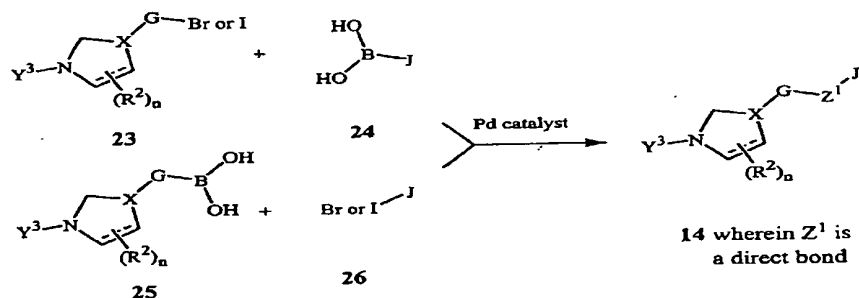
20 Os compostos da Fórmula 14 podem também ser preparados por meio de reação de um composto adequadamente funcionalizado da

Fórmula 21 com um composto adequadamente funcionalizado da Fórmula 22 conforme exibido no Esquema 13. Os grupos funcionais Y^6 e Y^7 são selecionados, mas sem limitações, a partir de porções tais como aldeídos, cetonas, ésteres, ácidos, amidas, tioamidas, nitrilas, aminas, álcoois, tióis, hidrazinas, oximas, amidinas, amida oximas, olefinas, acetilenos, haletos, haletos de alquila, metanossulfonatos, trifluorometanossulfonatos, ácidos borônicos, boronatos e similares, que, sob as condições de reação apropriadas, permitirão a construção dos vários anéis heterocíclicos J. A reação de um composto da Fórmula 21 em que Y^6 é uma porção cloro oxima com um composto da Fórmula 22 em que Y^7 é um grupo vinila ou acetileno na presença de uma base, por exemplo, gerará um composto da Fórmula 14 em que J é uma isoxazolina ou isoxazol, respectivamente. A literatura sintética inclui muitos métodos gerais de formação de anéis e sistemas de anéis carbocíclicos e heterocíclicos (tais como J-1 a J-82); vide, por exemplo, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, Vol. 4-6, A. R. Katritzky e C. W. Rees, editores, Pergamon Press, Nova Iorque, 1984; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, Vol. 2-4, A. R. Katritzky, C. W. Rees e E. F. Scriven, editores, Pergamon Press, Nova Iorque, 1996; a série *The Chemistry of Heterocyclic Compounds*, E. C. Taylor, editor, Wiley, Nova Iorque, e *Rodd's Chemistry of Carbon Compounds*, Vol. 2-4, Elsevier, Nova Iorque. Procedimentos gerais de cicloadição de óxidos de nitrila com olefinas são bem documentados na literatura química. Para referências relevantes, vide Lee, *Synthesis* 1982, 6, 508-509 e Kanemasa et al, *Tetrahedron* 2000, 56, 1057-1064, bem como as referências ali mencionadas. Os técnicos no assunto sabem como selecionar os grupos funcionais apropriados para construir o anel heterocíclico desejado J. Os compostos da Fórmula 22 são conhecidos ou podem ser preparados por meio de métodos gerais conhecidos na técnica.

ESQUEMA 13

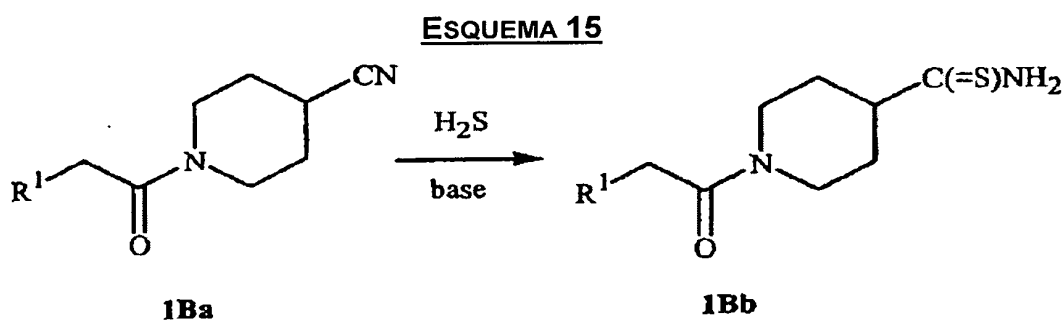
em que Y^6 e Y^7 são grupos funcionais apropriados para construção do heterociclo J desejado.

Uma preparação alternativa dos compostos da Fórmula 14 em que Z^1 é uma união inclui a bem conhecida reação de Suzuki que envolve acoplamento cruzado catalisado por Pd de um iodeto ou brometo da Fórmula 23 ou 26 com um ácido borônico da Fórmula 24 ou 25, respectivamente, conforme exibido no Esquema 14. Muitos catalisadores são úteis para este tipo de transformação; um catalisador típico é tetraquis(trifenilfosfina)paládio. Solventes tais como tetraidrofurano, acetonitrila, dietil éter e dioxano são apropriados. A reação de Suzuki e procedimentos de acoplamento relacionados oferecem muitas alternativas de criação da União G-J. Para referências importantes, vide, por exemplo, C. A. Zifcsak e D. J. Hlasta, *Tetrahedron* 2004, 60, 8991-9016. Para uma análise completa da química de paládio aplicável à síntese de uniões G-J, vide J. J. Li e G. W. Gribble, editores, *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist*, Elsevier: Oxford, Grã-Bretanha, 2000. Muitas variações de tipo de catalisador, base e condições de reação são conhecidas na técnica para este método geral.

ESQUEMA 14

Os técnicos no assunto reconhecerão que muitos compostos da Fórmula 1 podem ser preparados diretamente por meio de métodos análogos aos descritos nos Esquemas 10 a 14 acima em que o grupo Y^3 é substituído por $R^1AC(=W)$. Desta forma, os compostos correspondentes às Fórmulas 15, 17, 19, 21, 23 e 25 nos quais Y^3 é substituído por $R^1AC(=W)$ são intermediários úteis para a preparação de compostos da Fórmula 1.

Tioamidas da Fórmula 1Bb são intermediários particularmente úteis para a preparação de compostos da Fórmula 1 em que X é X^1 . Uma tioamida da Fórmula 1Bb pode ser preparada por meio da adição de sulfeto de hidrogênio à nitrila correspondente da Fórmula 1Ba conforme exibido no Esquema 15.



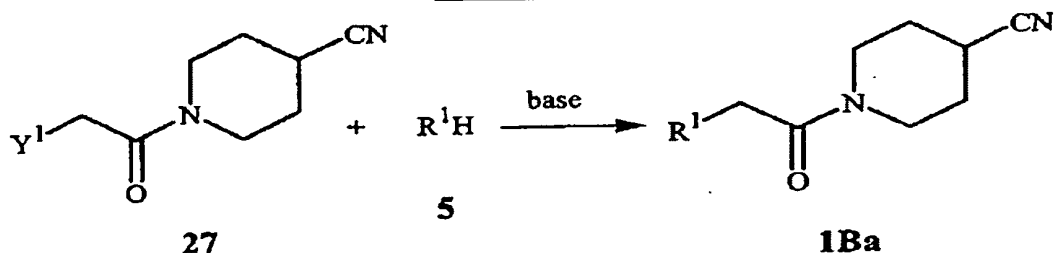
em que R^1 é conforme definido para a Fórmula 1.

O método do Esquema 15 pode ser conduzido por meio de contato de um composto da Fórmula 1Ba com sulfeto de hidrogênio na presença de uma amina tal como piridina, dietilamina ou dietanolamina. Alternativamente, sulfeto de hidrogênio pode ser utilizado na forma de seu sal de bissulfeto com um metal alcali ou amônia. Este tipo de reação é bem documentado na literatura (tal como A. Jackson et al, EP 696.581 (1996)).

Certos compostos da Fórmula 1Ba em que R^1 é um anel heteroaromático que contém nitrogênio com cinco membros ligado por meio de um átomo de nitrogênio podem ser preparados por meio de reação do heterociclo original da Fórmula 5 e uma halocetamida da Fórmula 27 conforme

exibido no Esquema 16. A reação é conduzida na presença de uma base tal como hidreto de sódio ou carbonato de potássio em um solvente tal como tetraidrofurano, *N,N*-dimetilformamida ou acetonitrila a 0 até 80 °C.

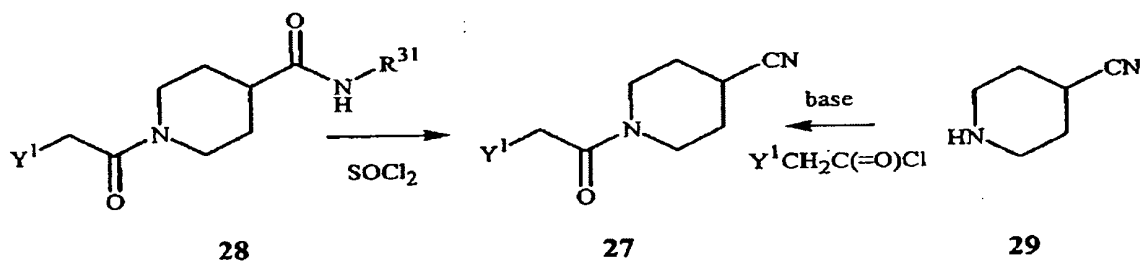
ESQUEMA 16



em que R^1 é um anel heteroaromático que contém nitrogênio com cinco membros não substituído sobre N (ou seja, um anel heteroaromático com cinco membros que compreende um membro de anel da fórmula $-(\text{NH})-$); e Y^1 é Cl, Br ou I.

As haloacetamidas da Fórmula 27 podem ser preparadas por meio dos dois métodos exibidos no Esquema 17.

ESQUEMA 17



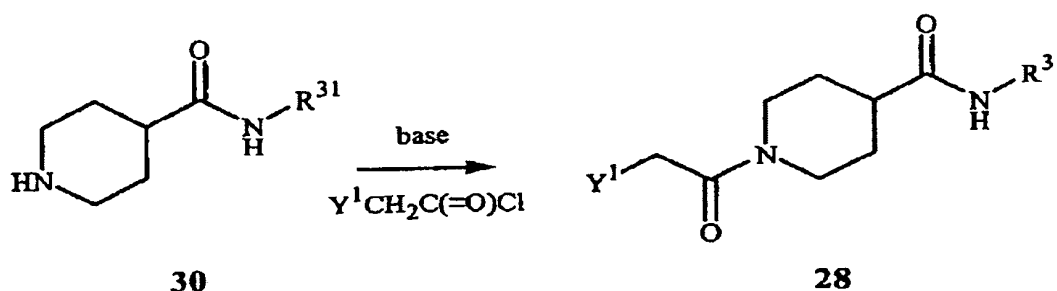
em que Y^1 é Cl, Br ou I; e R^{31} é um grupo alquila terciário tal como $-\text{C}(\text{Me})_3$.

Em um método, 4-cianopiperidina da Fórmula 29 é haloacetilada por meio de contato com o cloreto de haloacetila apropriado, tipicamente na presença de uma base de acordo com métodos padrão. As condições preferidas envolvem o uso de uma solução aquosa de uma base inorgânica tal como um fosfato, bicarbonato ou carbonato de metal álcali ou alcalino-terroso e um solvente orgânico não miscível em água tal como tolueno, acetato de etila

ou 1,2-dicloroetano. No segundo método ilustrado no Esquema 17, um derivado de isonipecotamida 1-(haloacetil)-*N*-substituído da Fórmula 28, em que R^{31} é alquila terciário tal como $C(Me)_3$, é desidratado utilizando um agente desidratante de amida padrão tal como cloreto de tionila ou oxicloreto de fósforo em um solvente apropriado. Um solvente particularmente preferido para esta transformação é uma *N,N*-dialquilamida tal como *N,N*-dimetilformamida. A reação é tipicamente conduzida por meio da adição de 0,9 a 2 equivalentes, preferencialmente 1,1 equivalentes, de oxicloreto de fósforo ou cloreto de tionila, a uma mistura de um composto da Fórmula 28 e 0,5 a 10 partes em peso de solvente, sob temperatura na qual a reação processa-se rapidamente durante a adição. O tempo de adição para esta reação é tipicamente de cerca de vinte a noventa minutos sob temperaturas típicas de cerca de 35 a 55 °C.

Conforme exibido no Esquema 18, os compostos da Fórmula 28 podem ser preparados a partir do composto da Fórmula 30 por meio de analogia com a reação de haloacetilação descrita para o Esquema 17.

ESQUEMA 18

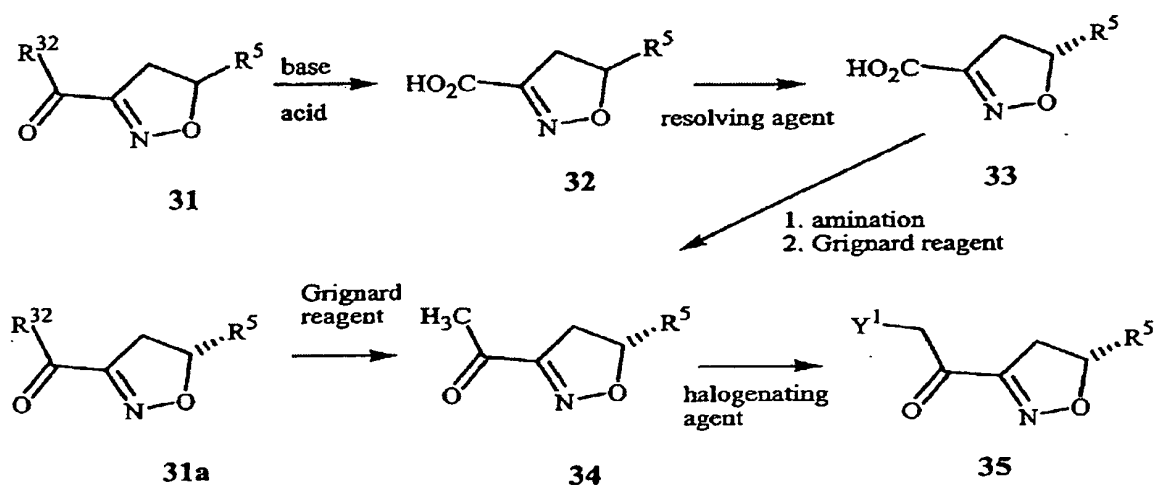


Os compostos da Fórmula 30 são conhecidos ou podem ser preparados a partir de 4-cianopiridina ou ácido isonicotínico utilizando métodos bem conhecidos na técnica; vide, por exemplo, G. Marzolph et al, DE 3.537.762 (1986) para a preparação de *N-t*-butil piridinocarboxamidas a partir de cianopiridinas e *t*-butanol e S. F. Nelsen et al, *J. Org. Chem.*, 1990, 55, 3825 para hidrogenação de *N*-metilisonicotinamida com um catalisador de platina.

Halometil isoxazol cetonas da Fórmula 35 são intermediários

particularmente úteis para a preparação de certos compostos quirais da
 Fórmula 1, em que J é, por exemplo, selecionado a partir de J-29-1 a J-29-12
 conforme exibido na Ilustração A. Halometil isoxazol cetonas da Fórmula 35
 podem ser preparadas por meio das seqüências de reação com múltiplas
 etapas exibidas no Esquema 19.

ESQUEMA 19



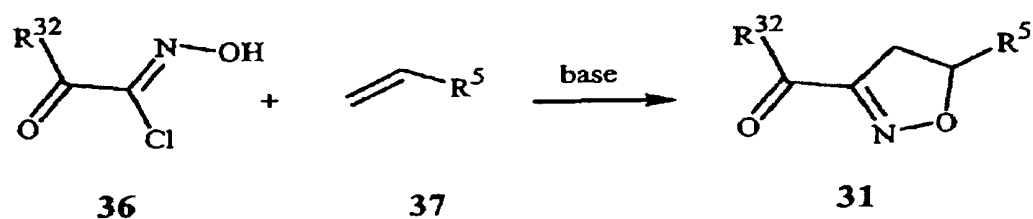
em que R^{32} é dialquilamino C_2-C_8 , haloalquilamino C_2-C_6 , 1-piperidinila, 1-pirrolidinila ou 4-morfolinila; e R^5 são conforme definido acima na

Descrição Resumida da Invenção.

A preparação dos ácidos carboxílicos racêmicos da Fórmula 32 pode ser realizada de acordo com os métodos bem conhecidos de hidrólise ácida ou básica dos compostos correspondentes da Fórmula 31, utilizando preferencialmente um leve excesso de hidróxido de sódio em um co-solvente miscível em água tal como metanol ou tetraidrofuran a cerca de 25 a 45 °C. O produto pode ser isolado por meio de ajuste do pH em cerca de 1 a 3 e filtragem ou extração em seguida, opcionalmente após a remoção do solvente orgânico por meio de evaporação. Os ácidos carboxílicos racêmicos da Fórmula 32 podem ser resolvidos por meio de cristalização fracional clássica de sais diaestereoméricos de bases de amina quiral apropriadas tais como

cinchonina, di-hidrocinchonina ou uma de suas misturas. Uma mistura de cinchonina e di-hidrocinchonina em razão de cerca de 85:15 é particularmente útil, pois ela fornece, por exemplo, os ácidos carboxílicos (*R*)-configurados da Fórmula 33, em que R^5 é um grupo fenila substituído, como o sal menos solúvel. Além disso, estas bases amina quirais são facilmente disponíveis em escala comercial. Os intermediários de halometil cetona (*R*)-configurados da Fórmula 35 geram os produtos finais mais ativos como fungicida da Fórmula 1 após acoplamento com tioamidas da Fórmula 1Bb. As halometil cetonas da Fórmula 35 podem ser preparadas por meio da reação, em primeiro lugar, das amidas correspondentes da Fórmula 31, seja na forma de enantiômeros puros (ou seja, Fórmula 31a) ou em misturas racêmicas ou enriquecidas enantiomericamente, com um equivalente molar de um haleto de metilmagnésio (reagente Grignard) em um solvente ou mistura de solventes apropriada tal como tetraidrofurano e tolueno a cerca de 0 a 20 °C e os produtos de cetona brutos da Fórmula 34 podem ser isolados por meio de resfriamento com ácido aquoso, extração e concentração. Em seguida, as cetonas brutas da Fórmula 34 são halogenadas com um reagente tal como cloreto de sulfurila para gerar as clorometil cetonas da Fórmula 35 em que Y^1 é Cl ou bromo molecular para gerar as bromometil cetonas correspondentes da Fórmula 35 em que Y^1 é Br. As halometil cetonas da Fórmula 35 podem ser purificadas por meio de cristalização a partir de um solvente tal como hexanos ou metanol, ou podem ser utilizadas sem purificação adicional na reação de condensação com tioamidas.

As isoxazol carboxamidas da Fórmula 31 podem ser preparadas por meio de cicloadição dos cloretos de hidroxamoíla correspondentes da Fórmula 36 com derivados de olefina da Fórmula 37, conforme exibido no Esquema 20.

ESQUEMA 20

Neste método, todos os três componentes de reação (os compostos das Fórmulas 36 e 37 e a base) são colocados em contato de forma a minimizar a hidrólise ou dimerização do cloreto de hidroxamoíla da Fórmula 36. Em um procedimento típico, a base, que pode ser uma base amina terciária tal como trietilamina ou uma base inorgânica tal como um carbonato, bicarbonato ou fosfato de metal álcali ou alcalino-terroso, é misturada com o derivado de olefina da Fórmula 37 e o cloreto de hidroxamoíla da Fórmula 36 é adicionado gradualmente sob temperatura em que a cicloadição processa-se em velocidade relativamente alta, tipicamente de 5 a 25 °C. Alternativamente, a base pode ser adicionada gradualmente aos outros dois componentes (os compostos das Fórmulas 36 e 37). Este procedimento alternativo é preferível quando o cloreto de hidroxamoíla da Fórmula 36 é substancialmente insolúvel no meio de reação. O solvente no meio de reação pode ser água ou um solvente orgânico inerte tal como tolueno, hexano ou mesmo o derivado de olefina utilizado em excesso. O produto pode ser separado do coproduto de sal por meio de filtragem ou lavagem com água, seguido por evaporação do solvente. O produto bruto pode ser purificado por meio de cristalização ou o produto bruto pode ser utilizado diretamente nos métodos do Esquema 19. Os compostos da Fórmula 31 são precursores úteis das metil cetonas correspondentes da Fórmula 34 e halometil cetonas da Fórmula 35 e são também úteis para a preparação dos enantiômeros resolvidos dos compostos das Fórmulas 34 e 35 por meio de hidrólise, resolução, síntese de metil cetona e halogenação, conforme exibido no Esquema 19.

Reconhece-se que alguns reagentes e condições de reação descritos acima para a preparação de compostos das Fórmulas 1, 1A, 1B e 1C podem não ser compatíveis com certas funcionalidades presentes nos intermediários. Nestes casos, a incorporação de seqüências de proteção e desproteção ou interconversões de grupos funcionais na síntese auxiliarão na obtenção dos produtos desejados. O uso e a seleção dos grupos protetores serão evidentes para os técnicos em síntese química (vide, por exemplo, T. W. Greene e P. G. M. Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, segunda edição; Wiley: Nova Iorque, 1991). Os técnicos no assunto reconhecerão que, em alguns casos, após a introdução de dado reagente conforme ilustrado em qualquer esquema individual, pode ser necessário realizar etapas sintéticas de rotina adicionais não descritas em detalhes para completar a síntese de compostos das Fórmulas 1, 1A, 1B e 1C. Os técnicos no assunto também reconhecerão que pode ser necessário realizar combinação das etapas ilustradas nos esquemas acima em ordem diferente da indicada pela seqüência específica apresentada para preparar os compostos das Fórmulas 1, 1A, 1B e 1C.

Os técnicos no assunto também reconhecerão que os compostos das Fórmulas 1, 1A, 1B e 1C e os intermediários descritos no presente podem ser submetidos a várias reações eletrofílicas, nucleofílicas, de radicais, organometálicas, de oxidação e de redução para adicionar substituintes ou modificar substituintes existentes.

Sem elaboração adicional, acredita-se que os técnicos no assunto, empregando a descrição acima, possam utilizar a presente invenção ao máximo possível. Os Exemplos a seguir devem, portanto, ser interpretados como meramente ilustrativos e não limitadores do relatório descritivo de nenhuma forma. As etapas nos Exemplos a seguir ilustram um procedimento para cada etapa em uma transformação sintética geral e o material de partida

para cada etapa pode não haver sido necessariamente preparado por meio de uma condução preparativa específica cujo procedimento é descrito em outros Exemplos ou Etapas. Os percentuais são em peso, exceto por misturas de solventes cromatográficos ou quando indicado em contrário. As partes e percentuais para misturas de solventes cromatográficos são em volume, a menos que indicado em contrário. Os espectros de NMR ^1H são relatados em ppm a partir de tetrametilsilano; “s” indica isolado, “d” indica dupla, “t” indica trio, “m” indica múltiplo, “q” indica quarteto, “br s” indica isolado amplo, “br d” indica duplo amplo, “br t” indica triplo amplo e “br m” indica múltiplo amplo.

EXEMPLO 1

Preparação de 4-[4-[4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]piperidina (Composto 1):

Etapa A: Preparação de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidinocarboxilato de 1,1-dimetiletila

A uma suspensão de 4-(4-formil-2-tiazolil)-1-piperidinocarboxilato de 1,1-dimetiletila (1,0 g, 3,4 mmol) em etanol (5 ml), adicionou-se uma solução aquosa de hidroxilamina (50% em peso, 0,25 ml, 4,0 mmol). A mistura de reação foi aquecida a 60 °C por uma hora, durante o quê a mistura de reação tornou-se homogênea. A solução resultante foi resfriada à temperatura ambiente e diluída com tetraidrofuran (10 ml). À mistura de reação, adicionou-se estireno (0,57 ml, 5 mmol), seguida pela adição parcelada de solução aquosa de hipoclorito de sódio Clorox® (10,5 ml) ao longo de três horas. A mistura de reação foi agitada por uma noite à temperatura ambiente e o sólido resultante foi filtrado, lavado com água e dietil éter e seco em ar para gerar o composto título na forma de pó branco (610 mg). O filtrado foi diluído com solução aquosa saturada de bicarbonato de sódio e extraída com dietil éter. O extrato foi seco (MgSO_4) e concentrado sob pressão reduzida para gerar 850 mg do composto título na forma de óleo amarelo. O óleo foi diluído com dietil

éter (4 ml) e mantido em repouso para gerar 233 mg adicionais do produto na forma de sólido branco.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,47 (s, 9H), 1,7 (m, 2H), 2,1 (m, 2H), 2,85 (m, 2H), 3,2 (m, 1H), 3,45 (m, 1H), 3,84 (m, 1H), 4,2 (br s, 2H), 5,75 (m, 1H), 7,25-7,40 (m, 5H), 7,61 (s, 1H).

Etapa B: Preparação de 4-[4-[4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidina

A uma solução de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidinocarboxilato de 1,1-dimetiletila (ou seja, o produto do Exemplo 1, Etapa A) (0,815 g, 1,97 mmol) em diclorometano (50 ml), adicionou-se uma solução de cloreto de hidrogênio em dietil éter (2 M, 10 ml, 20 mmol). A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por uma hora para gerar um precipitado em forma de goma. Adicionou-se metanol para dissolver o precipitado e a mistura de reação foi agitada por uma hora adicional. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida e repartida entre acetato de etila e solução aquosa saturada de bicarbonato de sódio e a camada orgânica foi seca (MgSO_4) e concentrada para gerar a amina livre na forma de um óleo transparente (0,31 g), que se solidificou em repouso. Uma mistura da amina livre resultante (0,31 g, 1,0 mmol), ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético (0,208 g, 1,0 mmol), cloridrato de 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida (0,25 g, 1,3 mmol), trietilamina (150 μl , 1,08 mmol) e uma quantidade catalítica de hidrato de 1-hidróxi-benzotriazol (cerca de 1 mg) em diclorometano (5 ml) foi agitada para formar um turbilhão e mantida à temperatura ambiente por dezesseis horas. A mistura de reação foi diluída com diclorometano (10 ml), lavada com 1 N ácido clorídrico aquoso e solução aquosa saturada de bicarbonato de sódio. A camada orgânica foi seca (MgSO_4) e concentrada sob pressão reduzida para gerar 0,47 g do produto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de espuma branca.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,8 (m, 2H), 2,2 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,9 (m, 1H),

3,3 (m, 2H), 3,42 (m, 1H), 3,85 (m, 1H), 4,05 (m, 1H), 4,55 (m, 1H), 4,98 (m, 2H), 5,75 (m, 1H), 6,33 (s, 1H), 7,25-7,42 (m, 5H), 7,63 (s, 1H).

Os compostos a seguir foram preparados por meio de procedimentos análogos à Etapa B do Exemplo 1:

5 - 1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[3-metil-5-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona (Composto 128):
NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,7-1,9 (m, 2H), 2,16 (m, 1H), 2,24 (m, 1H), 2,29 (s, 3H), 2,84-2,92 (br t, 1H), 3,30 (m, 2H), 3,43 (m, 1H), 3,86 (m, 2H), 4,59 (br d, 1H), 5,04 (s, 2H), 5,75 (m, 1H), 6,47 (s, 1H), 7,29-7,39 (m, 6H), 7,64 (s, 1H).

10 - 1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-etil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona (Composto 19):
ponto de fusão 128-133 °C (cristalizado a partir de acetato de metila/éter de petróleo): NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,28 (t, 3H), 1,8 (m, 2H), 2,2 (m, 2H), 2,62 (q, 2H), 2,9 (m, 1H), 3,3 (m, 2H), 3,42 (m, 1H), 3,85 (m, 1H), 4,05 (m, 1H), 4,55 (m, 1H),
15 4,98 (m, 2H), 5,75 (m, 1H), 6,33 (s, 1H), 7,25-7,42 (m, 5H), 7,63 (s, 1H).

 - 2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona (Composto 22): ponto de fusão 130-133 °C (cristalizada a partir de acetato de metila/éter de petróleo);
NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,8 (m, 2H), 2,2 (m, 2H), 2,9 (m, 1H), 3,3 (m, 2H), 3,42 (m,
20 1H), 3,85 (m, 2H), 4,55 (m, 1H), 5,10 (s, 2H), 5,77 (m, 1H), 6,95 (s, 1H), 7,25-7,42 (m, 5H), 7,64 (s, 1H).

 - 1-[4-[4-(2,3-di-hidrospiro[4*H*-1-benzopiran-4,5'(4'*H*)-isoxazol]-3'-il)-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona (Composto 137): NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,83 (m, 2H), 2,18 (m, 3H), 2,33
25 (s, 3H), 2,42 (m, 1H), 2,90 (m, 1H), 3,31 (m, 2H), 3,47 (d, 1H), 3,83 (d, 1H), 4,05 (m, 1H), 4,27 (m, 1H), 4,40 (m, 1H), 4,58 (d, 1H), 4,97 (m, 2H), 6,33 (s, 1H), 6,87 (d, 1H), 6,95 (dd, 1H), 7,21 (dd, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,67 (s, 1H).

 - 1-[4-[4-(2,3-di-hidrospiro[4*H*-1-benzotiopiran-4,5'(4'*H*)-

isoxazol]-3'-il)-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona (Composto 102): NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,82 (m, 2H), 2,23 (m, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,37 (m, 1H), 2,50 (m, 1H), 2,90 (m, 1H), 3,14 (m, 1H), 3,17 (m, 1H), 3,27 (m, 2H), 3,48 (d, 1H), 3,66 (d, 1H), 4,05 (m, 1H), 4,57 (d, 1H), 4,97 (m, 2H), 6,33 (s, 1H), 7,06 (m, 3H), 7,45 (d, 1H), 7,65 (s, 1H).

EXEMPLO 2

Preparação de 1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-[4-(5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]piperidina (Composto 2)

Etapa A: Preparação de monoclóridrato de 2-(4-piperidinil)-4-tiazolocarboxaldeído

A uma solução de 4-(4-formil-2-tiazolil)-1-piperidinocarboxilato de 1,1-dimetiletila (1,0 g, 3,4 mmol) em diclorometano (20 ml), adicionou-se uma solução de cloreto de hidrogênio em dietil éter (2,0 ml, 15 mol, 30 mmol). A mistura de reação foi agitada sob nitrogênio sob temperatura ambiente por duas horas e evaporada em seguida sob pressão reduzida para gerar 1,2 g do composto título na forma de sólido branco.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 2,31-2,38 (m, 2H), 2,44-2,50 (m, 2H), 3,11-3,20 (m, 2H), 3,36-3,44 (m, 1H), 3,57-3,65 (m, 2H), 8,14 (s, 1H), 10,01 (s, 1H).

Etapa B: Preparação de 4-(4-formil-2-tiazolil)-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]piperidina

A uma solução de ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-acético (0,8 g, 3,8 mmol) em diclorometano (10 ml), adicionou-se cloreto de oxalila (2,4 g, 19,2 mmol) e duas gotas de *N,N*-dimetilformamida, resultando em leve exotermicidade. A mistura de reação foi aquecida em seguida sob refluxo por quinze minutos. A mistura de reação foi concentrada a vácuo e o resíduo foi suspenso em tetraidrofurano (10 ml) e tratado com uma solução de monoclóridrato de 2-(4-piperidinil)-4-tiazolocarboxaldeído (ou seja, o produto do Exemplo 2, Etapa A) (1,1 g, 5,1 mmol) em tetraidrofurano (10 ml), seguida por

adição em gotas de trietilamina (1,2 g, 11,9 mmol). A mistura de reação foi agitada por uma noite à temperatura ambiente e repartida em seguida entre 1 N ácido clorídrico aquoso e acetato de etila. A camada orgânica foi separada e a camada aquosa foi extraída com acetato de etila adicional (2 x 30 ml). As camadas orgânicas combinadas foram lavadas com 1 N ácido clorídrico aquoso, solução aquosa saturada de bicarbonato de sódio e salmoura. A camada orgânica foi seca (MgSO₄) e evaporada sob pressão reduzida para gerar 0,8 g do composto título na forma de óleo amarelo.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,79-1,90 (m, 2H), 2,18-2,29 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,87-2,94 (m, 1H), 3,28-3,40 (m, 2H), 4,05-4,15 (m, 1H), 4,56-4,64 (m, 1H), 4,99-5,02 (m, 2H), 6,35 (s, 1H), 8,12 (s, 1H), 10,01 (s, 1H).

Etapa C: Preparação de 4-[4-[(hidroxiimino)metil]-2-tiazolil]-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]piperidina

A uma solução de 4-(4-formil-2-tiazolil)-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]piperidina (ou seja, o produto do Exemplo 2, Etapa B) (0,8 g, 2,07 mmol) em álcool etílico (15 ml), adicionou-se hidroxilamina (solução aquosa a 50%, 0,136 g, 4,1 mmol) e a mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por dez minutos. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida para gerar um óleo amarelo, que foi purificado por meio de cromatografia de coluna de flash sobre sílica gel utilizando acetato de etila a 50% em hexanos como eluente para gerar 0,7 g do composto título na forma de sólido branco.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,72-1,85 (m, 2H), 2,17-2,27 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,82-2,91 (m, 1H), 3,25-3,37 (m, 2H), 4,02-4,09 (m, 1H), 4,58-4,63 (m, 1H), 4,95-5,03 (m, 2H), 6,35 (s, 1H), 7,43 (s, 1H), 7,71 (s, 1H), 8,19 (s, 1H).

Etapa D: Preparação de 1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-[4-(5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]piperidina

4-[4-[(Hidroxiimino)metil]-2-tiazolil]-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-

pirazol-1-il]acetil]piperidina (ou seja, o produto do Exemplo 2, Etapa C) (0,2 g, 0,5 mmol) foi suspensa em tetraidrofurano (20 ml) e adicionou-se fenilacetileno (1,1 ml, 1 mmol), seguido por uma lenta adição em gotas de solução clareadora Clorox® (6,15% em peso de hipoclorito de sódio, 10 ml) por uma hora. A
 5 mistura de reação foi repartida entre solução aquosa saturada de bicarbonato de sódio e acetato de etila. A camada orgânica foi separada e a camada aquosa foi extraída com acetato de etila (3 x 30 ml). As camadas orgânicas combinadas foram lavadas com salmoura, secas (MgSO₄) e concentradas sob pressão reduzida para gerar um óleo, que foi purificado por meio de
 10 cromatografia de coluna de flash sobre sílica gel utilizando metanol a 10% em acetato de etila como eluente para gerar 70 mg do produto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de óleo amarelo claro.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,80-1,92 (m, 2H), 2,22-2,32 (m, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,90-2,98 (m, 1H), 3,31-3,41 (m, 2H), 4,05-4,11 (m, 1H), 4,58-4,65 (m,
 15 1H), 4,97-5,07 (m, 2H), 6,36 (s, 1H), 6,98 (s, 1H), 7,47-7,53 (m, 3H), 7,84 (s, 2H), 7,88 (m, 1H).

EXEMPLO 3

Preparação de 4-[4-(4,5-di-hidro-1-metil-5-fenil-1*H*-imidazol-2-il)-2-tiazolil]-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]piperidina (Composto 7)

20 A uma solução de 4-(4-formil-2-tiazolil)-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]piperidina (ou seja, o produto do Exemplo 2, Etapa B) (0,8 g, 2,07 mmol) em *tert*-butanol (5 ml), adicionou-se *N*¹-metil-1-fenil-1,2-etanodiamina (43,57 mg, 0,29 mmol). A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente sob uma atmosfera de nitrogênio por trinta minutos e,
 25 em seguida, adicionou-se carbonato de potássio (107,8 mg, 0,78 mmol) e iodo (43,57 mg, 0,33 mmol). A mistura de reação foi agitada a 70 °C por três horas e resfriada em seguida por meio de adição de solução aquosa saturada de sulfito de sódio até o quase completo desaparecimento da cor de iodo. A mistura de

reação foi extraída com clorofórmio e a camada orgânica foi lavada com solução aquosa saturada de bicarbonato de sódio e salmoura, seca (Na_2SO_4), filtrada e concentrada. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia preparativa de camada fina sobre sílica gel utilizando uma mistura de 94% de acetato de etila, 5% de metanol e 1% de trietilamina como eluente para gerar 64 mg do produto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de óleo.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,72-1,87 (m, 2H), 2,15-2,28 (m, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,86-2,92 (m, 1H), 2,97 (s, 3H), 3,26-3,37 (m, 2H), 3,62-4,39 (m, 2H), 4,0-4,6 (m, 2H), 4,93-5,05 (m, 2H), 6,31 (s, 1H), 7,30-7,41 (m, 5H), 7,88 (s, 1H).

EXEMPLO 4

Preparação de 4-[4-(4,5-di-hidro-3-fenil-5-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-[(5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il)acetil]piperidina (Composto 6)

Etapa A: Preparação de 4-(4-etenil-2-tiazolil)-1-piperidinocarboxilato de 1,1-dimetiletila

A uma suspensão fria (-50 °C) de brometo de metiltrifenilfosfônio (1,2 g, 3,3 mmol) em tetraidrofuran (5 ml), adicionou-se uma solução de bis(trimetilsilil)amida de sódio (3,4 ml, 3,4 mmol) e a mistura resultante foi agitada por uma hora à temperatura ambiente. A solução amarela opaca resultante foi novamente resfriada a -30 °C e adicionou-se 4-(4-formil-2-tiazolil)-1-piperidinocarboxilato de 1,1-dimetiletila (0,5 g, 1,68 mmol). A solução levemente amarela resultante foi agitada à temperatura ambiente por três horas, diluída em seguida com água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com salmoura, seca (MgSO_4), filtrada e purificada por meio de cromatografia de coluna sobre sílica gel utilizando 15 a 30% de acetato de etila em hexanos como eluente para gerar 471 mg do composto título na forma de óleo incolor.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,47 (s, 9H), 1,68 (m, 2H), 2,10 (m, 2H), 2,88

(m, 2H), 3,15 (m, 1H), 4,18 (m, 2H), 5,34 (d, 1H), 6,02 (d, 1H), 6,68 (dd, 1H), 6,99 (s, 1H).

Etapa B: Preparação de 4-(4-etenil-2-tiazolil)piperidina

A uma solução de 4-(4-etenil-2-tiazolil)-1-piperidinocarboxilato de 1,1-dimetiletila (ou seja, o produto do Exemplo 4, Etapa A) (471 mg, 1,6 mmol) em diclorometano (5 ml), adicionou-se uma solução de cloreto de hidrogênio em dietil éter (2,0 M, 7 ml, 14 mmol). A mistura de reação foi agitada sob nitrogênio à temperatura ambiente por quatro horas e, em seguida, adicionou-se uma solução aquosa de 1 N hidróxido de sódio até que o pH da mistura de reação aumentasse para cerca de 10. A mistura resultante foi extraída com diclorometano (2x). As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com salmoura, secas (MgSO_4), filtradas e concentradas a vácuo para gerar 302 mg do composto título na forma de óleo.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,70 (m, 2H), 1,82 (br s, 1H), 2,12 (br d, 2H), 2,76 (br t, 2H), 3,11 (m, 1H), 3,18 (m, 2H), 5,32 (d, 1H), 6,02 (d, 1H), 6,70 (dd, 1H), 6,99 (s, 1H).

Etapa C: Preparação de 4-(4-etenil-2-tiazolil)-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidina

A uma solução de ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético (0,5 g, 2,4 mmol) em diclorometano (4 ml), adicionou-se cloreto de oxalila (0,3 ml, 3,6 mmol) e uma gota de *N,N*-dimetilformamida, resultando em leve exotermicidade. A mistura de reação foi aquecida em seguida sob refluxo por quinze minutos. A mistura de reação foi evaporada e o resíduo resultante foi suspenso em diclorometano (4 ml) e tratado com uma solução de 4-(4-etenil-2-tiazolil)piperidina (ou seja, o produto do Exemplo 4, Etapa B) (302 mg, 1,5 mmol) em diclorometano (2 ml), seguido por adição de trietilamina (0,32 ml, 2,3 mmol). A mistura de reação foi agitada por uma noite à temperatura ambiente, concentrada em seguida e purificada por meio de cromatografia de

coluna sobre sílica gel utilizando acetato de etila a 30-40% em hexanos como eluente para gerar 414 mg do composto título na forma de sólido branco.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,78 (m, 2H), 2,18 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,90 (br t, 1H), 3,30 (m, 2H), 4,03 (d, 1H), 4,55 (d, 1H), 5,00 (m, 2H), 5,35 (d, 1H), 6,02 (d, 1H), 6,33 (s, 1H), 6,68 (dd, 1H), 7,01 (s, 1H).

Etapa D: Preparação de 4-[4-(4,5-di-hidro-3-fenil-5-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-[(5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il)acetil]piridina

A uma solução de benzaldeído oxima (49 mg, 0,4 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (3 ml), adicionou-se *N*-clorossuccinimida (54 mg, 0,4 mmol), seguida pela adição de 4-(4-etenil-2-tiazolil)-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidina (ou seja, o produto do Exemplo 4, Etapa C) (103 mg, 0,27 mmol) e trietilamina (41 mg, 0,4 mmol). A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente por cinco horas, diluída em seguida com água e extraída com diclorometano (2x). As camadas orgânicas foram combinadas, secas (MgSO_4) e filtradas. O filtrado foi concentrado e o resíduo foi purificado por meio de cromatografia de coluna sobre sílica gel utilizando acetato de etila a 55-70% em hexanos como eluente para gerar 90 mg do produto título, um composto de acordo com a presente invenção na forma de sólido branco.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,76 (m, 2H), 2,17 (m, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,88 (br t, 1H), 3,25 (m, 2H), 3,65 (m, 1H), 3,78 (m, 1H), 4,02 (br d, 1H), 4,56 (br d, 1H), 4,99 (m, 2H), 5,84 (dd, 1H), 6,32 (s, 1H), 7,28 (s, 1H), 7,40-7,42 (m, 3H), 7,69-7,71 (m, 2H).

EXEMPLO 5

Preparação de 1-[4-[4-[5-(2-clorofenil)-4,5-di-hidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (Composto 8)

A uma solução de 1-cloro-2-etenilbenzeno (0,035 g, 0,25 mmol), trietilamina (2,5 mg, 0,025 mmol) e solução aquosa de hipoclorito de sódio

Clorox® (1 ml, 16,1 mmol) em diclorometano (5 ml), adicionou-se 4-[4-
 [(hidroxiimino)metil]-2-tiazolil]-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-
 il]acetil]piperidina (ou seja, o produto do Exemplo 2, Etapa C (0,10 g, 0,25
 mmol) em diclorometano (5 ml) em gotas por uma hora a 0 °C. A mistura de
 5 reação foi mantida em agitação por uma hora, filtrada em seguida através de
 auxiliar de filtração diatomácea Celite® e concentrada sob pressão reduzida
 para gerar um óleo, que foi purificado por meio de cromatografia de coluna
 sobre sílica gel utilizando acetato de etila a 50% em hexano como eluente para
 gerar 73 mg do composto título na forma de espuma branca, que se funde a
 10 115-122 °C (cristalizada a partir de acetato de metila e éter de petróleo).

NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,74-1,80 (m, 2H), 2,14-2,22 (m, 2H), 2,32 (s,
 3H), 2,85-2,91 (m, 1H), 3,26-3,30 (m, 2H), 3,31-3,32 (m, 1H), 4,05-4,07 (m,
 1H), 4,55-4,58 (m, 1H), 4,93-5,03 (q, 2H), 6,01-6,06 (m, 1H), 6,331 (s, 1H),
 7,25-7,29 (m, 2H), 7,38-7,40 (m, 1H), 7,56-7,58 (m, 1H), 7,62 (s, 1H).

EXEMPLO 6

Preparação de 1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-
 1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanotona (Composto
 130)

Uma solução de 4-[4-[4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-
 20 [[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]piperidina (ou seja, o produto do
 Exemplo 1, Etapa B) (235 mg, 0,47 mmol) e pentassulfeto de fósforo (104,5
 mg, 0,235 mmol) em piridina (5 ml) foi aquecida sob refluxo por duas horas. A
 mistura de reação foi concentrada em seguida sob pressão reduzida e o resíduo
 foi distribuído entre diclorometano (10 ml) e água (10 ml). A camada orgânica
 25 foi lavada com 1 N ácido clorídrico, água, solução aquosa saturada de
 bicarbonato de sódio e salmoura, seca (MgSO₄) e concentrada sob pressão
 reduzida para gerar 240 mg do produto título, um composto de acordo com a
 presnete invenção, na forma de espuma branca.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,80-2,00 (m, 2H), 2,20-2,28 (m, 2H), 2,45 (s, 3H), 3,35-3,46 (3H, m), 3,50-3,61 (m, 1H), 3,80-3,88 (m, 1H), 4,70-4,80 (m, 1H), 5,30-5,33 (m, 2H), 5,35-5,40 (m, 1H), 5,74-5,80 (m, 1H), 6,32 (s, 1H), 7,30-7,40 (m, 5H), 7,65 (s, 1H).

5

EXEMPLO 7

Preparação de 1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperazinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona (Composto 154)

Etapa A: Preparação de 4-(aminotioxometil)-1-piperazino-carboxilato de 1,1-dimetiletila

10

A uma solução de tiocarbonildiimidazol (2,1 g, 11,8 mmol) em tetraidrofuran (30 ml) à temperatura ambiente, adicionou-se 1-piperazinocarboxilato de 1,1-dimetiletila (2 g, 10,75 mmol). A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por duas horas e aquecida em seguida a 55 °C por duas horas adicionais. A mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente e concentrada sob pressão reduzida até que permanecessem cerca de 20 ml de tetraidrofuran. O resíduo foi tratado em seguida com uma solução de 2 M de amônia em metanol (10 ml) e agitado à temperatura ambiente por 24 horas. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo foi triturado com dietil éter (25 ml) para gerar um precipitado branco. O precipitado foi filtrado e seco para gerar 1,5 g do composto título na forma de um sólido branco.

15

20

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,39 (s, 9H), 3,32 (m, 4H), 3,73 (m, 4H), 7,49 (br s, 2H).

Etapa B: Preparação de cloreto de 3-cloro-*N*-hidróxi-2-oxo-propanimidoíla

25

A uma solução de 1,3-dicloroacetona (100 g, 0,79 mol) em uma solução de 2 M de cloreto de hidrogênio em dietil éter (400 ml) a 15 °C, adicionou-se nitrito de *t*-butila (55 g, 0,534 mol) ao longo de dez minutos. O

progresso da reação foi monitorado por meio de NMR ^1H para obter conversão de cerca de 85% com não mais de 3% do subproduto de bis-nitrosação. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida para deixar um semi-sólido, que foi enxaguado completamente em seguida com *n*-BuCl. O sólido resultante foi recolhido sob filtragem para gerar 77 g do composto título na forma de sólido branco. O filtrado foi adicionalmente concentrado sob pressão reduzida para gerar um resíduo semi-sólido, que foi enxaguado com *n*-BuCl adicional. O sólido resultante foi recolhido sob filtragem para gerar 15 g adicionais do composto título na forma de um sólido branco.

NMR ^1H (DMSO- d_6) δ 4,96 (s, 2H), 13,76 (s, 1H).

Etapa C: Preparação de 2-cloro-1-(4,5-di-hidro-5-fenil)-3-isoxazolil)etanona

A uma mistura de estireno (6,79 g, 65,3 mmol) e bicarbonato de sódio (32,1 g, pó) em acetonitrila (100 ml), adicionou-se cloreto de 3-cloro-*N*-hidróxi-2-oxo-propanimidoíla (ou seja, o produto do Exemplo 7, Etapa B) (10 g, 64,1 mmol) em dez parcelas por vinte minutos. A mistura de reação foi agitada em seguida por uma hora adicional e filtrada. O sólido filtrado foi enxaguado com acetonitrila e os filtrados combinados foram concentrados sob pressão reduzida para deixar um óleo, que foi triturado em primeiro lugar com hexanos e, em seguida, com 1-clorobutano para gerar 13,6 g do composto título na forma de um sólido branco.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 3,13 (m, 1H), 3,66 (m, 1H), 4,96 (s, 2H), 5,83 (m, 1H), 7,34-7,44 (m, 5H).

Etapa D: Preparação de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperazinoacetato de 1,1-dimetiletila

A uma solução de 2-cloro-1-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)etanona (ou seja, o produto do Exemplo 7, Etapa C) (0,450 g, 2,018 mmol) e 4-(amino-tioxometil)-1-piperazinocarboxilato de 1,1-dimetiletila (ou

seja, o produto do Exemplo 7, Etapa A) (0,5 g, 2,04 mmol) em etanol (10 ml), adicionou-se trietilamina (0,204 g, 2,013 mmol) e a mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por doze horas. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo foi repartido entre acetato de etila (30 ml) e água (30 ml). A camada orgânica foi separada e lavada com salmoura (25 ml), seca (Na_2SO_4) e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo bruto foi purificado por meio de cromatografia de coluna utilizando acetato de etila a 20% em éter de petróleo como eluente para gerar 700 mg do composto título na forma de um sólido branco.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,48 (s, 9H), 3,30 (m, 1H), 3,54 (m, 8H), 3,74 (m, 1H), 5,71 (m, 1H), 6,91 (s, 1H), 7,40-7,29 (m, 5H).

Etapa E: Preparação de cloridrato de 1-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]piperazina

A uma solução de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperazinoacetato de 1,1-dimetiletila (ou seja, o produto do Exemplo 7, Etapa D) (0,7 g, 1,686 mmol) em dietil éter (10 ml), adicionou-se uma solução de 2 M de cloreto de hidrogênio em metanol (10 ml) à temperatura ambiente. A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por oito horas. O precipitado branco resultante foi filtrado e seco para gerar 500 mg do composto título na forma de um sólido branco.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 3,21 (m, 4H), 3,27 (m, 1H), 3,68 (m, 4H), 3,79 (m, 1H), 5,68 (m, 1H), 7,41-7,29 (m, 6H), 9,49 (br s, 2H).

Etapa F: Preparação de 1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperazinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona

A uma solução de cloridrato de 1-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]piperazina (ou seja, o produto do Exemplo 7, Etapa E) (200 mg, 0,57 mmol) e ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético (0,120 g,

0,57 mmol) em diclorometano (10 ml) à temperatura ambiente, adicionou-se cloridrato de 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida (0,110 g, 0,57 mmol), trietilamina (0,086 g, 0,85 mmol) e hidrato de 1-hidróxi-benzotriazol (0,020 g, 0,14 mmol). A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por 24 horas. A mistura de reação foi diluída com diclorometano (30 ml) e lavada com água (20 ml) e salmoura (20 ml). A camada orgânica foi seca (Na₂SO₄) e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo bruto foi purificado por meio de cromatografia de coluna utilizando metanol a 3% em clorofórmio como eluente para gerar 180 mg do produto título, um composto de acordo com a presnete invneção, na forma de sólido branco.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 2,32 (s, 3H), 3,29 (m, 1H), 3,52 (m, 2H), 3,61 (m, 2H), 3,79-3,72 (m, 5H), 4,98 (m, 2H), 5,69 (m, 1H), 6,33 (s, 1H), 6,93 (s, 1H), 7,38-7,28 (m, 5H).

Espectro de massa a 505,5 (M+1).

EXEMPLO 8

Preparação de 1-[4-[4-(3',4'-di-hidrospiro[isoxazol-5 (4*H*),1', (2'*H*)-naftalen]-3-il)-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona (Composto 37)

Etapa A: Preparação de 1-(2-cloroacetil)-4-piperidinocarbonitrila

Uma mistura de 4-piperidinocarbonitrila (200 g, 1,80 mol) e solução aquosa de carbonato de potássio a 40% (342 g, 0,99 mol) em diclorometano (1 ml) foi resfriada a -10 °C e adicionou-se uma solução de cloreto de cloroacetila (210 g, 1,86 mol) em diclorometano (300 ml) por cerca de 75 minutos, mantendo-se ao mesmo tempo a mistura de reação a -10 até 0 °C. Após o término da adição, a mistura de reação foi separada, a fase aquosa superior foi extraída com diclorometano (2 x 300 ml) e as fases orgânicas combinadas foram concentradas sob pressão reduzida para gerar 312 g do

composto título na forma de líquido que se cristalizou lentamente mediante repouso. Este composto apresentou pureza suficiente para uso em reações subseqüentes.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,8-2,1 (m, 4H), 2,95 (m, 1H), 3,5-3,8 (m, 4H),
5 4,08 (q, 2H).

Etapa A1: Preparação alternativa de 1-(2-cloroacetil)-4-piperidinocarbonitrila

Uma solução de *N*-(1,1-dimetiletil)-4-piperidinocarboxamida (201 g, 1,0 mol) em diclorometano (1 l) foi resfriada sob nitrogênio a -5 °C e
10 adicionou-se cloreto de cloroacetila (124 g, 1,1 mol) em 300 ml de diclorometano em gotas por trinta minutos, mantendo-se ao mesmo tempo a mistura de reação a 0 até 5 °C. Em seguida, adicionou-se solução aquosa de carbonato de potássio a 20% (450 g, 0,65 mol) em gotas por trinta minutos, mantendo-se ao mesmo tempo a temperatura de reação a 0 até 5 °C. A mistura
15 de reação foi agitada por trinta minutos adicionais a 0 °C e mantida em aquecimento em seguida à temperatura ambiente. As camadas foram separadas e a camada aquosa foi extraída com diclorometano (200 ml). As camadas de diclorometano combinadas foram concentradas sob pressão reduzida para gerar um sólido, que foi triturado com 400 ml de hexanos. A
20 calda foi filtrada e o aglomerado de filtração foi lavado com 100 ml de hexanos e seco em um forno a vácuo por uma noite a 50 °C para gerar 185,5 g de 1-(2-cloroacetil)-*N*-(1,1-dimetiletil)-4-piperidinocarboxamida na forma de um sólido, que se funde a 140,5-141,5 °C.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,35 (s, 9H), 1,6-2,0 (m, 4H), 2,25 (m, 1H), 2,8
25 (t, 1H), 3,2 (t, 1H), 3,9 (d, 1H), 4,07 (s, 2H), 4,5 (d, 1H), 5,3 (br s, 1H).

A uma solução de 1-(2-cloroacetil)-*N*-(1,1-dimetiletil)-4-piperidinocarboxamida (26,1 g, 0,10 mol) em *N,N*-dimetilformamida (35 ml), adicionou-se oxicloreto de fósforo (18,8 g, 0,123 mol) em gotas por trinta

minutos, mantendo-se ao mesmo tempo a temperatura da mistura de reação em elevação a 37 °C. A mistura de reação foi aquecida a 55 °C por uma hora e, em seguida, foi adicionada lentamente a água (cerca de 150 g) resfriada com gelo para manter uma temperatura de cerca de 10 °C. O pH da mistura de reação foi ajustado em 5,5 com solução aquosa de NaOH a 50%. A mistura foi extraída com diclorometano (4 x 100 ml) e o extrato combinado foi concentrado sob pressão reduzida para gerar 18,1 g do composto título na forma de um sólido. Este composto apresentou pureza suficiente para uso em reações subsequentes.

Etapa B: Preparação de 1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbonitrila

Uma solução de 3-metil-5-trifluorometilpirazol (9,3 g, 52 mmol) e solução aquosa de hidróxido de potássio a 45% (7,79 g, 62 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (25 ml) foi resfriada a 5 °C e adicionou-se 1-(2-cloroacetil)-4-piperidinocarbonitrila (ou seja, o produto do Exemplo 8, Etapa A ou A1) (11,2 g, 60 mmol). A mistura de reação foi agitada por oito horas a 5-10 °C, diluída com água em seguida (100 ml) e filtrada. O aglomerado de filtração foi lavado com água e seco a 50 °C em um forno a vácuo para gerar 15 g do composto título na forma de um sólido que contém 3% do seu regioisômero, ou seja, 1-[2-[3-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbonitrila.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,88 (m, 4H), 2,32 (s, 3H), 2,95 (m, 1H), 3,7 (m, 4H), 5,0 (q, 2H), 6,34 (s, 1H).

Etapa C: Preparação de 1-[2-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbonitrila

Gás sulfeto de hidrogênio foi passado para uma solução de 1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbonitrila (ou seja, o produto do Exemplo 8, Etapa B) (9,0 g, 30 mmol) e dietanolamina (3,15 g, 30 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (15 ml) a 50 °C em um frasco equipado com

condensador de gelo seco. A alimentação de sulfeto de hidrogênio foi suspensa quando a mistura de reação ficou saturada com sulfeto de hidrogênio, conforme indicado por meio de condensação sobre o dedo frio. A mistura de reação foi agitada por trinta minutos adicionais a 50 °C. Em seguida, pulverizou-se gás sulfeto de hidrogênio em excesso para o depurador por meio de um fluxo de nitrogênio abaixo da superfície e adicionou-se gradualmente água (70 ml). A mistura de reação foi resfriada a 5 °C, filtrada e lavada com água (2 x 30 ml). O aglomerado de filtração foi seco a 50 °C em um forno a vácuo para gerar 8,0 g do composto título na forma de um sólido, que se funde a 185-186 °C.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,7 (m, 2H), 2,0 (m, 2H), 2,29 (m, 3H), 2,65 (t, 1H), 3,0 (m, 3H), 3,2 (t, 1H), 4,0 (d, 1H), 4,6 (d, 1H), 4,96 (d, 1H), 5,4 (d, 1H), 6,35 (s, 1H), 7,4 (br s, 1H), 7,5 (br s, 1H).

Etapa D: Preparação de 1-[4-[4-(3',4'-di-hidrospiro[isoxazol-5 (4H),1', (2'H)-naftalen]-3-il)-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona

Uma solução de 1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidino-carbotioamida (ou seja, o produto do Exemplo 8, Etapa C) (0,5 g, 1,5 mmol), 2-cloro-1-(3',4'-di-hidrospiro[isoxazol-5 (4H),1', (2'H)-naftalen]-3-il)etanona (preparada por meio de um método análogo ao Exemplo 7, Etapa C) (0,4 g, 1,5 mmol) e brometo de tetrabutylamônio (0,030 g, 0,10 mmol) em tetraidrofuran (15 ml) foi agitada por uma noite à temperatura ambiente e aquecida em seguida a 55-60 °C por três horas. A mistura de reação foi diluída com água e extraída com diclorometano. O extrato foi lavado com salmoura, seca (MgSO₄) e concentrado sob pressão reduzida. O produto bruto foi adicionalmente purificado por meio de cromatografia de líquidos sob pressão média utilizando acetato de etila a 50% em hexanos como eluente para gerar 260 mg do produto título, um composto de acordo com a presente

invenção, na forma de sólido esbranquiçado que se funde a 81-84 °C.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,76-1,86 (m, 3H), 2,04-2,08 (m, 2H), 2,16-2,26 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,83-2,87 (m, 2H), 2,88-2,93 (m, 1H), 3,27-3,35 (m, 2H), 3,48-3,65 (m, 2H), 4,02-4,06 (m, 1H), 4,55-4,59 (m, 1H), 4,94-5,04 (q, 2H), 6,33 (s, 1H), 7,10-7,12 (m, 1H), 7,19-7,21 (m, 2H), 7,40-7,43 (m, 1H), 7,62 (s, 1H).

Os compostos a seguir foram preparados por meio de procedimentos análogos à Etapa D do Exemplo 8:

- 1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-metil-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona (Composto 15): ponto de fusão 97-100 °C (cristalizado a partir de acetato de metila/éter de petróleo); NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,74-1,80 (m, 1H), 1,81 (s, 3H), 2,14-2,20 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,85-2,91 (m, 1H), 3,26-3,32 (m, 2), 3,52-3,62 (m, 2H), 4,01-4,05 (m, 1H), 4,54-4,58 (m, 1H), 4,94-5,04 (q, 2H), 6,33 (s, 1H), 7,26-7,29 (m, 1H), 7,35-7,38 (m, 2H), 7,48-7,50 (m, 2H), 7,58 (s, 1H).

- 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-(3*a*,4,5,9*b*-tetraidronaft[2,1-*d*]isoxazol-3-il)-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona (Composto 16): ponto de fusão 162-165 °C (cristalizado a partir de acetato de metila/éter de petróleo); NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,79-1,85 (m, 2H), 2,00-2,05 (m, 2H), 2,20-2,26 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,68-2,72 (m, 2H), 2,88-2,94 (m, 1H), 3,30-3,35 (m, 2H), 3,92-3,98 (m, 1H), 4,06-4,10 (m, 1H), 4,58-4,60 (m, 1H), 4,94-5,06 (m, 2H), 5,58-5,60 (d, 1H), 6,34 (s, 1H), 7,17-7,20 (m, 1H), 7,28-7,30 (m, 2H), 7,47-7,49 (m, 1H), 7,72 (s, 1H).

- 1-[4-[4-(2,3-di-hidrospiro[1*H*-indeno-1,5'(4'*H*)-isoxazol]-3'-il)-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona (Composto 44): NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,77-1,84 (m, 2H), 2,17-2,25 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,61-2,68 (m, 1H), 2,90-2,96 (m, 2H), 3,12-3,20 (m, 1H), 3,31-3,35 (m, 2H), 3,54-3,75 (m, 2H), 4,04-4,10 (m, 1H), 4,56-4,60 (m, 1H), 4,94-5,04 (q, 2H), 6,34 (s, 1H), 7,28-7,30 (m, 3H), 7,37-7,38 (m, 1H), 7,64 (s, 1H).

- 1-[4-[4-[4,5-di-hidro-5-(4-metoxifenil)-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona (Composto 18): ponto de fusão 119-124 °C (cristalizado a partir de acetato de metila e éter de petróleo); NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,76-1,82 (m, 2H), 2,16-2,24 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,86-2,92 (m, 1H), 3,28-3,34 (m, 2H), 3,37-3,43 (m, 1H), 3,76-3,83 (m, 1H), 3,81 (s, 3H), 4,03-4,06 (m, 1H), 4,56-4,59 (m, 1H), 4,94-5,04 (q, 2H), 5,67-5,72 (m, 1H), 6,33 (s, 1H), 6,89-6,91 (d, 2H), 7,31-7,33 (d, 2H), 7,62 (s, 1H).

EXEMPLO 9

Preparação de 1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-(2-piridinil)-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona (Composto 98)

A uma solução de 1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbotoioamida (ou seja, o produto do Exemplo 8, Etapa C) (200 mg, 0,6 mmol) em tetraidrofuran (8 ml), adicionou-se cloreto de 3-cloro-*N*-hidróxi-2-oxopropanimidóila (ou seja, o produto do Exemplo 7, Etapa B) (93 mg, 0,6 mmol), seguido por brometo de tetrabutilamônio (15 mg, 0,05 mmol). A mistura de reação foi aquecida a 50 °C por quatro horas. A mistura de reação foi resfriada e concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo resultante, adicionou-se acetonitrila (8 ml) e bicarbonato de sódio em pó fino (151 mg, 1,0 mmol) seguido por 2-etenilpiridina (63 mg, 0,6 mmol) e a mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente por uma noite. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida e purificada por meio de cromatografia de flash sobre uma coluna de sílica gel (20 g) Varian Bond Elute SI® utilizando 0 a 75% de acetato de etila em hexanos como eluente para gerar 80 mg do produto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de semi-sólido amarelo.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,47-1,62 (m, 1H), 1,70-1,85 (m, 1H), 2,01-2,18 (m, 2H), 2,49 (s, 3H), 2,82 (t, 1H), 3,20-3,42 (m, 2H), 3,73 (dd, 1H), 3,82 (dd,

1H), 3,98 (d, 1H), 4,38 (d, 1H), 5,26 (m, 2H), 5,80 (dd, 1H), 6,50 (s, 1H), 7,38 (dd, 1H), 7,50 (d, 1H), 7,82 (t, 1H), 8,05 (s, 1H), 8,60 (d, 1H).

EXEMPLO 10

Preparação de 2-[5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona (Composto 107)

Etapa A: Preparação de *N,N*-dimetil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-sulfonamida

A uma solução de 3-trifluorometilpirazol (5,0 g, 36 mmol), trietilamina (7,0 ml, 50 mmol) em diclorometano (40 ml), adicionou-se cloreto de dimetilsulfamóila (5,5 ml, 51 mmol) e a mistura de reação foi aquecida sob refluxo por dois dias. A mistura resultante foi resfriada à temperatura ambiente e filtrada através de uma almofada de sílica gel utilizando diclorometano como eluente. O filtrado foi concentrado em seguida sob pressão reduzida para gerar um resíduo âmbar. O resíduo resultante foi dissolvido em dietil éter. A solução de éter foi lavada com água, seca (MgSO₄) e concentrada sob pressão reduzida para gerar 8,71 g do composto título.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 3,01 (s, 6H), 6,65 (s, 1H), 8,03 (s, 1H).

Etapa B: Preparação de 5-cloro-*N,N*-dimetil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-sulfonamida

Uma solução agitada de *N,N*-dimetil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-sulfonamida (ou seja, o produto do Exemplo 10, Etapa A) (4,0 g, 16 mmol) em tetraidrofuran (25 ml) foi resfriada a -78 °C e tratada em gotas em seguida com 2 M *n*-butil lítio em ciclohexano (8,6 ml, 17,2 mmol). A mistura de reação foi agitada por trinta minutos adicionais e, em seguida, adicionou-se em gotas uma solução de hexafluoroetano (4,2 g, 18 mmol) em tetraidrofuran (15 ml). A mistura de reação foi agitada por uma hora, aquecida à temperatura ambiente e resfriada com água (50 ml). A solução resultante foi extraída com diclorometano, seca (MgSO₄) e concentrada sob pressão reduzida para gerar

4,38 g de composto título. Este composto apresentou pureza suficiente para uso em reações subseqüentes.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 3,15 (s, 6H), 6,58 (s, 1H).

Etapa C: Preparação de 5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol

5 Uma solução de 5-cloro-*N,N*-dimetil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-sulfonamida (ou seja, o produto do Exemplo 10, Etapa B) (4,38 g, 15,8 mmol) e ácido trifluoroacético (2,7 ml, 35 mmol) foi agitada a 0 °C por uma hora e meia. A mistura de reação foi diluída com água (15 ml) e adicionou-se carbonato de sódio para elevar o pH para 12. A solução foi extraída com dietil éter, seca
10 (MgSO_4) e concentrada sob pressão reduzida para gerar 2,1 g do composto título. Este composto apresentou pureza suficiente para uso em reações subseqüentes.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 6,57 (m, 1H).

Etapa D: Preparação de 5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-
15 acetato de etila

A uma suspensão de 5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol (ou seja, o produto do Exemplo 10, Etapa C) (2,1 g, 12,3 mmol) e carbonato de potássio (3,6 g, 26,0 mmol) em 20 ml de *N,N*-dimetilformamida, adicionou-se bromoacetato de etila (2,1 ml, 18,8 mmol) e a mistura resultante foi agitada à
20 temperatura ambiente por doze horas. A mistura resultante foi diluída com acetato de etila, lavada com água e seca (MgSO_4). A mistura de reação foi concentrada a vácuo e purificada adicionalmente por meio de cromatografia de líquidos sob pressão média utilizando 0 a 50% de acetato de etila em hexanos como eluente para gerar 940 mg do composto título na forma de um óleo.

25 NMR ^1H (CDCl_3) δ 1,29 (m, 3H), 4,27 (q, 2H), 4,96 (m, 2H), 6,55 (s, 1H).

Etapa D1: Preparação alternativa de 5-cloro-3-(trifluorometil)-
1*H*-pirazol-1-acetato de etila

A uma solução de cloreto de alumínio (3,0 g, 22,5 mmol) em diclorometano (100 ml), adicionou-se em gotas uma solução de cloreto de trifluoroacetila (3 g, 22,6 mmol) em diclorometano (5 ml) mantendo ao mesmo a temperatura da mistura de reação abaixo de -30 °C. A mistura de reação foi agitada por quinze minutos a -50 °C. Em seguida, adicionou-se uma solução de cloreto de vinilideno (2,2 g, 22,7 mmol) em diclorometano (10 ml) em gotas por duas horas à mistura de reação. A mistura de reação foi agitada por duas horas adicionais a -50 °C e, em seguida, aquecida gradualmente à temperatura ambiente. A mistura de reação foi diluída com água e a camada aquosa foi extraída com diclorometano. As camadas orgânicas foram combinadas, secas (MgSO₄) e concentradas sob pressão reduzida para gerar 4,4-dicloro-1,1,1-trifluoro-3-buten-2-ona na forma de um óleo que foi utilizado na etapa seguinte sem purificação adicional.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 5,30 (s, 1H).

NMR ¹⁹F (CDCl₃) δ -63,6.

A uma mistura de hidrazinoacetato cloridrato de etila (2,8 g, 18,1 mmol) e trietilamina (9,2 g, 91 mmol) em uma solução de etanol (20 ml) e *N,N*-dimetilformamida (1 ml), adicionou-se uma solução de 4,4-dicloro-1,1,1-trifluoro-3-buten-2-ona bruta em diclorometano (20 ml) em gotas, mantendo-se ao mesmo tempo a temperatura da mistura de reação abaixo de 10 °C. Após agitação por duas horas adicionais a menos de 10 °C, a mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi diluído com dietil éter e a mistura foi filtrada. O filtrado resultante foi concentrado para gerar 4,34 g do composto título na forma de um sólido. Este composto possuía pureza suficiente para uso em reações subseqüentes.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,29 (t, 3H), 4,27 (q, 2H), 4,97 (s, 1H), 6,55 (s, 1H).

NMR ¹⁹F (CDCl₃) δ -63,4.

Etapa E: Preparação de ácido 5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-acético

Uma solução de 5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-acetato de etila (ou seja, o produto do Exemplo 10, Etapa D ou D1) (218 mg, 0,85 mmol) em tetraidrofuran (1 ml) foi tratada com uma solução aquosa a 50% em peso de hidróxido de sódio (0,2 ml) em água (0,6 ml). A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por quatro horas. A mistura de reação foi tratada com ácido clorídrico aquoso concentrado para reduzir o pH para 1 e extraída em seguida com acetato de etila. O extrato foi seco (MgSO₄) e concentrado sob pressão para gerar 140 mg do composto título. Este composto apresentou pureza suficiente para uso em reações subseqüentes.

NMR ¹H (DMSO-d₆) δ 5,41 (s, 2H), 7,09 (s, 1H).

Etapa F: Preparação de 2-[5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona

A uma solução de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidinocarboxilato de 1,1-dimetiletila (ou seja, o produto do Exemplo 1, Etapa A) (1,026 g, 2,48 mmol) em etanol (10 ml), adicionou-se uma solução de 2 M de cloreto de hidrogênio em dietil éter (4,2 ml, 12,6 mmol). A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por uma noite. Em seguida, a mistura de reação foi aquecida a 60 °C por duas horas. A mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente e concentrada sob pressão reduzida para gerar 0,710 g de cloridrato de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidina na forma de um sólido branco.

A ácido 5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-acético (ou seja, o produto do Exemplo 10, Etapa E) (0,14 g, 0,61 mmol) em diclorometano (5 ml), adicionou-se *N,N*-dimetilformamida (uma gota) seguida por cloreto de oxalila (0,07 ml, 0,80 mmol) à temperatura ambiente. A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por uma hora e, em seguida, concentrada sob pressão

reduzida. O cloreto de 5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-acetila bruto resultante foi absorvido em 5 ml de diclorometano e a solução resultante foi adicionada em gotas a uma mistura de cloridrato de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidina (0,20 g, 0,57 mmol) preparada acima e trietilamina (0,40 ml, 2,85 mmol) em 10 ml de diclorometano a 0 °C. A mistura de reação foi agitada por uma noite à temperatura ambiente e diluída em seguida com solução aquosa de 1,0 N ácido clorídrico. A camada orgânica foi separada, lavada com água, seca (MgSO₄), concentrada sob pressão reduzida e purificada por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão utilizando acetato de etila em hexanos como eluente para gerar 40 mg do produto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de um sólido que se funde a 128-131 °C.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,81 (m, 2H), 2,20 (m, 2H), 2,89 (m, 1H), 3,31 (m, 2H), 3,46 (m, 1H), 3,87 (m, 2H), 4,55 (m, 1H), 5,08 (m, 2H), 5,75 (m, 1H), 6,54 (s, 1H), 7,25-7,42 (m, 5H), 7,63 (s, 1H).

EXEMPLO 11

Preparação de 2-[5-bromo-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona (Composto 126)

Etapas A: Preparação de 5-bromo-*N,N*-dimetil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-sulfonamida

Uma solução agitada de *N,N*-dimetil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-sulfonamida (ou seja, o produto do Exemplo 10, Etapa A) (4,25 g, 17,5 mmol) em tetraidrofuran (50 ml) foi resfriada a -78 °C e, em seguida, foram adicionados 2 M de *n*-butil lítio em ciclohexano (10,0 ml, 20,0 mmol) em gotas. A mistura de reação foi agitada por trinta minutos adicionais e, em seguida, adicionou-se bromo em gotas (1,0 ml, 3,1 g, 18,7 mmol). A mistura de reação foi agitada por dez minutos, aquecida à temperatura ambiente e resfriada com salmoura (50 ml). A solução resultante foi extraída com dietil éter, seca

(MgSO₄) e concentrada sob pressão reduzida para gerar 6,77 g de composto título na forma de um óleo amarelo claro. Este composto apresentou pureza suficiente para uso em reações subseqüentes.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 3,15 (s, 6H), 6,69 (s, 1H).

5 Etapa B: Preparação de 5-bromo-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol

Uma solução de 5-bromo-*N,N*-dimetil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-sulfonamida (ou seja, o produto do Exemplo 11, Etapa A) (4,50 g, 14,0 mmol) e ácido trifluoroacético (2,0 ml, 26 mmol) foi agitada a 25 °C por quatro horas. A mistura de reação foi diluída com água (20 ml) e adicionou-se hidróxido de

10 sódio para elevar o pH para 12. A solução foi extraída com clorofórmio, seca (MgSO₄) e concentrada sob pressão reduzida para gerar 2,73 g do composto título na forma de óleo amarelo claro. Este composto apresentou pureza suficiente para uso em reações subseqüentes.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 6,63 (m, 1H).

15 Etapa C: Preparação de 5-bromo-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-acetato de etila

Uma suspensão de 5-bromo-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol (ou seja, o produto do Exemplo 11, Etapa B) (2,73 g, 12,7 mmol) e carbonato de potássio (2,0 g, 14,5 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (20 ml) foi tratada com

20 iodoacetato de etila (3,0 ml, 25,3 mmol) e a mistura resultante foi agitada a 95 °C por três horas. A mistura resultante foi diluída com acetato de etila, lavada com água e seca (MgSO₄). A mistura de reação foi concentrada a vácuo e purificada adicionalmente por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão utilizando 0 a 50% de acetato de etila em hexanos como eluente para

25 gerar 2,84 g do composto título na forma de um óleo marrom.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,29 (m, 3H), 4,26 (q, 2H), 5,00 (m, 2H), 6,64 (s, 1H).

Etapa D: Preparação de ácido 5-bromo-3-(trifluorometil)-1*H*-

pirazol-1-acético

Uma solução de 5-bromo-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-acetato de etila (ou seja, o produto do Exemplo 11, Etapa C) (2,84 g, 9,4 mmol) em tetraidrofuran (10 ml) foi tratada com uma solução aquosa a 50% em peso de solução de hidróxido de sódio (1,0 ml). A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por duas horas. A mistura de reação foi tratada com ácido clorídrico aquoso concentrado para reduzir o pH para 1 e extraída em seguida com acetato de etila. O extrato foi seco (MgSO₄) e concentrado sob pressão para gerar 2,26 g do composto título na forma de um sólido marrom claro. Recristalização a partir de 1-clorobutano (20 ml) gerou 0,68 g do composto título na forma de placas rosa claro lustrosas.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 5,08 (s, 2H), 6,65 (s, 1H).

Etapa E: Preparação de 2-[5-bromo-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazóli)-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona

A uma solução de ácido 5-bromo-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-acético (ou seja, o produto do Exemplo 11, Etapa D) (0,12 g, 0,61 mmol) em diclorometano (5 ml), adicionou-se *N,N*-dimetilformamida (uma gota) seguida por cloreto de oxalila (0,25 ml, 2,86 mmol). A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por uma hora e concentrada em seguida sob pressão reduzida. O resíduo que contém cloreto ácido bruto foi absorvido em diclorometano (5 ml) e a solução foi adicionada em gotas a uma mistura de cloridrato de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1-piperidina (ou seja, o produto do Exemplo 10, Etapa F) (0,15 g, 0,43 mmol) e trietilamina (0,25 ml, 1,8 mmol) em diclorometano (5 ml) a 0 °C. A mistura de reação foi mantida em aquecimento à temperatura ambiente e agitada em seguida por uma noite à temperatura ambiente. A mistura foi repartida em seguida entre solução aquosa de 1,0 N ácido clorídrico e diclorometano. A camada orgânica foi lavada com

água, seca (MgSO₄), concentrada sob pressão reduzida e purificada por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão utilizando acetato de etila em hexanos como eluente para gerar 90 mg do produto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido amorfo.

5 NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,84 (m, 2H), 2,20 (m, 2H), 2,89 (m, 1H), 3,31 (m, 2H), 3,46 (m, 1H), 3,89 (m, 2H), 4,58 (m, 1H), 5,11 (m, 2H), 5,75 (m, 1H), 6,63 (s, 1H), 7,25-7,42 (m, 5H), 7,66 (s, 1H).

EXEMPLO 12

Preparação de 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona
10 (Composto 3)

Etapa A: Preparação de 4,5-di-hidro-*N,N*-dimetil-5-fenil-3-isoxazolocarboxamida

A uma solução de cloreto de 2-(dimetilamino)-*N*-hidróxi-2-oxoetanimidoíla (preparada de acordo com o procedimento de E. Raleigh,
15 Patente Norte-Americana nº 3.557.089 (6,0 g, 40 mmol), estireno (6,0 g, 60 mmol) em tolueno (15 ml), adicionou-se uma solução de hidrogênio carbonato de potássio (5,0 g, 50 mmol) em água (25 ml) por uma hora, mantendo ao mesmo tempo a temperatura de reação de 7 a 10 °C. A mistura de reação foi
20 diluída com 10 ml de tolueno e agitada por dez minutos adicionais. A camada orgânica foi separada e lavada com água. A camada orgânica foi concentrada sob pressão reduzida até que não restasse estireno para gerar 8,7 g do composto título na forma de um óleo amarelo claro. Este composto apresentou pureza suficiente para uso em reações subseqüentes.

25 NMR ¹H (CDCl₃) δ 3,08 (s, 3H), 3,32 (s, 3H), 3,35 (dd, 1H), 3,71 (dd, 1H), 5,65 (dd, 1H), 7,35 (m, 5H).

Etapa B: Preparação de ácido 4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolocarboxílico

A uma solução de 4,5-di-hidro-*N,N*-dimetil-5-fenil-3-isoxazolocarboxamida (ou seja, o produto do Exemplo 12, Etapa A) (60,0 g, 275 mmol) em metanol (300 ml), adicionou-se uma solução aquosa de hidróxido de sódio (44 g de NaOH aquoso a 50% em 50 ml de água) em gotas por trinta minutos, mantendo-se ao mesmo tempo a temperatura da mistura de reação em 45 °C. A mistura de reação foi mantida em resfriamento à temperatura ambiente e agitada por uma noite. A mistura resultante foi concentrada sob pressão reduzida e tratada com 200 ml de água. O pH da mistura de reação foi ajustado utilizando ácido clorídrico concentrado em cerca de 1,0. O produto bruto foi extraído em acetato de etila (200 ml). A solução de acetato de etila foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo foi triturado com hexanos. O precipitado resultante foi filtrado, lavado com hexanos (2 x 20 ml) e seco a vácuo para gerar 46,5 g do composto título na forma de um sólido.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 3,25 (dd, 1H), 3,75 (dd, 1H), 5,85 (dd, 1H), 7,35 (m, 5H), 8,1 (br s, 1H).

Etapa C: Preparação do sal de cinchonina de ácido (5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolocarboxílico

Uma mistura de ácido 4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolocarboxílico racêmico (ou seja, o produto de Exemplo 12, Etapa B) (9,5 g, 50 mmol) em metanol (70 ml) foi aquecida a 55 °C e cinchonina (contendo cerca de 15% de di-hidrocinchonina, 14,5 g, 50 mmol) foi adicionada ao longo de vinte minutos, mantendo-se a temperatura da mistura de reação de 53 a 57 °C. A mistura de reação foi mantida em resfriamento à temperatura ambiente por sessenta minutos e, em seguida, adicionou-se água (35 ml) em gotas por trinta minutos. A calda resultante foi resfriada a 10 °C e filtrada. O aglomerado de filtragem foi lavado por duas vezes com 10 ml de metanol a 25% em água e seco em ar para gerar 8,52 g do composto título na forma de um sólido. A razão diaestereomérica do produto foi determinada utilizando análise de

cromatografia de líquidos em alto desempenho quiral (HPLC) em uma coluna HPLC OD Daicel Chiralcel® como sendo de cerca de 99:1.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 3,25 (dd, 1H), 3,75 (dd, 1H), 5,85 (dd, 1H), 7,35 (m, 5H), 8,1 (br s, 1H).

5 Etapa D: Preparação de (5*R*)-4,5-di-hidro-*N,N*-dimetil-5-fenil-3-isoxazolocarboxamida

O sal de cinchonina de ácido (5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolocarboxílico (ou seja, o produto do Exemplo 12, Etapa C) (excesso diaestereomérico de 98%, 16,5 g, 34,3 mmol) foi colocado em calda em uma
10 mistura de 1 N ácido clorídrico (90 ml), ciclohexano (100 ml) e acetato de etila (40 ml). Após a dissolução de todos os sólidos, as fases foram separadas e a camada orgânica foi lavada com salmoura (20 ml) e concentrada sob pressão reduzida para gerar 5,6 g de sólido branco. A uma solução do ácido livre resultante (5,0 g, 26,2 mmol) em acetato de etila (100 ml) à temperatura
15 ambiente, adicionou-se *N,N*-dimetilformamida (uma gota), seguida por cloreto de tionila (4,25 g, 35,7 mmol). A mistura de reação foi aquecida em seguida sob refluxo por três horas. A mistura resultante foi resfriada e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo que contém cloreto ácido bruto foi dissolvido em acetato de etila (25 ml) e esta solução foi adicionada em parcelas a uma mistura
20 previamente resfriada (5 °C) de dimetilamina em tetraidrofurano (29 ml de uma solução de 2,0 M), mantendo ao mesmo tempo a temperatura da mistura em 5 a 10 °C. Ao término da adição, a mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida e diluída com água (50 ml). O precipitado resultante foi filtrado, lavado com água e seco por sucção por uma noite para gerar 4,1 g do
25 composto título na forma de um sólido marrom claro, que se funde a 59-61 °C. Este composto apresentou pureza suficiente para uso em reações subsequentes.

Etapa E: Preparação de 2-bromo-1-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-

fenil-3-isoxazolil]etanona

Uma solução de (5*R*)-4,5-di-hidro-*N,N*-dimetil-5-fenil-3-isoxazolocarboxamida (ou seja, o produto do Exemplo 12, Etapa D) (3,5 g, 16,0 mmol) em uma mistura de tetraidrofuran (5 ml) e tolueno (10 ml) foi resfriada a -15 °C e brometo de metil magnésio (solução de 3,0 M em tetraidrofuran, 8,8 ml, 26,4 mmol) foi adicionada por uma hora a -15 °C. Em seguida, a mistura de reação foi despejada ao longo de uma mistura de 20 g de ácido clorídrico concentrado e 80 g de gelo e a fase orgânica foi separada. A fase aquosa foi extraída com acetato de etila (100 ml) e o extrato combinado foi lavado com salmoura (40 ml) e concentrado sob pressão reduzida para gerar 3,2 g de 1-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazoil]etanona.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 2,55 (s, 3H), 3,17 (dd, 1H), 3,54 (dd, 1H), 5,75 (dd, 1H), 7,35 (m, 5H).

1-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazoil]etanona (3,2 g, 16,7 mmol) foi dissolvida em 1,2-dicloroetano (15 ml) e uma solução de bromo (2,13 g, 13,3 mmol) em dicloroetano (5 ml) foi adicionada por trinta minutos, mantendo-se ao mesmo tempo a temperatura da mistura de reação em cerca de 30 °C. A mistura de reação foi diluída com água (10 ml) e a camada orgânica foi concentrada sob pressão reduzida e purificada por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão utilizando 35% de diclorometano em hexanos como eluente para gerar 2,6 g do composto título na forma de um sólido branco, que se funde a 31-33 °C.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 3,20 (dd, 1H), 3,60 (dd, 1H), 4,49 (s, 2H), 5,80 (dd, 1H), 7,35 (m, 5H).

Etapa E1: Preparação alternativa de 2-bromo-1-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)etanona

A uma solução de 4,5-di-hidro-*N,N*-dimetil-5-fenil-3-isoxazolocarboxamida (ou seja, o produto do Exemplo 12, Etapa A) (17 g, 78,0

mmol) em uma mistura de tetraidrofuran (20 ml) e tolueno (80 ml), adicionou-se brometo de metil magnésio (solução 3,0 M em tetraidrofuran, 28 ml, 84 mmol) por uma hora, mantendo-se ao mesmo tempo a temperatura de reação de -10 a -15 °C. A mistura de reação foi despejada sobre uma mistura de ácido clorídrico concentrado (20 g) e gelo (80 g) e a fase orgânica foi separada. A fase aquosa foi extraída com acetato de etila (100 ml) e os extratos orgânicos combinados foram lavados com salmoura (40 ml) e concentrados sob pressão reduzida para gerar 14,4 g de 1-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazoil)etanona na forma de um óleo amarelo claro.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 2,55 (s, 3H), 3,17 (dd, 1H), 3,54 (dd, 1H), 5,75 (dd, 1H), 7,35 (m, 5H).

1-(4,5-Di-hidro-5-fenil-3-isoxazoil)etanona (11,5 g, 60 mmol) foi dissolvida em acetato de etila (45 ml) e uma solução de bromo (9,6 g, 60,0 mmol) em acetato de etila (30 ml) foi adicionada por trinta minutos, mantendo-se ao mesmo tempo a temperatura da mistura de reação em cerca de 30 °C. Após uma hora, a mistura de reação foi diluída com água (10 ml) e a camada orgânica foi concentrada sob pressão reduzida para gerar 16,7 g de óleo avermelhado que continha cerca de 10% de metil cetona inicial e cerca de 10% de cetona dibromada.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 3,20 (dd, 1H), 3,60 (dd, 1H), 4,49 (s, 2H), 5,80 (dd, 1H), 7,35 (m, 5H).

Etapa F: Preparação de 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona

Uma mistura de 1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbotioamida (ou seja, o produto do Exemplo 8, Etapa C) (1,7 g, 5,0 mmol) e 2-bromo-1-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]etanona (ou seja, o produto do Exemplo 12, Etapa E ou E1) (1,35 g, 5 mmol) em etanol (15

ml) foi aquecida a 50 °C por trinta minutos. A mistura de reação foi diluída com água e extraída com diclorometano. O extrato foi lavado com salmoura, seco (MgSO₄) e concentrado sob pressão reduzida para gerar o produto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de uma goma amarela clara. Análise de cromatografia de líquidos de alto desempenho (HPLC) demonstrou que o produto título possuía pureza de cerca de 95% e continha o enantiômero (*R*) em excesso enantiomérico de cerca de 98%.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 1,8 (m, 2H), 2,2 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,9 (m, 1H), 3,3 (m, 2H), 3,42 (dd, 1H), 3,82 (dd, 1H), 4,05 (m, 1H), 4,6 (m, 1H), 5,0 (q, 2H), 5,78 (dd, 1H), 6,35 (s, 1H), 7,4 (m, 5H), 7,62 (s, 1H).

EXEMPLO 13

Preparação de 1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-3,6-di-hidro-1 (2*H*)-piridinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona (Composto 217)

Etapa A: Preparação de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]piridina

A uma solução de tioisonicotinamida (0,5 g, 3,6 mmol) em 1-metil-2-pirrolidinona (25 ml), adicionou-se 2-cloro-1-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)etanona (0,807 g, 3,6 mmol) à temperatura ambiente. A mistura de reação foi aquecida em seguida a 100 °C por três horas. A mistura de reação foi então resfriada à temperatura ambiente, resfriada com água (100 ml), extraída com acetato de etila (50 ml x 2). A mistura de reação foi diluída com água (50 ml) e salmoura (50 ml) e a camada orgânica foi concentrada sob pressão reduzida e purificada por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão utilizando 2% de metanol em clorofórmio como eluente para gerar 0,7 g do composto título na forma de um sólido marrom.

NMR ¹H (CDCl₃) δ 3,5 (m, 1H), 3,9 (m, 1H), 5,8 (m, 1H), 7,35 (m, 5H), 8,16 (s, 1H), 8,3 (d, 2H), 8,8 (d, 2H).

Etapa B: Preparação de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1,2,3,6-tetraidro-1-(fenilmetil)piridina

A uma solução de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]piridina (ou seja, o produto do Exemplo 13, Etapa A) (0,60 g, 1,95 mmol) em tolueno (10 ml), adicionou-se brometo de benzila (0,670 g, 3,90 mmol) e a mistura de reação foi aquecida a 100 °C por doze horas. Em seguida, a mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente. O sólido precipitado foi filtrado e seco. O sólido foi dissolvido em metanol (10 ml) e adicionou-se boroidreto de sódio (0,072 g, 1,95 mmol) em parcelas. A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por duas horas, diluída com água (50 ml), neutralizada com solução aquosa de 1,5 N ácido clorídrico e extraída com acetato de etila (50 ml). A camada orgânica foi separada, lavada com salmoura (25 ml) e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão utilizando 3% de metanol em clorofórmio como eluente para gerar 0,4 g do composto título na forma de sólido branco.

NMR ^1H (CDCl_3) δ 3,03-3,1 (m, 2H), 3,4-3,6 (m, 4H), 3,8-4,0 (m, 2H), 4,25-4,32 (m, 2H), 5,76-5,79 (m, 1H), 6,47 (s, 1H), 7,34-7,48 (m, 10H), 7,72 (s, 1H).

Etapa C: Preparação de cloridrato de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1,2,3,6-tetraidropiridina

A uma solução de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1,2,3,6-tetraidro-1-(fenilmetil)piridina (ou seja, o produto do Exemplo 13, Etapa B) (0,400 g, 0,99 mmol) em dicloroetano (10 ml), adicionou-se cloroformato de 1-cloroetila (0,286 g, 1,99 mmol) e a mistura de reação foi aquecida a 80 °C por cinco horas. A mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente e concentrada sob pressão reduzida. Adicionou-se metanol (10 ml) ao resíduo e a mistura resultante foi aquecida a 60 °C por uma hora, resfriada à temperatura

ambiente e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi triturado com 50% de éter de petróleo em acetato de etila e o sólido formado foi filtrado e seco para gerar 0,25 g do composto título na forma de um sólido branco.

NMR ^1H (DMSO- d_6) δ 2,50-2,55 (m, 2H), 3,31-3,39 (m, 3H), 3,86-3,91 (m, 3H), 5,73-5,78 (m, 1H), 6,67 (s, 1H), 7,34-7,39 (m, 5H), 7,68 (s, 1H), 9,47 (s, 2H).

Etapa D: Preparação de 1-[4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-3,6-di-hidro-1 (2H)-piridinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona

A uma solução de cloridrato de 4-[4-(4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]-1,2,3,6-tetraidropiridina (ou seja, o produto do Exemplo 13, Etapa C) (0,250 g, 0,720 mmol) e ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético (0,150 g, 0,720 mmol) em diclorometano (10 ml), adicionou-se *N*-(3-dimetilaminopropil)-*N'*-etilcarbodiimida (0,138 g, 0,720 mmol), 1-hidroxibenzotriazol (0,024 g, 0,177 mmol) e trietilamina (0,145 g, 1,44 mmol) à temperatura ambiente. A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por 24 horas. A mistura de reação foi diluída com diclorometano (30 ml) e lavada com água (20 ml) e salmoura (20 ml). A camada orgânica foi separada, lavada com água, seca (Na_2SO_4), concentrada sob pressão reduzida e purificada por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão utilizando 3% metanol em clorofórmio como eluente para gerar 200 mg do produto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de um sólido branco.

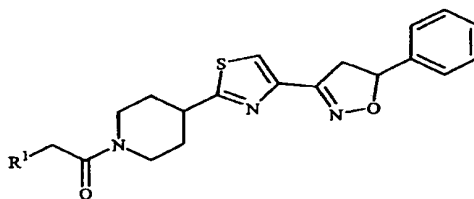
NMR ^1H (CDCl_3) δ 2,3 (s, 3H), 2,71-2,75 (m, 2H), 3,42-3,46 (m, 1H), 3,74-3,88 (m, 3H), 4,24-4,27 (m, 2H), 5,02 (s, 2H), 5,71-5,76 (m, 1H), 6,32 (s, 1H), 6,57 (s, 1H), 7,3-7,38 (m, 5H), 7,64 (s, 1H).

Por meio dos procedimentos descritos no presente, junto com métodos conhecidos na técnica, podem ser preparados os compostos das

Tabelas 1A a 8 a seguir. São utilizadas as abreviações abaixo nas Tabelas que se seguem: *t* indica terciário, *s* indica secundário, *n* indica normal, *i* indica iso, *c* indica ciclo, Ac indica acetila, Me indica metila, Et indica etila, Pr indica propila (ou seja, *n*-propila), *i*-Pr indica isopropila, *c*-Pr indica ciclopropila, Bu indica butila, Pen indica pentila, Hex indica hexila, Am indica amila e CN indica ciano. Traço (-) indica ausência de substituintes.

A presente invenção inclui, mas sem limitar-se aos exemplos de substâncias a seguir.

TABELA 1A



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
phenyl	3-ethylphenyl
2-methylphenyl	3-propylphenyl
2-methoxyphenyl	3-isopropylphenyl
2-chlorophenyl	3-(trifluoromethyl)phenyl
2-bromophenyl	3-(2,2,2-trifluoroethyl)phenyl
2-ethylphenyl	3-(pentafluoroethyl)phenyl
2-ethoxyphenyl	3-cyanophenyl
2-(methylthio)phenyl	3-nitrophenyl
2-(ethylthio)phenyl	2,5-dichlorophenyl
2-(trifluoromethoxy)phenyl	5-bromo-2-chlorophenyl
3-chlorophenyl	2-chloro-5-iodophenyl
3-bromophenyl	2-chloro-5-methylphenyl
3-iodophenyl	2-chloro-5-ethylphenyl
3-methylphenyl	2-chloro-5-propylphenyl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	2-chloro-5-isopropylphenyl
2-chloro-5-(2,2,2-trifluoroethyl)phenyl	5-ethyl-2-methoxyphenyl
2-chloro-5-(pentafluoroethyl)phenyl	2-methoxy-5-propylphenyl
2-chloro-5-cyanophenyl	5-isopropyl-2-methoxyphenyl
2-chloro-5-nitrophenyl	2-methoxy-5-(trifluoromethyl)phenyl
2-bromo-5-chlorophenyl	2-methoxy-5-(2,2,2-trifluoroethyl)phenyl
2,5-dibromophenyl	2-methoxy-5-(pentafluoroethyl)phenyl
2-bromo-5-iodophenyl	5-cyano-2-methoxyphenyl
2-bromo-5-methylphenyl	2-methoxy-5-nitrophenyl
2-bromo-5-ethylphenyl	5-chloro-2-ethylphenyl
2-bromo-5-propylphenyl	5-bromo-2-ethylphenyl
2-bromo-5-isopropylphenyl	2-ethyl-5-iodophenyl

R¹

2-bromo-5-(trifluoromethyl)phenyl
 2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroethyl)phenyl
 2-bromo-5-(pentafluoroethyl)phenyl
 2-bromo-5-cyanophenyl
 2-bromo-5-nitrophenyl
 5-chloro-2-methylphenyl
 5-bromo-2-methylphenyl
 5-iodo-2-methylphenyl
 2,5-dimethylphenyl
 5-ethyl-2-methylphenyl
 2-methyl-5-propylphenyl
 5-isopropyl-2-methylphenyl
 2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl
 2-methyl-5-(2,2,2-trifluoroethyl)phenyl
 2-methyl-5-(pentafluoroethyl)phenyl
 5-cyano-2-methylphenyl
 2-methyl-5-nitrophenyl
 5-chloro-2-methoxyphenyl
 5-bromo-2-methoxyphenyl
 5-iodo-2-methoxyphenyl
 2-methoxy-5-methylphenyl
 3-iodo-5-methylpyrazol-1-yl
 3-ethyl-5-methylpyrazol-1-yl
 5-methyl-3-propylpyrazol-1-yl
 3-isopropyl-5-methylpyrazol-1-yl
 5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
 5-methyl-3-(2,2,2-trifluoroethyl)pyrazol-1-yl
 5-methyl-3-(pentafluoroethyl)pyrazol-1-yl
 3-cyano-5-methylpyrazol-1-yl
 5-methyl-3-nitropyrazol-1-yl
 5-chloro-3-methylpyrazol-1-yl
 3,5-dichloropyrazol-1-yl
 5-chloro-3-bromopyrazol-1-yl
 5-chloro-3-iodopyrazol-1-yl
 5-chloro-3-ethylpyrazol-1-yl
 5-chloro-3-propylpyrazol-1-yl
 5-chloro-3-isopropylpyrazol-1-yl

R¹

2-ethyl-5-methylphenyl
 2,5-diethylphenyl
 2-ethyl-5-propylphenyl
 2-ethyl-5-isopropylphenyl
 2-ethyl-5-(trifluoromethyl)phenyl
 2-ethyl-5-(2,2,2-trifluoroethyl)phenyl
 2-ethyl-5-(pentafluoroethyl)phenyl
 5-cyano-2-ethylphenyl
 2-ethyl-5-nitrophenyl
 3-methylpyrazol-1-yl
 3-chloropyrazol-1-yl
 3-bromopyrazol-1-yl
 3-iodopyrazol-1-yl
 3-ethylpyrazol-1-yl
 3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
 3-(2,2,2-trifluoroethyl)pyrazol-1-yl
 3-(pentafluoroethyl)pyrazol-1-yl
 3-cyanopyrazol-1-yl
 3-nitropyrazol-1-yl
 3,5-dimethylpyrazol-1-yl
 3-chloro-5-methylpyrazol-1-yl
 3-bromo-5-methylpyrazol-1-yl
 5-methoxy-3-methylpyrazol-1-yl
 3-chloro-5-methoxypyrazol-1-yl
 5-ethyl-3-methylpyrazol-1-yl
 3-chloro-5-ethylpyrazol-1-yl
 3-bromo-5-ethylpyrazol-1-yl
 5-ethyl-3-iodopyrazol-1-yl
 3,5-diethylpyrazol-1-yl
 5-ethyl-3-propylpyrazol-1-yl
 5-ethyl-3-isopropylpyrazol-1-yl
 5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
 5-ethyl-3-(2,2,2-trifluoroethyl)pyrazol-1-yl
 5-ethyl-3-(pentafluoroethyl)pyrazol-1-yl
 3-cyano-5-ethylpyrazol-1-yl
 5-ethyl-3-nitropyrazol-1-yl
 5-butyl-2-methylphenyl

R¹

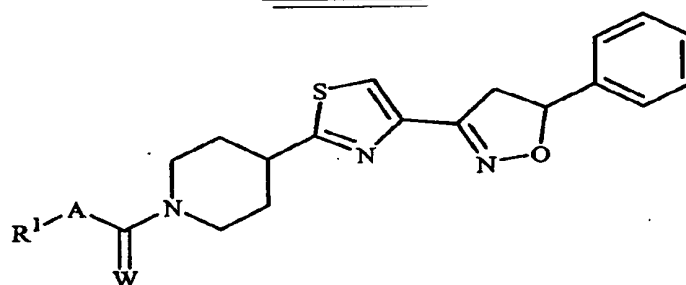
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
 5-chloro-3-(2,2,2-trifluoroethyl)pyrazol-1-yl
 5-chloro-3-(pentafluoroethyl)pyrazol-1-yl
 5-chloro-3-cyanopyrazol-1-yl
 5-chloro-3-nitropyrazol-1-yl
 5-bromo-3-methylpyrazol-1-yl
 5-bromo-3-chloropyrazol-1-yl
 3,5-dibromopyrazol-1-yl
 5-bromo-3-iodopyrazol-1-yl
 5-bromo-3-ethylpyrazol-1-yl
 5-bromo-3-propylpyrazol-1-yl
 5-bromo-3-isopropylpyrazol-1-yl
 5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
 5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroethyl)pyrazol-1-yl
 5-bromo-3-(pentafluoroethyl)pyrazol-1-yl
 5-bromo-3-cyanopyrazol-1-yl
 5-bromo-3-nitropyrazol-1-yl
 2-chloro-5-(dimethylamino)phenyl
 2-chloro-5-(diethylamino)phenyl
 2-chloro-5-(cyclopropylamino)phenyl
 3-(methoxymethyl)phenyl
 2-chloro-5-(ethoxymethyl)phenyl
 2-chloro-5-(hydroxymethyl)phenyl
 2-chloro-5-(methoxycarbonyl)phenyl
 2-chloro-5-(ethylcarbonyl)phenyl
 2-chloro-5-(methylcarbonyloxy)phenyl
 2-chloro-5-(methylaminocarbonyl)phenyl
 2-chloro-5-(dimethylaminocarbonyl)phenyl
 2-methyl-5-(trimethylsilyl)phenyl
 3,5-dimethyl-2-thienyl
 3,5-dichloro-2-thienyl
 3,5-dimethyl-2-furyl
 1-methyl-2-pyrrolyl
 4-methyl-2-(trifluoromethyl)-5-thiazolyl
 4-(trifluoromethyl)-2-thiazolyl
 4-(trifluoromethyl)-2-oxazolyl
 4-methyl-2-(trifluoromethyl)-5-oxazolyl

R¹

5-hexyl-2-methylphenyl
 5-allyl-2-methylphenyl
 2-methyl-5-(4-methyl-3-pentenyl)phenyl
 2-methyl-5-propargylphenyl
 2-methyl-5-(3-methylpropargyl)phenyl
 5-cyclopropyl-2-methylphenyl
 5-cyclohexyl-2-methylphenyl
 2-methyl-5-(pentafluoroisopropyl)phenyl
 5-(3,3-dichloro-2-propen-1-yl)-2-methylphenyl
 2-methyl-5-(4,4,4-trifluoro-2-buten-1-yl)phenyl
 5-(2,2-dichlorocyclopropan-1-yl)-2-methylphenyl
 2-methyl-5-(trifluoromethoxy)phenyl
 2-chloro-5-(isobutylthio)phenyl
 2-chloro-5-(ethylsulfonyl)phenyl
 2-chloro-5-(trifluoromethylthio)phenyl
 2-chloro-5-(trifluoromethylsulfonyl)phenyl
 2-chloro-5-(methylamino)phenyl
 2-chloro-5-(*tert*-butylamino)phenyl
 2,5-dimethyl-3-furyl
 2,5-dimethyl-3-thienyl
 2,5-dichloro-3-thienyl
 1,4-dimethyl-3-pyrrolyl
 1,4-dimethyl-3-pyrazolyl
 1,3-dimethyl-4-pyrazolyl
 2,5-dimethyl-4-oxazolyl
 2,5-dimethyl-4-thiazolyl
 3-bromo-4-isothiazolyl
 3-bromo-4-isooxazolyl
 1-methyl-4-imidazolyl
 5-(trifluoromethyl)-3-(1,2,4-oxadiazolyl)
 5-(trifluoromethyl)-3-(1,2,4-thiadiazolyl)
 2-bromo-1-(1,3,4-triazolyl)
 5-(trifluoromethyl)-3-(1,2,4-triazolyl)
 2-bromo-1-imidazolyl
 3,6-dimethyl-2-pyridyl
 2,5-dimethyl-3-pyridyl
 2,5-dimethyl-4-pyridyl

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
4-bromo-5-isothiazolyl	3,6-dichloro-2-pyridyl
4-bromo-5-isoxazolyl	2,5-dichloro-3-pyridyl
1-methyl-5-pyrazolyl	2,5-dichloro-4-pyridyl
1-methyl-5-imidazolyl	4-bromo-3-pyridazinyl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)-2-imidazolyl	4-(trifluoromethyl)-2-pyrimidinyl
4-methyl-3-(1,3,4-triazolyl)	3,6-dimethyl-2-pyrazinyl
2-methyl-3-(1,2,4-triazolyl)	2,5-dimethyl-4-pyrimidinyl
5-(trifluoromethyl)-2-(1,3,4-thiadiazolyl)	4-methoxy-5-pyrimidinyl
5-(trifluoromethyl)-2-(1,3,4-oxadiazolyl)	3,6-dimethyl-4-pyridazinyl
3-(trifluoromethyl)-5-(1,2,4-thiadiazolyl)	5-(trifluoromethyl)-3-(1,2,4-triazinyl)
3-(trifluoromethyl)-5-(1,2,4-oxadiazolyl)	5-methoxy-6-(1,2,4-triazinyl)
3-(trifluoromethyl)-1-(1,2,4-triazolyl)	4-(trifluoromethyl)-2-(1,3,5-triazinyl)
2,5-dimethyl-1-pyrrolyl	3,6-dimethyl-5-(1,2,4-triazinyl)
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl
3-bromo-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
3-iodo-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	3-(2,2,2-trifluoroethyl)-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
3-ethyl-5-(trifluoromethyl)-pyrazol-1-yl	3-(pentafluoroethyl)-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
3-propyl-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	3-cyano-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
3-isopropyl-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	3-nitro-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
3-methyl-5-(trifluoromethyl)-pyrazol-1-yl	3-chloro-5-(trifluoromethyl)-pyrazol-1-yl
3-methoxy-5-(trifluoromethyl)-pyrazol-1-yl	3,5-bis-(trichloromethyl)pyrazol-1-yl
5-difluoromethoxy-3-methylpyrazol-1-yl	3-difluoromethoxy-5-methylpyrazol-1-yl
5-difluoromethoxy-3-chloropyrazol-1-yl	3-difluoromethoxy-5-chloropyrazol-1-yl
3,5-dibromopyrazol-1-yl	3-difluoromethoxy-5-bromopyrazol-1-yl
5-difluoromethoxy-3-iodopyrazol-1-yl	3-difluoromethoxy-5-iodopyrazol-1-yl
5-difluoromethoxy-3-ethylpyrazol-1-yl	3-difluoromethoxy-5-ethylpyrazol-1-yl
5-difluoromethoxy-3-propylpyrazol-1-yl	3-difluoromethoxy-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
5-difluoromethoxy-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	3-difluoromethoxy-5-(2,2,2-trifluoroethyl)pyrazol-1-yl
5-difluoromethoxy-3-(2,2,2-trifluoroethyl)pyrazol-1-yl	3-difluoromethoxy-5-(pentafluoroethyl)pyrazol-1-yl
5-difluoromethoxy-3-(pentafluoroethyl)pyrazol-1-yl	3-difluoromethoxy-5-cyanopyrazol-1-yl
5-difluoromethoxy-3-cyanopyrazol-1-yl	3-difluoromethoxy-5-nitropyrazol-1-yl
5-difluoromethoxy-3-nitropyrazol-1-yl	3,5-bis-(difluoromethoxy)pyrazol-1-yl
3-carbomethoxy-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	5-carbomethoxy-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
5-methoxy-3-methylpyrazol-1-yl	3,5-dimethoxypyrazol-1-yl
5-methoxy-3-bromopyrazol-1-yl	5-ethoxy-3-methylpyrazol-1-yl
5-methoxy-3-iodopyrazol-1-yl	5-ethoxy-3-bromopyrazol-1-yl
	5-ethoxy-3-iodopyrazol-1-yl

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-methoxy-3-ethylpyrazol-1-yl	5-ethoxy-3-ethylpyrazol-1-yl
5-methoxy-3-propylpyrazol-1-yl	5-ethoxy-3-propylpyrazol-1-yl
5-methoxy-3-isopropylpyrazol-1-yl	5-ethoxy-3-isopropylpyrazol-1-yl
5-methoxy-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	5-ethoxy-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl
5-methoxy-3-(2,2,2-trifluoroethyl)pyrazol-1-yl	5-ethoxy-3-(2,2,2-trifluoroethyl)pyrazol-1-yl
5-methoxy-3-(pentafluoroethyl)pyrazol-1-yl	5-ethoxy-3-(pentafluoroethyl)pyrazol-1-yl
5-methoxy-3-cyanopyrazol-1-yl	5-ethoxy-3-cyanopyrazol-1-yl
5-methoxy-3-nitropyrazol-1-yl	5-ethoxy-3-nitropyrazol-1-yl

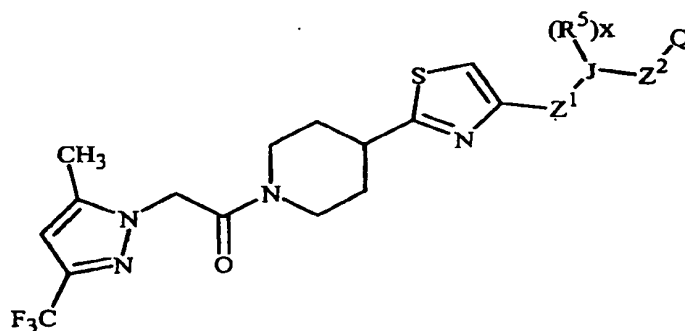
TABELA 1B

<u>R¹</u>	<u>A</u>	<u>W</u>
2-methoxyphenyl	NH	O
2,5-dichlorophenyl	NH	O
5-bromo-2-chlorophenyl	NH	O
2-chloro-5-methylphenyl	NH	O
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	NH	O
2,5-dibromophenyl	NH	O
2-bromo-5-methylphenyl	NH	O
2-bromo-5-(trifluoromethyl)phenyl	NH	O
5-chloro-2-methylphenyl	NH	O
5-bromo-2-methylphenyl	NH	O
2,5-dimethylphenyl	NH	O
5-ethyl-2-methylphenyl	NH	O
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	NH	O
5-bromo-2-methoxyphenyl	NH	O
2-methoxy-5-methylphenyl	NH	O
2-methoxy-5-(trifluoromethyl)phenyl	NH	O
3-ethyl-5-methylpyrazol-1-yl	CH ₂	S
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	CH ₂	S

<u>R¹</u>	<u>A</u>	<u>W</u>
3,5-dichloropyrazol-1-yl	CH ₂	S
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	CH ₂	S
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	CH ₂	S
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	CH ₂	S
3,5-dibromopyrazol-1-yl	CH ₂	S
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	CH ₂	S
3,5-diethylpyrazol-1-yl	CH ₂	S
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	CH ₂	S
2-methoxyphenyl	NH	S
2,5-dichlorophenyl	NH	S
5-bromo-2-chlorophenyl	NH	S
2-chloro-5-methylphenyl	NH	S
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	NH	S
2,5-dibromophenyl	NH	S
2-bromo-5-methylphenyl	NH	S
2-bromo-5-(trifluoromethyl)phenyl	NH	S
5-chloro-2-methylphenyl	NH	S
5-bromo-2-methylphenyl	NH	S
2,5-dimethylphenyl	NH	S
5-ethyl-2-methylphenyl	NH	S
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	NH	S
5-bromo-2-methoxyphenyl	NH	S
2-methoxy-5-methylphenyl	NH	S
2-methoxy-5-(trifluoromethyl)phenyl	NH	S
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NCH ₃	O
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NAc	O
3-methyl-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	CH ₂	S
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	CHCH ₃	O
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	CHCOOCH ₃	O
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	CHCl	O
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NCOOCH ₃	O
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NH	S
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	NH	O
3,5-dichloropyrazol-1-yl	NH	O
3,5-dibromopyrazol-1-yl	NH	O
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NH	O
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NH	O

<u>R¹</u>	<u>A</u>	<u>W</u>
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NH	O
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NH	O
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NH	O
3-methyl-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NH	O
3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NH	O
3-bromo-5-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NH	O
5-methoxy-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NH	O
5-difluoromethoxy-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	NH	O

TABELA 2*



<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-orientation **</u>
bond	J-1	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-1	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-1	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-1	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-2	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-2	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-2	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-2	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-3	1-Me	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-3	1-Me	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-3	1-Me	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-3	1-Me	bond	Q-45	—	—	5/2
CH ₂	J-3	—	bond	Q-45	—	—	1/4
bond	J-3	—	bond	Q-45	—	—	4/1
bond	J-4	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-4	—	bond	Q-45	—	—	2/5

Z ¹	J	(R ⁵) _x	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-4	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-4	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-4	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-4	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-5	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-5	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-5	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-5	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-5	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-5	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-6	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-6	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-6	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-6	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-6	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-6	—	bond	Q-45	—	—	5/3
CH ₂	J-6	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-6	—	bond	Q-45	—	—	3/1
bond	J-7	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-7	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-8	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-8	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-9	1-Me	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-9	1-Me	bond	Q-45	—	—	3/5
CH ₂	J-9	—	bond	Q-45	—	—	1/4
bond	J-9	—	bond	Q-45	—	—	4/1
bond	J-10	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-10	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-11	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-11	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-12	1-Me	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-12	1-Me	bond	Q-45	—	—	5/3
CH ₂	J-12	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-12	—	bond	Q-45	—	—	3/1
bond	J-13	—	bond	Q-45	—	—	1/4
bond	J-13	—	bond	Q-45	—	—	4/1

Z^1	I	$(R^5)_x$	Z^2	Q	$(R^7)_p$	R^{12}	J-orientation **
bond	J-14	1-Me	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-14	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-15	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-16	—	bond	Q-45	—	—	2/5
CH ₂	J-17	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-17	—	bond	Q-45	—	—	4/2
CH ₂	J-18	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-18	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-19	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-19	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-20	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-20	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-20	—	bond	Q-45	—	—	2/6
bond	J-20	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-20	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-20	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-21	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-21	—	bond	Q-45	—	—	3/6
bond	J-21	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-22	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-22	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-22	—	bond	Q-45	—	—	4/6
bond	J-22	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-22	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-23	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-23	—	bond	Q-45	—	—	2/6
bond	J-24	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-24	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-24	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-24	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-25	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-25	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-25	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-25	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-26	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-26	—	bond	Q-45	—	—	2/5

Z^1	J	$(R^5)_x$	Z^2	Q	$(R^7)_p$	R^{12}	J-orientation **
bond	J-26	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-26	—	bond	Q-45	—	—	5/2
CH ₂	J-26	—	bond	Q-45	—	—	1/4
bond	J-26	—	bond	Q-45	—	—	4/1
bond	J-27	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-27	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-27	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-27	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-27	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-27	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-28	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-28	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-29	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-30	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-30	—	bond	Q-45	—	—	5/3
CH ₂	J-30	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-30	—	bond	Q-45	—	—	3/1
CH ₂	J-30	—	bond	Q-45	—	—	1/4
bond	J-30	—	bond	Q-45	—	—	4/1
CH ₂	J-31	—	bond	Q-45	—	—	1/3
CH ₂	J-31	—	bond	Q-45	—	—	1/4
bond	J-31	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-31	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-31	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-31	—	bond	Q-45	—	—	3/1
bond	J-31	—	bond	Q-45	—	—	4/1
bond	J-31	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-31	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-32	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-32	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-32	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-32	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-32	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-32	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-33	—	bond	Q-45	—	—	2/4

Z ¹	J	(R ⁵) _K	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-33	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-33	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-33	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-33	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-33	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-34	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-34	—	bond	Q-45	—	—	1/4
bond	J-34	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-34	—	bond	Q-45	—	—	3/1
bond	J-34	—	bond	Q-45	—	—	4/1
CH ₂	J-35	—	bond	Q-45	—	—	1/4
bond	J-35	—	bond	Q-45	—	—	4/1
CH ₂	J-36	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-36	—	bond	Q-45	—	—	3/1
bond	J-36	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-36	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-37	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-37	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-37	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-37	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-38	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-38	—	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-38	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-38	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-39	4-Me	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-39	4-Me	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-40	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-40	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-41	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-41	—	bond	Q-45	—	—	1/4
CH ₂	J-42	—	bond	Q-45	—	—	1/3
CH ₂	J-42	—	bond	Q-45	—	—	1/4
CH ₂	J-43	—	bond	Q-45	—	—	1/4
bond	J-44	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-44	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-44	—	bond	Q-45	—	—	2/5

Z^1	J	$(R^5)_x$	Z^2	Q	$(R^7)_p$	R^{12}	J-orientation **
bond	J-44	-	bond	Q-45	-	-	2/6
bond	J-45	-	bond	Q-45	-	-	2/4
bond	J-45	-	bond	Q-45	-	-	2/5
bond	J-45	-	bond	Q-45	-	-	2/6
bond	J-46	-	bond	Q-45	-	-	2/4
bond	J-46	-	bond	Q-45	-	-	2/5
bond	J-46	-	bond	Q-45	-	-	4/2
bond	J-46	-	bond	Q-45	-	-	5/2
bond	J-47	-	bond	Q-45	-	-	2/4
bond	J-47	-	bond	Q-45	-	-	2/5
bond	J-47	-	bond	Q-45	-	-	4/2
bond	J-47	-	bond	Q-45	-	-	5/2
bond	J-48	-	bond	Q-45	-	-	3/5
bond	J-49	-	bond	Q-45	-	-	2/4
bond	J-49	-	bond	Q-45	-	-	2/5
bond	J-49	-	bond	Q-45	-	-	4/2
bond	J-49	-	bond	Q-45	-	-	5/2
bond	J-50	-	bond	Q-45	-	-	2/6
bond	J-51	-	bond	Q-45	-	-	2/6
bond	J-52	-	bond	Q-45	-	-	2/6
bond	J-53	-	-	-	-	-	2/3
bond	J-54	-	-	-	-	-	2/3
bond	J-55	-	-	-	-	-	2/3
bond	J-56	-	-	-	-	-	2/3
bond	J-57	1-Me	-	-	-	-	2/4
bond	J-58	1-Me	-	-	-	-	3/4
bond	J-59	-	-	-	-	-	2/4
bond	J-60	-	-	-	-	-	2/4
bond	J-61	-	-	-	-	-	2/4
bond	J-62	-	-	-	-	-	2/4
bond	J-63	-	-	-	-	-	3/4
bond	J-64	-	-	-	-	-	2/3
bond	J-65	-	-	-	-	-	3/4
bond	J-66	-	-	-	-	-	6/7
bond	J-67	-	-	-	-	-	2/3
bond	J-68	-	-	-	-	-	2/3

Z^1	J	$(R^5)_x$	Z^2	Q	$(R^7)_D$	R^{12}	J-orientation **
bond	J-69	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-69	—	bond	Q-45	—	—	1/4
bond	J-70	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-71	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-71	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-72	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-72	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-73	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-73	—	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-73	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-73	—	bond	Q-45	—	—	1/4
bond	J-73	—	bond	Q-45	—	—	4/1
bond	J-74	3-Me	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-74	3-Me	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-74	3-Me	bond	Q-45	—	—	4/2
bond	J-74	3-Me	bond	Q-45	—	—	5/2
bond	J-74	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-74	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-75	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-75	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-75	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-75	—	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-75	2-Me	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-75	2-Me	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-76	—	bond	Q-45	—	—	3/6
bond	J-76	—	bond	Q-45	—	—	6/3
bond	J-77	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-77	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-78	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-79	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-79	—	bond	Q-45	—	—	3/1
bond	J-80	—	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-80	—	bond	Q-45	—	—	3/1
bond	J-81	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-81	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-82	—	bond	Q-45	—	—	3/5

Z ¹	J	(R ⁵) _x	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-82	—	bond	Q-45	—	—	3/6
bond	J-82	—	bond	Q-45	—	—	5/3
bond	J-82	—	bond	Q-45	—	—	6/3
CH ₂	J-83	—	—	—	—	—	2/6
O	J-29	—	bond	Q-45	—	—	3/5
S	J-29	—	bond	Q-45	—	—	3/5
SO	J-29	—	bond	Q-45	—	—	3/5
SO ₂	J-29	—	bond	Q-45	—	—	3/5
NH	J-29	—	bond	Q-45	—	—	3/5
NMe	J-29	—	bond	Q-45	—	—	3/5
NPr	J-29	—	bond	Q-45	—	—	3/5
CH ₂	J-29	—	bond	Q-45	—	—	3/5
CH- <i>i</i> -Bu	J-29	—	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	4-Me	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	5-Me	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	4,5-di-Me	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	4,4-di-Me	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	[Note 1]	bond	Q-45	6-Me, [Note 1]	—	3/5
bond	J-29	[Note 2]	bond	Q-45	6-Me, [Note 2]	—	3/5
bond	J-29	5-Et	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	5- <i>t</i> -Bu	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5- <i>t</i> -amyl	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-(4-Me-3-penten-1-yl)	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-(3,3-di-Me-1-butyne-1-yl)	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5- <i>c</i> -Pr	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	5-(4-Me-cyclohexyl)	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-CF ₃	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	5-perfluoropropyl	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-(3,3-di-Cl-2-propen-1-yl)	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-OMe	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	5-SiMe ₃	—	—	—	—	3/5
bond	J-69	4-F	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-69	4-Cl	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-69	4-OH	bond	Q-45	—	—	1/3
bond	J-69	4-NH ₂	bond	Q-45	—	—	1/3

Z ¹	J	(R ⁵) _x	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-69	4-CN	O	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-NO ₂	NH	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-CF ₃	S	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	-	O	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	-	S	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	-	SO	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	-	SO ₂	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	-	NH	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	-	N-Me	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	-	CH ₂	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-OEt	bond	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-OCF ₃	bond	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-SMe	bond	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-SOMe	bond	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-SO ₂ Me	bond	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-SO ₂ - <i>t</i> -Bu	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	4-SCF ₃	bond	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-SO ₂ CH ₂ CF ₃	-	-	-	-	1/4
bond	J-22	4-NH- <i>i</i> -Bu	-	-	-	-	2/4
bond	J-22	4-di-EtN	-	-	-	-	2/4
bond	J-22	4-NH-cyclohexyl	-	-	-	-	2/4
bond	J-69	4-CH ₂ O- <i>i</i> -Pr	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-CH ₂ OCHF ₂	bond	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-CH ₂ OH	bond	Q-45	-	-	1/3
bond	J-74	3-acetyl	bond	Q-45	-	-	2/5
bond	J-69	4-CO ₂ - <i>i</i> -Pr	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-O-acetyl	bond	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-S-acetyl	bond	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-CONHMe	bond	Q-45	-	-	1/3
bond	J-69	4-CONEt ₂	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	-	O	Q-45	-	-	1/4
bond	J-29	-	bond	Q-1	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-2	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-3	-	Me	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-4	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-5	-	-	3/5

Z ¹	J	(R ⁵) _x	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-29	—	bond	Q-6	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-7	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-8	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-9	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-10	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-11	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-12	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-13	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-14	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-15	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-16	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-17	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-18	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-19	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-20	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-21	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-22	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-23	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-24	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-25	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-26	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-27	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-28	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-29	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-30	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-31	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-32	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-33	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-34	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-35	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-36	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-37	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-38	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-39	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-40	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-41	—	—	3/5

Z ¹	J	(R ⁵) _x	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-29	—	bond	Q-42	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-43	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-44	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-46	—	—	3/5
bond	J-29	—	CH ₂	Q-47	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-48	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-49	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-50	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-51	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-52	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-53	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-54	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-55	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-56	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-57	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-58	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-59	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-60	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-61	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-62	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-63	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-64	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-65	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-66	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-67	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-68	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-69	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	2-Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	2-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	2-OMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-OMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-OMe	—	3/5

Z ¹	J	(R ⁵) _x	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-29	—	bond	Q-45	2-Et	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3- <i>i</i> -Pr	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	2,6-di-Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-vinyl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-ethynyl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4- <i>c</i> -Pr	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-CF ₃	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-OCF ₃	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-Br	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-OH	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-NH ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	2-CN	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	2-NO ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-O- <i>t</i> -Bu	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-SMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-SCF ₃	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-SO ₂ Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-NHMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-NMe ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	2-CH ₂ OMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-COMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-CO ₂ Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-CONHMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-OCOMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-SCOMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	3-CONMe ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-SiMe ₃	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	2,6-di-F	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	2,6-di-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	2-OH	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-45	4-OCHF ₂	—	3/5
bond	J-26	1-Me	bond	Q-45	—	—	2/5
bond	J-26	[Note 3]	bond	Q-45	[Note 3]	—	2/5
bond	J-26	1-Me, [Note 3]	bond	Q-45	[Note 3]	—	2/5
bond	J-26	—	bond	Q-45	4-OH	—	2/5
bond	J-26	—	bond	Q-45	4-OMe	—	2/5

Z ¹	J	(R ⁵) _x	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-26	—	CH ₂	Q-45	4-OH	—	2/5
bond	J-26	—	CH ₂	Q-45	4-OMe	—	2/5
bond	J-26	—	bond	Q-45	4-OH	—	2/4
bond	J-26	—	bond	Q-45	4-OMe	—	2/4
bond	J-26	—	CH ₂	Q-45	4-OH	—	2/4
bond	J-26	—	CH ₂	Q-45	4-OMe	—	2/4
bond	J-25	—	bond	Q-45	4-OH	—	2/4
bond	J-25	—	bond	Q-45	4-OMe	—	2/4
bond	J-25	—	CH ₂	Q-45	4-OH	—	2/4
bond	J-25	—	CH ₂	Q-45	4-OMe	—	2/4
bond	J-1	5-Me	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-3	—	bond	Q-45	—	—	2/4
bond	J-3	[Note 4]	bond	Q-45	[Note 4]	—	2/5
bond	J-29	5-CO ₂ Me	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	5-CO ₂ Et	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	4,4-di-Me-5-CO ₂ Me	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	5-CONEt ₂	bond	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	—	NH	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	—	NMe	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	—	NEt	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	—	NPr	Q-45	—	—	3/5
bond	J-29	5-NHAc	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-NAc ₂	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-N(Me)Ac	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-N(Me)C(=O)Ph	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-N(Et)Ac	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-N(Et)C(=O)Ph	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-NHC(=O)OMe	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-N(Me)C(=O)OMe	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-NHC(=O)OEt	—	—	—	—	3/5
bond	J-29	5-N(Me)C(=O)OEt	—	—	—	—	3/5
bond	J-69	3-Cl	—	—	—	—	1/3
bond	J-69	3-Br	—	—	—	—	1/3
bond	J-69	3-I	—	—	—	—	1/3
bond	J-69	3-Me	—	—	—	—	1/3
bond	J-69	3-Et	—	—	—	—	1/3

Z ¹	J	(R ⁵) _x	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-69	3-Pr	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3- <i>i</i> -Pr	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3-Bu	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3- <i>i</i> -Bu	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3- <i>s</i> -Bu	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3- <i>t</i> -Bu	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3-Am	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3- <i>i</i> -Am	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3- <i>t</i> -Am	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3-cyclopropyl	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3-cyclobutyl	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3-cyclopentyl	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3-cyclohexyl	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3-trifluoromethoxy	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3-isopropoxy	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	3-isobutoxy	-	-	-	-	1/3
bond	J-69	4-Cl	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-Br	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-I	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-Me	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-Et	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-Pr	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4- <i>i</i> -Pr	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-Bu	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4- <i>i</i> -Bu	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4- <i>s</i> -Bu	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4- <i>t</i> -Bu	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-Am	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4- <i>i</i> -Am	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4- <i>t</i> -Am	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-cyclopropyl	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-cyclobutyl	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-cyclopentyl	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-cyclohexyl	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-trifluoromethoxy	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	4-isopropoxy	-	-	-	-	1/4

Z ¹	J	(R ⁵) _x	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-69	4-isobutoxy	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	3,4-di-Cl	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	3,4-di-Br	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	3,4-di-Me	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	3,4-di-Et	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	3,4-di-OMe	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	3,4-di-OEt	-	-	-	-	1/4
bond	J-69	3-OMe-4-O-propargyl	-	-	-	-	1/4
bond	J-4	5- <i>i</i> -Bu	-	-	-	-	2/5
bond	J-4	5- <i>i</i> -Am	-	-	-	-	2/5
bond	J-5	5- <i>i</i> -Bu	-	-	-	-	2/5
bond	J-5	5- <i>i</i> -Am	-	-	-	-	2/5
bond	J-11	5- <i>i</i> -Bu	-	-	-	-	3/5
bond	J-11	5- <i>i</i> -Am	-	-	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-70	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-71	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-72	-	Me	3/5,
bond	J-29	-	bond	Q-73	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-74	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-75	-	Me	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-76	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-77	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-78	-	Me	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-79	-	Me	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-80	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-81	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-82	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-83	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-84	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-85	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-86	-	Me	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-87	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-88	-	Me	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-89	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-90	-	-	3/5
bond	J-29	-	bond	Q-91	-	-	3/5

Z ¹	J	(R ⁵) _x	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-29	—	bond	Q-92	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-93	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-94	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-95	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-96	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-97	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-98	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-99	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-100	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-101	—	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-102	—	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-87	4-phenyl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	—	acetyl	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	—	methoxycarbonyl	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	—	methoxy	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	4-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	5-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	6-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	7-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	4-Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	5-Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	6-Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	5-CF ₃	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	5-NO ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	6-Br	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	6-NO ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	6-NH ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	6-OMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	5,6-di-OMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-71	5,6-di-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-70	5-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-70	5-Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-70	5-NO ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-70	5-NH ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-70	6-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-70	6-Me	—	3/5

Z ¹	J	(R ⁵) _x	Z ²	Q	(R ⁷) _p	R ¹²	J-orientation **
bond	J-29	—	bond	Q-70	6-NO ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-70	6-NH ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-70	5,6-di-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-70	5-Cl-6-OH	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	5-Cl	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	5-Me	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	5-NO ₂	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	5-NH ₂	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	6-Cl	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	6-Me	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	6-NO ₂	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	6-NH ₂	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-72	5,6-di-Cl	Me	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-63	4-Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-63	4-NO ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-63	4-NH ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-63	5-Cl	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-63	5-Me	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-63	5-CN	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-63	5-NO ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-63	5-NH ₂	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-63	5-COOMe	—	3/5
bond	J-29	—	bond	Q-63	5,6-di-Cl	—	3/5
bond	J-29	5-N(Ac)C(=O)Ph	bond	—	—	—	3/5
	J-29	5-N(Ac)C(=O)(2-					
bond		carbomethoxy-Ph)	bond	—	—	—	3/5

* As definições de J, R⁵, Q, R⁷ e R¹² nos compostos desta tabela são conforme definido nas Ilustrações 3 e 4 nas Realizações acima. Um traço “—” na coluna (R⁵)_x indica ausência de substituição sobre J. Um traço em cada uma dentre as colunas Z² e Q indica que nenhum substituinte Z²Q é ligado como R⁵ a J. Um travessão nas colunas (R⁷)_p e/ou R¹² indica ausência de substituição sobre Q.

** Orientação J indica os pontos de conexão para Z¹ e Z² (ou outro R⁵ quando Z² não estiver presente) sobre o anel J. O primeiro número indica a posição de anel sobre J em que Z¹ é ligado e o segundo número indica a posição de anel sobre J em que Z² é ligado ou, quando Z² não estiver

presente, a posição de anel sobre J em que o substituinte relacionado sob $(R^5)_x$ é ligado.

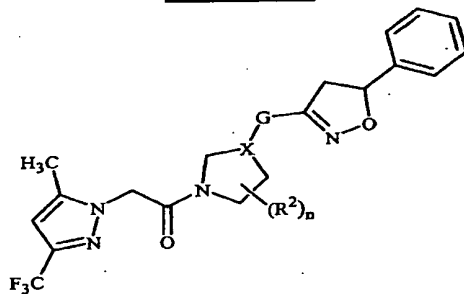
Obs. 1: R^5 e R^7 tomados em conjuntos para formar uma ponte CH_2CH_2 entre a posição 4 de J-29 e a posição 2 de Q-45.

5 Obs. 2: R^5 e R^7 tomados em conjunto para formar uma ponte CH_2 entre a posição 4 de J-29 e a posição 2 de Q-45.

Obs. 3: R^5 e R^7 tomados em conjunto para formar uma ponte CH_2CH_2 entre a posição 4 de J-26 e a posição 2 de Q-45.

10 Obs. 4: R^5 e R^7 tomados em conjunto para formar uma ponte CH_2CH_2 entre a posição 1 de J-3 e a posição 2 de Q-45.

TABELA 3*



X	$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11a}
X ¹	-	G-1	H	-
X ¹	-	G-2	H	-
X ¹	-	G-3	H	H
X ¹	-	G-4	H	-
X ¹	-	G-5	H	-
X ¹	-	G-6	H	H
X ¹	-	G-7	H	-
X ¹	-	G-8	H	-
X ¹	-	G-9	H	H
X ¹	-	G-10	H	-
X ¹	-	G-11	H	-
X ¹	-	G-12	H	H
X ¹	-	G-13	H	H
X ¹	-	G-14	H	-
X ¹	-	G-15	H	-
X ¹	-	G-16	H	H
X ¹	-	G-17	H	-
X ¹	-	G-18	H	-
X ¹	-	G-19	H	H

X	$(R^2)_n$	G	R^{3a}	R^{11a}
X^1	-	G-20	H	-
X^1	-	G-21	H	-
X^1	-	G-22	H	H
X^1	-	G-23	H	-
X^1	-	G-24	H	-
X^1	-	G-25	H	-
X^1	-	G-26	H	-
X^1	-	G-27	H	-
X^1	-	G-28	H	-
X^1	-	G-29	H	-
X^1	-	G-30	H	-
X^1	-	G-31	H	-
X^1	-	G-32	H	-
X^1	-	G-33	H	-
X^1	-	G-34	H	-
X^1	-	G-35	H	-
X^1	-	G-36	H	-
X^1	-	G-37	H	-
X^1	-	G-38	H	-
X^1	-	G-39	H	H
X^1	-	G-40	H	-
X^1	-	G-41	H	-
X^1	-	G-42	H	H
X^1	-	G-43	H	H
X^1	-	G-44	H	-
X^1	-	G-45	H	-
X^1	-	G-46	H	-
X^1	-	G-47	H	-
X^1	-	G-48	H	H
X^1	-	G-49	H	-
X^1	-	G-50	H	-
X^1	-	G-51	H	H
X^1	-	G-52	H	-
X^1	-	G-53	H	-
X^1	-	G-54	H	H
X^1	-	G-55	H	-
X^1	-	G-56	H	-

X	(R ²) _n	G	R ^{3a}	R ^{11a}
X ¹	-	G-57	H	-
X ¹	-	G-58	H	H
X ¹	-	G-59	H	H
X ¹	-	G-2	Me	-
X ¹	-	G-2	Cl	-
X ¹	-	G-2	F	-
X ¹	-	G-2	CF ₃	-
X ¹	-	G-14	<i>n</i> -Pr	-
X ¹	-	G-3	H	Me
X ¹	-	G-3	H	<i>n</i> -Pr
X ¹	-	G-26	5-Me	-
X ¹	2-Me	G-1	H	-
X ¹	3-Me	G-1	H	-
X ¹	2,6-di-Me	G-1	H	-
X ¹	3,5-di-Me	G-1	H	-
X ¹	3- <i>n</i> -Bu	G-1	H	-
X ¹	4-MeO	G-1	H	-
X ¹	4-OH	G-1	H	-
X ¹	4-Cl	G-1	H	-
X ¹	4-Br	G-1	H	-
X ¹	4-CN	G-1	H	-
X ²	-	G-1	H	-
X ²	-	G-2	H	-
X ²	-	G-3	H	H
X ²	-	G-4	H	-
X ²	-	G-5	H	-
X ²	-	G-6	H	H
X ²	-	G-7	H	-
X ²	-	G-8	H	-
X ²	-	G-9	H	H
X ²	-	G-10	H	-
X ²	-	G-11	H	-
X ²	-	G-12	H	H
X ²	-	G-13	H	H
X ²	-	G-14	H	-
X ²	-	G-15	H	-
X ²	-	G-16	H	H

X	$(R^2)_n$	G	R ^{3a}	R ^{11a}
X ²	-	G-17	H	-
X ²	-	G-18	H	-
X ²	-	G-19	H	H
X ²	-	G-20	H	-
X ²	-	G-21	H	-
X ²	-	G-22	H	H
X ²	-	G-23	H	-
X ²	-	G-24	H	-
X ²	-	G-31	H	-
X ²	-	G-32	H	-
X ²	-	G-33	H	-
X ²	-	G-34	H	-
X ²	-	G-35	H	-
X ²	-	G-37	H	-
X ²	-	G-38	H	-
X ²	-	G-39	H	H
X ²	-	G-40	H	-
X ²	-	G-41	H	-
X ²	-	G-42	H	H
X ²	-	G-43	H	H
X ²	-	G-44	H	-
X ²	-	G-45	H	-
X ²	-	G-46	H	-
X ²	-	G-47	H	-
X ²	-	G-48	H	H
X ²	-	G-49	H	-
X ²	-	G-50	H	-
X ²	-	G-51	H	H
X ²	-	G-52	H	-
X ²	-	G-53	H	-
X ²	-	G-54	H	H
X ²	-	G-2	Me	-
X ²	-	G-2	Cl	-
X ²	-	G-2	F	-
X ²	-	G-2	CF ₃	-
X ²	-	G-14	n-Pr	-
X ²	-	G-3	H	Me

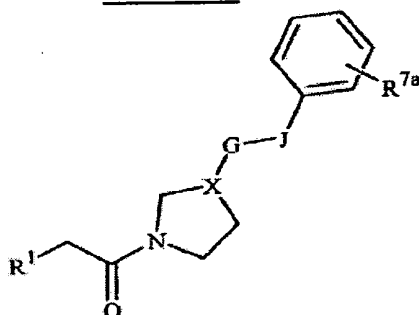
X	(R ²) _n	G	R ^{3a}	R ^{11a}
X ²	—	G-3	H	<i>n</i> -Pr
X ²	2-Me	G-1	H	—
X ²	3-Me	G-1	H	—
X ²	2,6-di-Me	G-1	H	—
X ²	3,5-di-Me	G-1	H	—
X ²	3- <i>n</i> -Bu	G-1	H	—
X ³	—	G-1	H	—
X ³	—	G-2	H	—
X ³	—	G-3	H	H
X ³	—	G-4	H	—
X ³	—	G-5	H	—
X ³	—	G-6	H	H
X ³	—	G-7	H	—
X ³	—	G-8	H	—
X ³	—	G-9	H	H
X ³	—	G-10	H	—
X ³	—	G-11	H	—
X ³	—	G-12	H	H
X ³	—	G-13	H	H
X ³	—	G-14	H	—
X ³	—	G-15	H	—
X ³	—	G-16	H	H
X ³	—	G-17	H	—
X ³	—	G-18	H	—
X ³	—	G-19	H	H
X ³	—	G-20	H	—
X ³	—	G-21	H	—
X ³	—	G-22	H	H
X ³	—	G-23	H	—
X ³	—	G-24	H	—
X ³	—	G-31	H	—
X ³	—	G-32	H	—
X ³	—	G-33	H	—
X ³	—	G-34	H	—
X ³	—	G-35	H	—
X ³	—	G-37	H	—
X ³	—	G-38	H	—

X	(R ²) _n	G	R ^{3a}	R ^{11a}
X ³	-	G-39	H	H
X ³	-	G-40	H	-
X ³	-	G-41	H	-
X ³	-	G-42	H	H
X ³	-	G-43	H	H
X ³	-	G-44	H	-
X ³	-	G-45	H	-
X ³	-	G-46	H	-
X ³	-	G-47	H	-
X ³	-	G-48	H	H
X ³	-	G-49	H	-
X ³	-	G-50	H	-
X ³	-	G-51	H	H
X ³	-	G-52	H	-
X ³	-	G-53	H	-
X ³	-	G-54	H	H
X ³	-	G-2	Me	-
X ³	-	G-2	Cl	-
X ³	-	G-2	F	-
X ³	-	G-2	CF ₃	-
X ³	-	G-14	<i>n</i> -Pr	-
X ³	-	G-3	H	Me
X ³	-	G-3	H	<i>n</i> -Pr
X ³	2-Me	G-1	H	-
X ³	3-Me	G-1	H	-
X ³	2,6-di-Me	G-1	H	-
X ³	3,5-di-Me	G-1	H	-
X ³	3- <i>n</i> -Bu	G-1	H	-
X ³	5-Me	G-1	H	-
X ³	6-Me	G-1	H	-
X ⁴	-	G-1	H	-
X ⁵	-	G-1	H	-
X ⁶	-	G-1	H	-
X ⁷	-	G-1	H	-
X ⁸	-	G-1	H	-
X ⁹	-	G-1	H	-

* As definições de X, G, R^{3a} e R^{11a} nos compostos desta tabela são conforme definido na Descrição Resumida da Invenção e na Ilustração 2 nas Realizações acima.

Um travessão "-" na coluna (R⁵)_y indica ausência de substituintes.

TABELA 4



R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-1 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-2 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-4 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-8 (5/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-9 (5/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-14 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-15 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-16 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-22 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-24 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-25 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-28 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-37 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-38 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H

R^1	X	G **	J ***	$(R^5)_y$	R^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-39 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-40 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-69 (1/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-69 (1/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me

R ¹	X	G ^{**}	J ^{***}	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	3-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	3-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _v	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-1 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-2 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-4 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-8 (5/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-9 (5/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-14 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-15 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-16 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-22 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-24 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-25 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-28 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-37 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-38 (2/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-39 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-40 (3/5)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-69 (1/3)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-69 (1/4)	—	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	3-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-11 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	3-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Me
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	2-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	—	4-Cl
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H

R ¹	X	G **	J ***	(R ⁵) _y	R ^{7a}
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-dichlorophenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2,5-dimethylphenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
2-methyl-5-(trifluoromethyl)phenyl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
3,5-dimethylpyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-chloro-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-bromo-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
5-ethyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
3,5-bis-(trifluoromethyl)pyrazol-1-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazol-5-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H
1-methyl-4-(trifluoromethyl)imidazol-2-yl	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	H

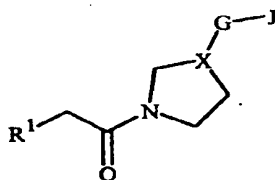
* As definições de G e J nos compostos desta tabela são

conforme definido nas Ilustrações 2 e 3 nas Realizações acima. A coluna $(R^5)_y$ designa os substituintes $(R^5)_x$ exibidos sobre os grupos J na Ilustração 3 diferentes do anel fenila substituído por R^{7a} exibido na estrutura acima desta tabela. R^{7a} pode ser selecionado a partir de H (para indicar ausência de substituição sobre o anel fenila), bem como os substituintes definidos para R^7 . Um traço “-” na coluna $(R^5)_y$ indica ausência de substituição sobre J além do anel fenila substituído por R^{7a} .

** O substituinte R^{3a} em G é H.

*** Os números entre parênteses indicam os pontos de ligação sobre o anel J. O primeiro número é o ponto de ligação para o anel G; o segundo número é o ponto de ligação para o anel fenila.

TABELA 5



em que J é um dentre J-29-1 a J-29-57 (conforme exibido na Ilustração A acima).

15 R^1 é 2,5-diclorofenila; X é X^1 , G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2,5-diclorofenila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-5	J-29-9	J-29-13	J-29-17	J-29-21
J-29-2	J-29-6	J-29-10	J-29-14	J-29-18	J-29-22
J-29-3	J-29-7	J-29-11	J-29-15	J-29-19	J-29-23
J-29-4	J-29-8	J-29-12	J-29-16	J-29-20	J-29-24
J	J	J	J	J	J
J-29-25	J-29-31	J-29-37	J-29-43	J-29-49	J-29-55
J-29-26	J-29-32	J-29-38	J-29-44	J-29-50	J-29-56
J-29-27	J-29-33	J-29-39	J-29-45	J-29-51	J-29-57
J-29-28	J-29-34	J-29-40	J-29-46	J-29-52	
J-29-29	J-29-35	J-29-41	J-29-47	J-29-53	
J-29-30	J-29-36	J-29-42	J-29-48	J-29-54	

R^1 é 2,5-diclorofenila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2,5-diclorofenila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2-cloro-5-(trifluorometil)fenila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2-cloro-5-(trifluorometil)fenila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2-cloro-5-(trifluorometil)fenila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2-cloro-5-(trifluorometil)fenila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2,5-dimetilfenila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2,5-dimetilfenila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-10	J-29-19	J-29-28	J-29-37	J-29-46
J-29-2	J-29-11	J-29-20	J-29-29	J-29-38	J-29-47
J-29-3	J-29-12	J-29-21	J-29-30	J-29-39	J-29-48
J-29-4	J-29-13	J-29-22	J-29-31	J-29-40	J-29-49
J-29-5	J-29-14	J-29-23	J-29-32	J-29-41	J-29-50
J-29-6	J-29-15	J-29-24	J-29-33	J-29-42	J-29-51
J-29-7	J-29-16	J-29-25	J-29-34	J-29-43	J-29-52
J-29-8	J-29-17	J-29-26	J-29-35	J-29-44	J-29-53
J-29-9	J-29-18	J-29-27	J-29-36	J-29-45	J-29-54
J-29-55	J-29-56	J-29-57			

R^1 é 2,5-dimetilfenila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2,5-dimetilfenila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2-metil-5-(trifluorometil)fenila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-8	J-29-15	J-29-22	J-29-29	J-29-36
J-29-2	J-29-9	J-29-16	J-29-23	J-29-30	J-29-37
J-29-3	J-29-10	J-29-17	J-29-24	J-29-31	J-29-38
J-29-4	J-29-11	J-29-18	J-29-25	J-29-32	J-29-39
J-29-5	J-29-12	J-29-19	J-29-26	J-29-33	J-29-40
J-29-6	J-29-13	J-29-20	J-29-27	J-29-34	J-29-41
J-29-7	J-29-14	J-29-21	J-29-28	J-29-35	J-29-42

J	J	J	J	J
J-29-43	J-29-46	J-29-49	J-29-52	J-29-55
J-29-44	J-29-47	J-29-50	J-29-53	J-29-56
J-29-45	J-29-48	J-29-51	J-29-54	J-29-57

R^1 é 2-metil-5-(trifluorometil)fenila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2-metil-5-(trifluorometil)fenila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 2-metil-5-(trifluorometil)fenila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-5	J-29-9	J-29-13	J-29-17	J-29-21
J-29-2	J-29-6	J-29-10	J-29-14	J-29-18	J-29-22
J-29-3	J-29-7	J-29-11	J-29-15	J-29-19	J-29-23
J-29-4	J-29-8	J-29-12	J-29-16	J-29-20	J-29-24

J	J	J	J	J	J
J-29-25	J-29-31	J-29-37	J-29-43	J-29-49	J-29-55
J-29-26	J-29-32	J-29-38	J-29-44	J-29-50	J-29-56
J-29-27	J-29-33	J-29-39	J-29-45	J-29-51	J-29-57
J-29-28	J-29-34	J-29-40	J-29-46	J-29-52	
J-29-29	J-29-35	J-29-41	J-29-47	J-29-53	
J-29-30	J-29-36	J-29-42	J-29-48	J-29-54	

R^1 é 3,5-dimetilpirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-dimetilpirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-dimetilpirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-dimetilpirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-dicloropirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-dicloropirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-dicloropirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-dicloropirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-9	J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41
J-29-2	J-29-10	J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42
J-29-3	J-29-11	J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43
J-29-4	J-29-12	J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44
J-29-5	J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45
J-29-6	J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46
J-29-7	J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47
J-29-8	J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48
J	J	J	J	J	
J-29-49	J-29-51	J-29-53	J-29-55	J-29-57	
J-29-50	J-29-52	J-29-54	J-29-56		

R^1 é 3,5-dibromopirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-dibromopirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-dibromopirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-3	J-29-5	J-29-7	J-29-9	J-29-11
J-29-2	J-29-4	J-29-6	J-29-8	J-29-10	J-29-12

J	J	J	J	J	J
J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45	J-29-53
J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46	J-29-54
J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47	J-29-55
J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48	J-29-56
J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41	J-29-49	J-29-57
J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42	J-29-50	
J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43	J-29-51	
J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44	J-29-52	

R^1 é 3,5-dibromopirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-9	J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41
J-29-2	J-29-10	J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42
J-29-3	J-29-11	J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43
J-29-4	J-29-12	J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44
J-29-5	J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45
J-29-6	J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46
J-29-7	J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47
J-29-8	J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48
J	J	J	J	J	J
J-29-49	J-29-51	J-29-53	J-29-55	J-29-57	
J-29-50	J-29-52	J-29-54	J-29-56		

R^1 é 5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-3	J-29-5	J-29-7	J-29-9	J-29-11
J-29-2	J-29-4	J-29-6	J-29-8	J-29-10	J-29-12
J	J	J	J	J	J
J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45	J-29-53
J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46	J-29-54
J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47	J-29-55
J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48	J-29-56
J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41	J-29-49	J-29-57
J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42	J-29-50	
J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43	J-29-51	
J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44	J-29-52	

R^1 é 5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-9	J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41
J-29-2	J-29-10	J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42
J-29-3	J-29-11	J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43
J-29-4	J-29-12	J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44
J-29-5	J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45
J-29-6	J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46
J-29-7	J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47
J-29-8	J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48
J	J	J	J	J	
J-29-49	J-29-51	J-29-53	J-29-55	J-29-57	
J-29-50	J-29-52	J-29-54	J-29-56		

R^1 é 3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-3	J-29-5	J-29-7	J-29-9	J-29-11
J-29-2	J-29-4	J-29-6	J-29-8	J-29-10	J-29-12

J	J	J	J	J	J
J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45	J-29-53
J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46	J-29-54
J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47	J-29-55
J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48	J-29-56
J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41	J-29-49	J-29-57
J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42	J-29-50	
J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43	J-29-51	
J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44	J-29-52	

R^1 é 3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3-bromo-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-9	J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41
J-29-2	J-29-10	J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42
J-29-3	J-29-11	J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43
J-29-4	J-29-12	J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44
J-29-5	J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45
J-29-6	J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46
J-29-7	J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47
J-29-8	J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48
J	J	J	J	J	
J-29-49	J-29-51	J-29-53	J-29-55	J-29-57	
J-29-50	J-29-52	J-29-54	J-29-56		

R^1 é 3-bromo-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3-bromo-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 3-bromo-5-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-3	J-29-5	J-29-7	J-29-9	J-29-11
J-29-2	J-29-4	J-29-6	J-29-8	J-29-10	J-29-12
J	J	J	J	J	J
J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45	J-29-53
J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46	J-29-54
J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47	J-29-55
J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48	J-29-56
J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41	J-29-49	J-29-57
J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42	J-29-50	
J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43	J-29-51	
J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44	J-29-52	

R^1 é 5-metóxi-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-metóxi-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-metóxi-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-metóxi-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-difluorometóxi-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-difluorometóxi-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-1.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R^1 é 5-difluorometóxi-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^1 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

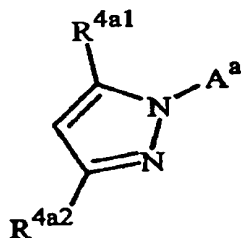
R^1 é 5-difluorometóxi-3-(trifluorometil)pirazol-1-ila; X é X^2 ; G^* é G-2.

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-9	J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41
J-29-2	J-29-10	J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42
J-29-3	J-29-11	J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43
J-29-4	J-29-12	J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44
J-29-5	J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45
J-29-6	J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46
J-29-7	J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47
J-29-8	J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48
J	J	J	J	J	
J-29-49	J-29-51	J-29-53	J-29-55	J-29-57	
J-29-50	J-29-52	J-29-54	J-29-56		

A Tabela 5 acima identifica compostos específicos que compreendem um grupo J selecionado a partir de J-29-1 a J-29-57 (ou seja, exemplos específicos de J-29). Como muitos J-29-1 a J-29-57 incluem um centro quiral, esses grupos J são ilustrados em uma configuração enantiomérica específica, que em alguns casos pode fornecer a maior atividade fungicida. Os técnicos no assunto reconhecem imediatamente o antípodo (ou seja, enantiômero oposto) para cada um dos compostos relacionados e, adicionalmente, compreende que os enantiômeros podem estar presentes na forma de enantiômeros puros ou em misturas enriquecidas em um enantiômero ou em misturas racêmicas.

** substituinte R^{3a} em G é H.

TABELA 6



R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
Me	Me	H	Me	Me	CH ₂ CO ₂ Et
Me	Et	H	Me	Et	CH ₂ CO ₂ Et
Me	Cl	H	Me	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
Me	Br	H	Me	Br	CH ₂ CO ₂ Et
Me	I	H	Me	I	CH ₂ CO ₂ Et
Me	CF ₂ H	H	Me	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
Me	CF ₃	H	Me	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Me	CF ₃ CH ₂	H	Me	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Me	CF ₃ CF ₂	H	Me	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Me	CCl ₃	H	Me	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Me	MeO	H	Me	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
Et	Me	H	Et	Me	CH ₂ CO ₂ Et
Et	Et	H	Et	Et	CH ₂ CO ₂ Et
Et	Cl	H	Et	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
Et	Br	H	Et	Br	CH ₂ CO ₂ Et

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
Et	I	H	Et	I	CH ₂ CO ₂ Et
Et	CF ₂ H	H	Et	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
Et	CF ₃	H	Et	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Et	CF ₃ CH ₂	H	Et	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Et	CF ₃ CF ₂	H	Et	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Et	CCl ₃	H	Et	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Et	MeO	H	Et	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	Et	H	Cl	Et	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	Cl	H	Cl	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	Br	H	Cl	Br	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	I	H	Cl	I	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	CF ₂ H	H	Cl	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	CF ₃	H	Cl	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	CF ₃ CH ₂	H	Cl	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	CF ₃ CF ₂	H	Cl	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	CCl ₃	H	Cl	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	MeO	H	Cl	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
Br	Me	H	Br	Me	CH ₂ CO ₂ Et
Br	Et	H	Br	Et	CH ₂ CO ₂ Et
Br	Cl	H	Br	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
Br	Br	H	Br	Br	CH ₂ CO ₂ Et
Br	I	H	Br	I	CH ₂ CO ₂ Et
Br	CF ₂ H	H	Br	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
Br	CF ₃	H	Br	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Br	CF ₃ CH ₂	H	Br	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Br	CF ₃ CF ₂	H	Br	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Br	CCl ₃	H	Br	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Br	MeO	H	Br	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
I	Me	H	I	Me	CH ₂ CO ₂ Et
I	Et	H	I	Et	CH ₂ CO ₂ Et
I	Cl	H	I	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
I	Br	H	I	Br	CH ₂ CO ₂ Et
I	I	H	I	I	CH ₂ CO ₂ Et
I	CF ₂ H	H	I	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
I	CF ₃	H	I	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
I	CF ₃ CH ₂	H	I	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
I	CF ₃ CF ₂	H	I	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
I	CCl ₃	H	I	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
I	MeO	H	I	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	Me	H	CF ₂ H	Me	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	Et	H	CF ₂ H	Et	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	Cl	H	CF ₂ H	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	Br	H	CF ₂ H	Br	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	I	H	CF ₂ H	I	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	CF ₂ H	H	CF ₂ H	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	CF ₃	H	CF ₂ H	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	H	CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	H	CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	CCl ₃	H	CF ₂ H	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	MeO	H	CF ₂ H	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	Me	H	CF ₃	Me	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	Et	H	CF ₃	Et	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	Cl	H	CF ₃	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	Br	H	CF ₃	Br	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	I	H	CF ₃	I	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	CF ₂ H	H	CF ₃	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	CF ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	CF ₃ CF ₂	H	CF ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	CCl ₃	H	CF ₃	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	MeO	H	CF ₃	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	Me	H	CF ₃ CH ₂	Me	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	Et	H	CF ₃ CH ₂	Et	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	Cl	H	CF ₃ CH ₂	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	Br	H	CF ₃ CH ₂	Br	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	I	H	CF ₃ CH ₂	I	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	H	CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	H	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	H	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	CCl ₃	H	CF ₃ CH ₂	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	MeO	H	CF ₃ CH ₂	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	Me	H	CF ₃ CF ₂	Me	CH ₂ CO ₂ Et

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
CF ₃ CF ₂	Et	H	CF ₃ CF ₂	Et	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	Cl	H	CF ₃ CF ₂	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	Br	H	CF ₃ CF ₂	Br	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	I	H	CF ₃ CF ₂	I	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	H	CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	CF ₃	H	CF ₃ CF ₂	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	H	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	H	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	CCl ₃	H	CF ₃ CF ₂	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	MeO	H	CF ₃ CF ₂	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	Me	H	CCl ₃	Me	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	Et	H	CCl ₃	Et	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	Cl	H	CCl ₃	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	Br	H	CCl ₃	Br	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	I	H	CCl ₃	I	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	CF ₂ H	H	CCl ₃	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	CF ₃	H	CCl ₃	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	CF ₃ CH ₂	H	CCl ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	CF ₃ CF ₂	H	CCl ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	CCl ₃	H	CCl ₃	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	MeO	H	CCl ₃	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	Me	H	MeO	Me	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	Et	H	MeO	Et	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	Cl	H	MeO	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	Br	H	MeO	Br	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	I	H	MeO	I	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	CF ₂ H	H	MeO	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	CF ₃	H	MeO	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	CF ₃ CH ₂	H	MeO	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	CF ₃ CF ₂	H	MeO	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	CCl ₃	H	MeO	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	MeO	H	MeO	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
Me	Me	CH ₂ CO ₂ H	Me	Me	CH ₂ C(=O)Cl
Me	Et	CH ₂ CO ₂ H	Me	Et	CH ₂ C(=O)Cl
Me	Cl	CH ₂ CO ₂ H	Me	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
Me	Br	CH ₂ CO ₂ H	Me	Br	CH ₂ C(=O)Cl
Me	I	CH ₂ CO ₂ H	Me	I	CH ₂ C(=O)Cl

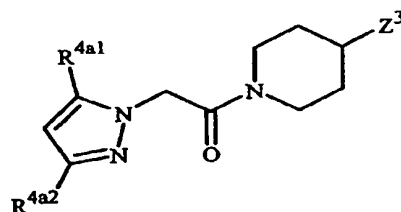
R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
Me	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	Me	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
Me	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	Me	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Me	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	Me	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Me	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	Me	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Me	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	Me	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Me	MeO	CH ₂ CO ₂ H	Me	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
Et	Me	CH ₂ CO ₂ H	Et	Me	CH ₂ C(=O)Cl
Et	Et	CH ₂ CO ₂ H	Et	Et	CH ₂ C(=O)Cl
Et	Cl	CH ₂ CO ₂ H	Et	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
Et	Br	CH ₂ CO ₂ H	Et	Br	CH ₂ C(=O)Cl
Et	I	CH ₂ CO ₂ H	Et	I	CH ₂ C(=O)Cl
Et	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	Et	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
Et	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	Et	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Et	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	Et	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Et	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	Et	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Et	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	Et	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Et	MeO	CH ₂ CO ₂ H	Et	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	Me	CH ₂ CO ₂ H	Cl	Me	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	Et	CH ₂ CO ₂ H	Cl	Et	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	Cl	CH ₂ CO ₂ H	Cl	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	Br	CH ₂ CO ₂ H	Cl	Br	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	I	CH ₂ CO ₂ H	Cl	I	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	Cl	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	Cl	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	Cl	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	Cl	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	Cl	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	MeO	CH ₂ CO ₂ H	Cl	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
Br	Me	CH ₂ CO ₂ H	Br	Me	CH ₂ C(=O)Cl
Br	Et	CH ₂ CO ₂ H	Br	Et	CH ₂ C(=O)Cl
Br	Cl	CH ₂ CO ₂ H	Br	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
Br	Br	CH ₂ CO ₂ H	Br	Br	CH ₂ C(=O)Cl
Br	I	CH ₂ CO ₂ H	Br	I	CH ₂ C(=O)Cl
Br	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	Br	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
Br	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	Br	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Br	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	Br	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Br	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	Br	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
Br	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	Br	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Br	MeO	CH ₂ CO ₂ H	Br	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
I	Me	CH ₂ CO ₂ H	I	Me	CH ₂ C(=O)Cl
I	Et	CH ₂ CO ₂ H	I	Et	CH ₂ C(=O)Cl
I	Cl	CH ₂ CO ₂ H	I	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
I	Br	CH ₂ CO ₂ H	I	Br	CH ₂ C(=O)Cl
I	I	CH ₂ CO ₂ H	I	I	CH ₂ C(=O)Cl
I	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	I	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
I	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	I	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
I	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	I	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
I	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	I	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
I	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	I	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
I	MeO	CH ₂ CO ₂ H	I	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	Me	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	Me	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	Et	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	Et	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	Cl	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	Br	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	Br	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	I	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	I	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	MeO	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	Me	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	Me	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	Et	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	Et	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	Cl	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	Br	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	Br	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	I	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	I	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	MeO	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	Me	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	Me	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	Et	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	Et	CH ₂ C(=O)Cl

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
CF ₃ CH ₂	Cl	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	Br	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	Br	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	I	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	I	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	MeO	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	Me	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	Me	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	Et	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	Et	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	Cl	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	Br	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	Br	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	I	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	I	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	MeO	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	Me	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	Me	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	Et	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	Et	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	Cl	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	Br	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	Br	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	I	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	I	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	MeO	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	Me	CH ₂ CO ₂ H	MeO	Me	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	Et	CH ₂ CO ₂ H	MeO	Et	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	Cl	CH ₂ CO ₂ H	MeO	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	Br	CH ₂ CO ₂ H	MeO	Br	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	I	CH ₂ CO ₂ H	MeO	I	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	MeO	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
MeO	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	MeO	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	MeO	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	MeO	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	MeO	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	MeO	CH ₂ CO ₂ H	MeO	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	Me	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	Me	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	Et	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	Et	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	Cl	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	Br	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	Br	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	I	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	I	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	MeO	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	MeO	CH ₂ C(=O)Cl

TABELA 7



R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³	R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³
Me	Me	CN	Me	Me	C(=S)NH ₂
Me	Et	CN	Me	Et	C(=S)NH ₂
Me	Cl	CN	Me	Cl	C(=S)NH ₂
Me	Br	CN	Me	Br	C(=S)NH ₂
Me	I	CN	Me	I	C(=S)NH ₂
Me	CF ₂ H	CN	Me	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
Me	CF ₃	CN	Me	CF ₃	C(=S)NH ₂
Me	CF ₃ CH ₂	CN	Me	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
Me	CF ₃ CF ₂	CN	Me	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
Me	CCl ₃	CN	Me	CCl ₃	C(=S)NH ₂
Me	MeO	CN	Me	MeO	C(=S)NH ₂
Et	Me	CN	Et	Me	C(=S)NH ₂

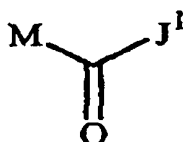
R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³	R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³
Et	Et	CN	Et	Et	C(=S)NH ₂
Et	Cl	CN	Et	Cl	C(=S)NH ₂
Et	Br	CN	Et	Br	C(=S)NH ₂
Et	I	CN	Et	I	C(=S)NH ₂
Et	CF ₂ H	CN	Et	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
Et	CF ₃	CN	Et	CF ₃	C(=S)NH ₂
Et	CF ₃ CH ₂	CN	Et	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
Et	CF ₃ CF ₂	CN	Et	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
Et	CCl ₃	CN	Et	CCl ₃	C(=S)NH ₂
Et	MeO	CN	Et	MeO	C(=S)NH ₂
Cl	Me	CN	Cl	Me	C(=S)NH ₂
Cl	Et	CN	Cl	Et	C(=S)NH ₂
Cl	Cl	CN	Cl	Cl	C(=S)NH ₂
Cl	Br	CN	Cl	Br	C(=S)NH ₂
Cl	I	CN	Cl	I	C(=S)NH ₂
Cl	CF ₂ H	CN	Cl	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
Cl	CF ₃	CN	Cl	CF ₃	C(=S)NH ₂
Cl	CF ₃ CH ₂	CN	Cl	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
Cl	CF ₃ CF ₂	CN	Cl	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
Cl	CCl ₃	CN	Cl	CCl ₃	C(=S)NH ₂
Cl	MeO	CN	Cl	MeO	C(=S)NH ₂
Br	Me	CN	Br	Me	C(=S)NH ₂
Br	Et	CN	Br	Et	C(=S)NH ₂
Br	Cl	CN	Br	Cl	C(=S)NH ₂
Br	Br	CN	Br	Br	C(=S)NH ₂
Br	I	CN	Br	I	C(=S)NH ₂
Br	CF ₂ H	CN	Br	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
Br	CF ₃	CN	Br	CF ₃	C(=S)NH ₂
Br	CF ₃ CH ₂	CN	Br	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
Br	CF ₃ CF ₂	CN	Br	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
Br	CCl ₃	CN	Br	CCl ₃	C(=S)NH ₂
Br	MeO	CN	Br	MeO	C(=S)NH ₂
I	Me	CN	I	Me	C(=S)NH ₂
I	Et	CN	I	Et	C(=S)NH ₂
I	Cl	CN	I	Cl	C(=S)NH ₂
I	Br	CN	I	Br	C(=S)NH ₂
I	I	CN	I	I	C(=S)NH ₂

R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³	R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³
I	CF ₂ H	CN	I	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
I	CF ₃	CN	I	CF ₃	C(=S)NH ₂
I	CF ₃ CH ₂	CN	I	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
I	CF ₃ CF ₂	CN	I	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
I	CCl ₃	CN	I	CCl ₃	C(=S)NH ₂
I	MeO	CN	I	MeO	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	Me	CN	CF ₂ H	Me	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	Et	CN	CF ₂ H	Et	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	Cl	CN	CF ₂ H	Cl	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	Br	CN	CF ₂ H	Br	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	I	CN	CF ₂ H	I	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	CF ₂ H	CN	CF ₂ H	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	CF ₃	CN	CF ₂ H	CF ₃	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CN	CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CN	CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	CCl ₃	CN	CF ₂ H	CCl ₃	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	MeO	CN	CF ₂ H	MeO	C(=S)NH ₂
CF ₃	Me	CN	CF ₃	Me	C(=S)NH ₂
CF ₃	Et	CN	CF ₃	Et	C(=S)NH ₂
CF ₃	Cl	CN	CF ₃	Cl	C(=S)NH ₂
CF ₃	Br	CN	CF ₃	Br	C(=S)NH ₂
CF ₃	I	CN	CF ₃	I	C(=S)NH ₂
CF ₃	CF ₂ H	CN	CF ₃	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
CF ₃	CF ₃	CN	CF ₃	CF ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃	CF ₃ CH ₂	CN	CF ₃	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
CF ₃	CF ₃ CF ₂	CN	CF ₃	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
CF ₃	CCl ₃	CN	CF ₃	CCl ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃	MeO	CN	CF ₃	MeO	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	Me	CN	CF ₃ CH ₂	Me	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	Et	CN	CF ₃ CH ₂	Et	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	Cl	CN	CF ₃ CH ₂	Cl	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	Br	CN	CF ₃ CH ₂	Br	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	I	CN	CF ₃ CH ₂	I	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	CN	CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	CF ₃	CN	CF ₃ CH ₂	CF ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	CN	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	CN	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂

R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³	R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³
CF ₃ CH ₂	CCl ₃	CN	CF ₃ CH ₂	CCl ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	MeO	CN	CF ₃ CH ₂	MeO	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	Me	CN	CF ₃ CF ₂	Me	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	Et	CN	CF ₃ CF ₂	Et	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	Cl	CN	CF ₃ CF ₂	Cl	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	Br	CN	CF ₃ CF ₂	Br	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	I	CN	CF ₃ CF ₂	I	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	CN	CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	CF ₃	CN	CF ₃ CF ₂	CF ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	CN	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	CN	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	CCl ₃	CN	CF ₃ CF ₂	CCl ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	MeO	CN	CF ₃ CF ₂	MeO	C(=S)NH ₂
CCl ₃	Me	CN	CCl ₃	Me	C(=S)NH ₂
CCl ₃	Et	CN	CCl ₃	Et	C(=S)NH ₂
CCl ₃	Cl	CN	CCl ₃	Cl	C(=S)NH ₂
CCl ₃	Br	CN	CCl ₃	Br	C(=S)NH ₂
CCl ₃	I	CN	CCl ₃	I	C(=S)NH ₂
CCl ₃	CF ₂ H	CN	CCl ₃	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
CCl ₃	CF ₃	CN	CCl ₃	CF ₃	C(=S)NH ₂
CCl ₃	CF ₃ CH ₂	CN	CCl ₃	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
CCl ₃	CF ₃ CF ₂	CN	CCl ₃	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
CCl ₃	CCl ₃	CN	CCl ₃	CCl ₃	C(=S)NH ₂
CCl ₃	MeO	CN	CCl ₃	MeO	C(=S)NH ₂
MeO	Me	CN	MeO	Me	C(=S)NH ₂
MeO	Et	CN	MeO	Et	C(=S)NH ₂
MeO	Cl	CN	MeO	Cl	C(=S)NH ₂
MeO	Br	CN	MeO	Br	C(=S)NH ₂
MeO	I	CN	MeO	I	C(=S)NH ₂
MeO	CF ₂ H	CN	MeO	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
MeO	CF ₃	CN	MeO	CF ₃	C(=S)NH ₂
MeO	CF ₃ CH ₂	CN	MeO	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
MeO	CF ₃ CF ₂	CN	MeO	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
MeO	CCl ₃	CN	MeO	CCl ₃	C(=S)NH ₂
MeO	MeO	CN	MeO	MeO	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	Me	CN	OCF ₂ H	Me	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	Et	CN	OCF ₂ H	Et	C(=S)NH ₂

R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³	R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³
OCF ₂ H	Cl	CN	OCF ₂ H	Cl	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	Br	CN	OCF ₂ H	Br	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	I	CN	OCF ₂ H	I	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	CF ₂ H	CN	OCF ₂ H	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	CF ₃	CN	OCF ₂ H	CF ₃	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CN	OCF ₂ H	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CN	OCF ₂ H	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	CCl ₃	CN	OCF ₂ H	CCl ₃	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	MeO	CN	OCF ₂ H	MeO	C(=S)NH ₂

TABELA 8



em que J¹ é um dentre J-29-1 a J-29-58 (conforme exibido na Ilustração A acima).

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
CH ₃	J-29-1	CH ₂ Br	J-29-2	OH	J-29-3
CH ₂ Cl	J-29-1	CH ₂ I	J-29-2	OMe	J-29-3
CH ₂ Br	J-29-1	OH	J-29-2	OEt	J-29-3
CH ₂ I	J-29-1	OMe	J-29-2	OPr	J-29-3
OH	J-29-1	OEt	J-29-2	O- <i>i</i> -Pr	J-29-3
OMe	J-29-1	OPr	J-29-2	O- <i>n</i> -Bu	J-29-3
OEt	J-29-1	O- <i>i</i> -Pr	J-29-2	O- <i>t</i> -Bu	J-29-3
OPr	J-29-1	O- <i>n</i> -Bu	J-29-2	NMe ₂	J-29-3
O- <i>i</i> -Pr	J-29-1	O- <i>t</i> -Bu	J-29-2	NEt ₂	J-29-3
O- <i>n</i> -Bu	J-29-1	NMe ₂	J-29-2	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-3
O- <i>t</i> -Bu	J-29-1	NEt ₂	J-29-2	1-piperdinyll	J-29-3
NMe ₂	J-29-1	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-2	1-pyrrolidinyll	J-29-3
NEt ₂	J-29-1	1-piperdinyll	J-29-2	4-morpholinyll	J-29-3
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-1	1-pyrrolidinyll	J-29-2	CH ₃	J-29-4
1-piperdinyll	J-29-1	4-morpholinyll	J-29-2	CH ₂ Cl	J-29-4
1-pyrrolidinyll	J-29-1	CH ₃	J-29-3	CH ₂ Br	J-29-4
4-morpholinyll	J-29-1	CH ₂ Cl	J-29-3	CH ₂ I	J-29-4
CH ₃	J-29-2	CH ₂ Br	J-29-3	OH	J-29-4
CH ₂ Cl	J-29-2	CH ₂ I	J-29-3	OMe	J-29-4

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
OE _t	J-29-4	O- <i>n</i> -Bu	J-29-6	NE _t ₂	J-29-8
OP _r	J-29-4	O- <i>t</i> -Bu	J-29-6	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-8
O- <i>i</i> -Pr	J-29-4	NMe ₂	J-29-6	1-piperdiny _l	J-29-8
O- <i>n</i> -Bu	J-29-4	NE _t ₂	J-29-6	1-pyrrolidiny _l	J-29-8
O- <i>t</i> -Bu	J-29-4	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-6	4-morpholiny _l	J-29-8
NMe ₂	J-29-4	1-piperdiny _l	J-29-6	CH ₃	J-29-9
NE _t ₂	J-29-4	1-pyrrolidiny _l	J-29-6	CH ₂ Cl	J-29-9
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-4	4-morpholiny _l	J-29-6	CH ₂ Br	J-29-9
1-piperdiny _l	J-29-4	CH ₃	J-29-7	CH ₂ I	J-29-9
1-pyrrolidiny _l	J-29-4	CH ₂ Cl	J-29-7	OH	J-29-9
4-morpholiny _l	J-29-4	CH ₂ Br	J-29-7	OMe	J-29-9
CH ₃	J-29-5	CH ₂ I	J-29-7	OE _t	J-29-9
CH ₂ Cl	J-29-5	OH	J-29-7	OP _r	J-29-9
CH ₂ Br	J-29-5	OMe	J-29-7	O- <i>i</i> -Pr	J-29-9
CH ₂ I	J-29-5	OE _t	J-29-7	O- <i>n</i> -Bu	J-29-9
OH	J-29-5	OP _r	J-29-7	O- <i>t</i> -Bu	J-29-9
OMe	J-29-5	O- <i>i</i> -Pr	J-29-7	NMe ₂	J-29-9
OE _t	J-29-5	O- <i>n</i> -Bu	J-29-7	NE _t ₂	J-29-9
OP _r	J-29-5	O- <i>t</i> -Bu	J-29-7	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-9
O- <i>i</i> -Pr	J-29-5	NMe ₂	J-29-7	1-piperdiny _l	J-29-9
O- <i>n</i> -Bu	J-29-5	NE _t ₂	J-29-7	1-pyrrolidiny _l	J-29-9
O- <i>t</i> -Bu	J-29-5	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-7	4-morpholiny _l	J-29-9
NMe ₂	J-29-5	1-piperdiny _l	J-29-7	CH ₃	J-29-10
NE _t ₂	J-29-5	1-pyrrolidiny _l	J-29-7	CH ₂ Cl	J-29-10
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-5	4-morpholiny _l	J-29-7	CH ₂ Br	J-29-10
1-piperdiny _l	J-29-5	CH ₃	J-29-8	CH ₂ I	J-29-10
1-pyrrolidiny _l	J-29-5	CH ₂ Cl	J-29-8	OH	J-29-10
4-morpholiny _l	J-29-5	CH ₂ Br	J-29-8	OMe	J-29-10
CH ₃	J-29-6	CH ₂ I	J-29-8	OE _t	J-29-10
CH ₂ Cl	J-29-6	OH	J-29-8	OP _r	J-29-10
CH ₂ Br	J-29-6	OMe	J-29-8	O- <i>i</i> -Pr	J-29-10
CH ₂ I	J-29-6	OE _t	J-29-8	O- <i>n</i> -Bu	J-29-10
OH	J-29-6	OP _r	J-29-8	O- <i>t</i> -Bu	J-29-10
OMe	J-29-6	O- <i>i</i> -Pr	J-29-8	NMe ₂	J-29-10
OE _t	J-29-6	O- <i>n</i> -Bu	J-29-8	NE _t ₂	J-29-10
OP _r	J-29-6	O- <i>t</i> -Bu	J-29-8	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-10
O- <i>i</i> -Pr	J-29-6	NMe ₂	J-29-8	1-piperdiny _l	J-29-10

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
1-pyrrolidinyl	J-29-10	CH ₂ Cl	J-29-13	OH	J-29-15
4-morpholinyl	J-29-10	CH ₂ Br	J-29-13	OMe	J-29-15
CH ₃	J-29-11	CH ₂ I	J-29-13	OEt	J-29-15
CH ₂ Cl	J-29-11	OH	J-29-13	OPr	J-29-15
CH ₂ Br	J-29-11	OMe	J-29-13	O- <i>i</i> -Pr	J-29-15
CH ₂ I	J-29-11	OEt	J-29-13	O- <i>n</i> -Bu	J-29-15
OH	J-29-11	OPr	J-29-13	O- <i>t</i> -Bu	J-29-15
OMe	J-29-11	O- <i>i</i> -Pr	J-29-13	NMe ₂	J-29-15
OEt	J-29-11	O- <i>n</i> -Bu	J-29-13	NEt ₂	J-29-15
OPr	J-29-11	O- <i>t</i> -Bu	J-29-13	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-15
O- <i>i</i> -Pr	J-29-11	NMe ₂	J-29-13	1-piperdiny1	J-29-15
O- <i>n</i> -Bu	J-29-11	NEt ₂	J-29-13	1-pyrrolidinyl	J-29-15
O- <i>t</i> -Bu	J-29-11	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-13	4-morpholinyl	J-29-15
NMe ₂	J-29-11	1-piperdiny1	J-29-13	CH ₃	J-29-16
NEt ₂	J-29-11	1-pyrrolidinyl	J-29-13	CH ₂ Cl	J-29-16
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-11	4-morpholinyl	J-29-13	CH ₂ Br	J-29-16
1-piperdiny1	J-29-11	CH ₃	J-29-14	CH ₂ I	J-29-16
1-pyrrolidinyl	J-29-11	CH ₂ Cl	J-29-14	OH	J-29-16
4-morpholinyl	J-29-11	CH ₂ Br	J-29-14	OMe	J-29-16
CH ₃	J-29-12	CH ₂ I	J-29-14	OEt	J-29-16
CH ₂ Cl	J-29-12	OH	J-29-14	OPr	J-29-16
CH ₂ Br	J-29-12	OMe	J-29-14	O- <i>i</i> -Pr	J-29-16
CH ₂ I	J-29-12	OEt	J-29-14	O- <i>n</i> -Bu	J-29-16
OH	J-29-12	OPr	J-29-14	O- <i>t</i> -Bu	J-29-16
OMe	J-29-12	O- <i>i</i> -Pr	J-29-14	NMe ₂	J-29-16
OEt	J-29-12	O- <i>n</i> -Bu	J-29-14	NEt ₂	J-29-16
OPr	J-29-12	O- <i>t</i> -Bu	J-29-14	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-16
O- <i>i</i> -Pr	J-29-12	NMe ₂	J-29-14	1-piperdiny1	J-29-16
O- <i>n</i> -Bu	J-29-12	NEt ₂	J-29-14	1-pyrrolidinyl	J-29-16
O- <i>t</i> -Bu	J-29-12	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-14	4-morpholinyl	J-29-16
NMe ₂	J-29-12	1-piperdiny1	J-29-14	CH ₃	J-29-17
NEt ₂	J-29-12	1-pyrrolidinyl	J-29-14	CH ₂ Cl	J-29-17
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-12	4-morpholinyl	J-29-14	CH ₂ Br	J-29-17
1-piperdiny1	J-29-12	CH ₃	J-29-15	CH ₂ I	J-29-17
1-pyrrolidinyl	J-29-12	CH ₂ Cl	J-29-15	OH	J-29-17
4-morpholinyl	J-29-12	CH ₂ Br	J-29-15	OMe	J-29-17
CH ₃	J-29-13	CH ₂ I	J-29-15	OEt	J-29-17

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
OPr	J-29-17	O- <i>i</i> -Bu	J-29-19	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-21
O- <i>i</i> -Pr	J-29-17	NMe ₂	J-29-19	1-piperdiny1	J-29-21
O- <i>n</i> -Bu	J-29-17	NEt ₂	J-29-19	1-pyrrolidinyl	J-29-21
O- <i>t</i> -Bu	J-29-17	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-19	4-morpholinyl	J-29-21
NMe ₂	J-29-17	1-piperdiny1	J-29-19	CH ₃	J-29-22
NEt ₂	J-29-17	1-pyrrolidinyl	J-29-19	CH ₂ Cl	J-29-22
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-17	4-morpholinyl	J-29-19	CH ₂ Br	J-29-22
1-piperdiny1	J-29-17	CH ₃	J-29-20	CH ₂ I	J-29-22
1-pyrrolidinyl	J-29-17	CH ₂ Cl	J-29-20	OH	J-29-22
4-morpholinyl	J-29-17	CH ₂ Br	J-29-20	OMe	J-29-22
CH ₃	J-29-18	CH ₂ I	J-29-20	OEt	J-29-22
CH ₂ Cl	J-29-18	OH	J-29-20	OPr	J-29-22
CH ₂ Br	J-29-18	OMe	J-29-20	O- <i>i</i> -Pr	J-29-22
CH ₂ I	J-29-18	OEt	J-29-20	O- <i>n</i> -Bu	J-29-22
OH	J-29-18	OPr	J-29-20	O- <i>t</i> -Bu	J-29-22
OMe	J-29-18	O- <i>i</i> -Pr	J-29-20	NMe ₂	J-29-22
OEt	J-29-18	O- <i>n</i> -Bu	J-29-20	NEt ₂	J-29-22
OPr	J-29-18	O- <i>t</i> -Bu	J-29-20	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-22
O- <i>i</i> -Pr	J-29-18	NMe ₂	J-29-20	1-piperdiny1	J-29-22
O- <i>n</i> -Bu	J-29-18	NEt ₂	J-29-20	1-pyrrolidinyl	J-29-22
O- <i>t</i> -Bu	J-29-18	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-20	4-morpholinyl	J-29-22
NMe ₂	J-29-18	1-piperdiny1	J-29-20	CH ₃	J-29-23
NEt ₂	J-29-18	1-pyrrolidinyl	J-29-20	CH ₂ Cl	J-29-23
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-18	4-morpholinyl	J-29-20	CH ₂ Br	J-29-23
1-piperdiny1	J-29-18	CH ₃	J-29-21	CH ₂ I	J-29-23
1-pyrrolidinyl	J-29-18	CH ₂ Cl	J-29-21	OH	J-29-23
4-morpholinyl	J-29-18	CH ₂ Br	J-29-21	OMe	J-29-23
CH ₃	J-29-19	CH ₂ I	J-29-21	OEt	J-29-23
CH ₂ Cl	J-29-19	OH	J-29-21	OPr	J-29-23
CH ₂ Br	J-29-19	OMe	J-29-21	O- <i>i</i> -Pr	J-29-23
CH ₂ I	J-29-19	OEt	J-29-21	O- <i>n</i> -Bu	J-29-23
OH	J-29-19	OPr	J-29-21	O- <i>t</i> -Bu	J-29-23
OMe	J-29-19	O- <i>i</i> -Pr	J-29-21	NMe ₂	J-29-23
OEt	J-29-19	O- <i>n</i> -Bu	J-29-21	NEt ₂	J-29-23
OPr	J-29-19	O- <i>t</i> -Bu	J-29-21	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-23
O- <i>i</i> -Pr	J-29-19	NMe ₂	J-29-21	1-piperdiny1	J-29-23
O- <i>n</i> -Bu	J-29-19	NEt ₂	J-29-21	1-pyrrolidinyl	J-29-23

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
4-morpholinyl	J-29-23	CH ₂ Br	J-29-26	OMe	J-29-28
CH ₃	J-29-24	CH ₂ I	J-29-26	OEt	J-29-28
CH ₂ Cl	J-29-24	OH	J-29-26	OPr	J-29-28
CH ₂ Br	J-29-24	OMe	J-29-26	O- <i>i</i> -Pr	J-29-28
CH ₂ I	J-29-24	OEt	J-29-26	O- <i>n</i> -Bu	J-29-28
OH	J-29-24	OPr	J-29-26	O- <i>t</i> -Bu	J-29-28
OMe	J-29-24	O- <i>i</i> -Pr	J-29-26	NMe ₂	J-29-28
OEt	J-29-24	O- <i>n</i> -Bu	J-29-26	NEt ₂	J-29-28
OPr	J-29-24	O- <i>t</i> -Bu	J-29-26	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-28
O- <i>i</i> -Pr	J-29-24	NMe ₂	J-29-26	1-piperdinyI	J-29-28
O- <i>n</i> -Bu	J-29-24	NEt ₂	J-29-26	1-pyrrolidinyI	J-29-28
O- <i>t</i> -Bu	J-29-24	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-26	4-morpholinyl	J-29-28
NMe ₂	J-29-24	1-piperdinyI	J-29-26	CH ₃	J-29-29
NEt ₂	J-29-24	1-pyrrolidinyI	J-29-26	CH ₂ Cl	J-29-29
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-24	4-morpholinyl	J-29-26	CH ₂ Br	J-29-29
1-piperdinyI	J-29-24	CH ₃	J-29-27	CH ₂ I	J-29-29
1-pyrrolidinyI	J-29-24	CH ₂ Cl	J-29-27	OH	J-29-29
4-morpholinyl	J-29-24	CH ₂ Br	J-29-27	OMe	J-29-29
CH ₃	J-29-25	CH ₂ I	J-29-27	OEt	J-29-29
CH ₂ Cl	J-29-25	OH	J-29-27	OPr	J-29-29
CH ₂ Br	J-29-25	OMe	J-29-27	O- <i>i</i> -Pr	J-29-29
CH ₂ I	J-29-25	OEt	J-29-27	O- <i>n</i> -Bu	J-29-29
OH	J-29-25	OPr	J-29-27	O- <i>t</i> -Bu	J-29-29
OMe	J-29-25	O- <i>i</i> -Pr	J-29-27	NMe ₂	J-29-29
OEt	J-29-25	O- <i>n</i> -Bu	J-29-27	NEt ₂	J-29-29
OPr	J-29-25	O- <i>t</i> -Bu	J-29-27	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-29
O- <i>i</i> -Pr	J-29-25	NMe ₂	J-29-27	1-piperdinyI	J-29-29
O- <i>n</i> -Bu	J-29-25	NEt ₂	J-29-27	1-pyrrolidinyI	J-29-29
O- <i>t</i> -Bu	J-29-25	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-27	4-morpholinyl	J-29-29
NMe ₂	J-29-25	1-piperdinyI	J-29-27	CH ₃	J-29-30
NEt ₂	J-29-25	1-pyrrolidinyI	J-29-27	CH ₂ Cl	J-29-30
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-25	4-morpholinyl	J-29-27	CH ₂ Br	J-29-30
1-piperdinyI	J-29-25	CH ₃	J-29-28	CH ₂ I	J-29-30
1-pyrrolidinyI	J-29-25	CH ₂ Cl	J-29-28	OH	J-29-30
4-morpholinyl	J-29-25	CH ₂ Br	J-29-28	OMe	J-29-30
CH ₃	J-29-26	CH ₂ I	J-29-28	OEt	J-29-30
CH ₂ Cl	J-29-26	OH	J-29-28	OPr	J-29-30

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
O- <i>i</i> -Pr	J-29-30	NMe ₂	J-29-32	1-piperdiny1	J-29-34
O- <i>n</i> -Bu	J-29-30	NEt ₂	J-29-32	1-pyrrolidiny1	J-29-34
O- <i>t</i> -Bu	J-29-30	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-32	4-morpholiny1	J-29-34
NMe ₂	J-29-30	1-piperdiny1	J-29-32	CH ₃	J-29-35
NEt ₂	J-29-30	1-pyrrolidiny1	J-29-32	CH ₂ Cl	J-29-35
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-30	4-morpholiny1	J-29-32	CH ₂ Br	J-29-35
1-piperdiny1	J-29-30	CH ₃	J-29-33	CH ₂ I	J-29-35
1-pyrrolidiny1	J-29-30	CH ₂ Cl	J-29-33	OH	J-29-35
4-morpholiny1	J-29-30	CH ₂ Br	J-29-33	OMe	J-29-35
CH ₃	J-29-31	CH ₂ I	J-29-33	OEt	J-29-35
CH ₂ Cl	J-29-31	OH	J-29-33	OPr	J-29-35
CH ₂ Br	J-29-31	OMe	J-29-33	O- <i>i</i> -Pr	J-29-35
CH ₂ I	J-29-31	OEt	J-29-33	O- <i>n</i> -Bu	J-29-35
OH	J-29-31	OPr	J-29-33	O- <i>t</i> -Bu	J-29-35
OMe	J-29-31	O- <i>i</i> -Pr	J-29-33	NMe ₂	J-29-35
OEt	J-29-31	O- <i>n</i> -Bu	J-29-33	NEt ₂	J-29-35
OPr	J-29-31	O- <i>t</i> -Bu	J-29-33	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-35
O- <i>i</i> -Pr	J-29-31	NMe ₂	J-29-33	1-piperdiny1	J-29-35
O- <i>n</i> -Bu	J-29-31	NEt ₂	J-29-33	1-pyrrolidiny1	J-29-35
O- <i>t</i> -Bu	J-29-31	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-33	4-morpholiny1	J-29-35
NMe ₂	J-29-31	1-piperdiny1	J-29-33	CH ₃	J-29-36
NEt ₂	J-29-31	1-pyrrolidiny1	J-29-33	CH ₂ Cl	J-29-36
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-31	4-morpholiny1	J-29-33	CH ₂ Br	J-29-36
1-piperdiny1	J-29-31	CH ₃	J-29-34	CH ₂ I	J-29-36
1-pyrrolidiny1	J-29-31	CH ₂ Cl	J-29-34	OH	J-29-36
4-morpholiny1	J-29-31	CH ₂ Br	J-29-34	OMe	J-29-36
CH ₃	J-29-32	CH ₂ I	J-29-34	OEt	J-29-36
CH ₂ Cl	J-29-32	OH	J-29-34	OPr	J-29-36
CH ₂ Br	J-29-32	OMe	J-29-34	O- <i>i</i> -Pr	J-29-36
CH ₂ I	J-29-32	OEt	J-29-34	O- <i>n</i> -Bu	J-29-36
OH	J-29-32	OPr	J-29-34	O- <i>t</i> -Bu	J-29-36
OMe	J-29-32	O- <i>i</i> -Pr	J-29-34	NMe ₂	J-29-36
OEt	J-29-32	O- <i>n</i> -Bu	J-29-34	NEt ₂	J-29-36
OPr	J-29-32	O- <i>t</i> -Bu	J-29-34	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-36
O- <i>i</i> -Pr	J-29-32	NMe ₂	J-29-34	1-piperdiny1	J-29-36
O- <i>n</i> -Bu	J-29-32	NEt ₂	J-29-34	1-pyrrolidiny1	J-29-36
O- <i>t</i> -Bu	J-29-32	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-34	4-morpholiny1	J-29-36

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
CH ₃	J-29-37	CH ₂ I	J-29-39	OEt	J-29-41
CH ₂ Cl	J-29-37	OH	J-29-39	OPr	J-29-41
CH ₂ Br	J-29-37	OMe	J-29-39	O- <i>i</i> -Pr	J-29-41
CH ₂ I	J-29-37	OEt	J-29-39	O- <i>n</i> -Bu	J-29-41
OH	J-29-37	OPr	J-29-39	O- <i>t</i> -Bu	J-29-41
OMe	J-29-37	O- <i>i</i> -Pr	J-29-39	NMe ₂	J-29-41
OEt	J-29-37	O- <i>n</i> -Bu	J-29-39	NEt ₂	J-29-41
OPr	J-29-37	O- <i>t</i> -Bu	J-29-39	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-41
O- <i>i</i> -Pr	J-29-37	NMe ₂	J-29-39	1-piperdinyI	J-29-41
O- <i>n</i> -Bu	J-29-37	NEt ₂	J-29-39	1-pyrrolidinyI	J-29-41
O- <i>t</i> -Bu	J-29-37	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-39	4-morpholinyI	J-29-41
NMe ₂	J-29-37	1-piperdinyI	J-29-39	CH ₃	J-29-42
NEt ₂	J-29-37	1-pyrrolidinyI	J-29-39	CH ₂ Cl	J-29-42
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-37	4-morpholinyI	J-29-39	CH ₂ Br	J-29-42
1-piperdinyI	J-29-37	CH ₃	J-29-40	CH ₂ I	J-29-42
1-pyrrolidinyI	J-29-37	CH ₂ Cl	J-29-40	OH	J-29-42
4-morpholinyI	J-29-37	CH ₂ Br	J-29-40	OMe	J-29-42
CH ₃	J-29-38	CH ₂ I	J-29-40	OEt	J-29-42
CH ₂ Cl	J-29-38	OH	J-29-40	OPr	J-29-42
CH ₂ Br	J-29-38	OMe	J-29-40	O- <i>i</i> -Pr	J-29-42
CH ₂ I	J-29-38	OEt	J-29-40	O- <i>n</i> -Bu	J-29-42
OH	J-29-38	OPr	J-29-40	O- <i>t</i> -Bu	J-29-42
OMe	J-29-38	O- <i>i</i> -Pr	J-29-40	NMe ₂	J-29-42
OEt	J-29-38	O- <i>n</i> -Bu	J-29-40	NEt ₂	J-29-42
OPr	J-29-38	O- <i>t</i> -Bu	J-29-40	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-42
O- <i>i</i> -Pr	J-29-38	NMe ₂	J-29-40	1-piperdinyI	J-29-42
O- <i>n</i> -Bu	J-29-38	NEt ₂	J-29-40	1-pyrrolidinyI	J-29-42
O- <i>t</i> -Bu	J-29-38	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-40	4-morpholinyI	J-29-42
NMe ₂	J-29-38	1-piperdinyI	J-29-40	CH ₃	J-29-43
NEt ₂	J-29-38	1-pyrrolidinyI	J-29-40	CH ₂ Cl	J-29-43
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-38	4-morpholinyI	J-29-40	CH ₂ Br	J-29-43
1-piperdinyI	J-29-38	CH ₃	J-29-41	CH ₂ I	J-29-43
1-pyrrolidinyI	J-29-38	CH ₂ Cl	J-29-41	OH	J-29-43
4-morpholinyI	J-29-38	CH ₂ Br	J-29-41	OMe	J-29-43
CH ₃	J-29-39	CH ₂ I	J-29-41	OEt	J-29-43
CH ₂ Cl	J-29-39	OH	J-29-41	OPr	J-29-43
CH ₂ Br	J-29-39	OMe	J-29-41	O- <i>i</i> -Pr	J-29-43

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
O- <i>n</i> -Bu	J-29-43	NEt ₂	J-29-45	1-pyrrolidinyI	J-29-47
O- <i>t</i> -Bu	J-29-43	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-45	4-morpholinyl	J-29-47
NMe ₂	J-29-43	1-piperdinyI	J-29-45	CH ₃	J-29-48
NEt ₂	J-29-43	1-pyrrolidinyI	J-29-45	CH ₂ Cl	J-29-48
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-43	4-morpholinyl	J-29-45	CH ₂ Br	J-29-48
1-piperdinyI	J-29-43	CH ₃	J-29-46	CH ₂ I	J-29-48
1-pyrrolidinyI	J-29-43	CH ₂ Cl	J-29-46	OH	J-29-48
4-morpholinyl	J-29-43	CH ₂ Br	J-29-46	OMe	J-29-48
CH ₃	J-29-44	CH ₂ I	J-29-46	OEt	J-29-48
CH ₂ Cl	J-29-44	OH	J-29-46	OPr	J-29-48
CH ₂ Br	J-29-44	OMe	J-29-46	O- <i>i</i> -Pr	J-29-48
CH ₂ I	J-29-44	OEt	J-29-46	O- <i>n</i> -Bu	J-29-48
OH	J-29-44	OPr	J-29-46	O- <i>t</i> -Bu	J-29-48
OMe	J-29-44	O- <i>i</i> -Pr	J-29-46	NMe ₂	J-29-48
OEt	J-29-44	O- <i>n</i> -Bu	J-29-46	NEt ₂	J-29-48
OPr	J-29-44	O- <i>t</i> -Bu	J-29-46	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-48
O- <i>i</i> -Pr	J-29-44	NMe ₂	J-29-46	1-piperdinyI	J-29-48
O- <i>n</i> -Bu	J-29-44	NEt ₂	J-29-46	1-pyrrolidinyI	J-29-48
O- <i>t</i> -Bu	J-29-44	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-46	4-morpholinyl	J-29-48
NMe ₂	J-29-44	1-piperdinyI	J-29-46	CH ₃	J-29-49
NEt ₂	J-29-44	1-pyrrolidinyI	J-29-46	CH ₂ Cl	J-29-49
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-44	4-morpholinyl	J-29-46	CH ₂ Br	J-29-49
1-piperdinyI	J-29-44	CH ₃	J-29-47	CH ₂ I	J-29-49
1-pyrrolidinyI	J-29-44	CH ₂ Cl	J-29-47	OH	J-29-49
4-morpholinyl	J-29-44	CH ₂ Br	J-29-47	OMe	J-29-49
CH ₃	J-29-45	CH ₂ I	J-29-47	OEt	J-29-49
CH ₂ Cl	J-29-45	OH	J-29-47	OPr	J-29-49
CH ₂ Br	J-29-45	OMe	J-29-47	O- <i>i</i> -Pr	J-29-49
CH ₂ I	J-29-45	OEt	J-29-47	O- <i>n</i> -Bu	J-29-49
OH	J-29-45	OPr	J-29-47	O- <i>t</i> -Bu	J-29-49
OMe	J-29-45	O- <i>i</i> -Pr	J-29-47	NMe ₂	J-29-49
OEt	J-29-45	O- <i>n</i> -Bu	J-29-47	NEt ₂	J-29-49
OPr	J-29-45	O- <i>t</i> -Bu	J-29-47	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-49
O- <i>i</i> -Pr	J-29-45	NMe ₂	J-29-47	1-piperdinyI	J-29-49
O- <i>n</i> -Bu	J-29-45	NEt ₂	J-29-47	1-pyrrolidinyI	J-29-49
O- <i>t</i> -Bu	J-29-45	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-47	4-morpholinyl	J-29-49
NMe ₂	J-29-45	1-piperdinyI	J-29-47	CH ₃	J-29-50

M	Jl	M	Jl	M	Jl
CH ₂ Cl	J-29-50	OH	J-29-52	OPr	J-29-54
CH ₂ Br	J-29-50	OMe	J-29-52	O- <i>i</i> -Pr	J-29-54
CH ₂ I	J-29-50	OEt	J-29-52	O- <i>n</i> -Bu	J-29-54
OH	J-29-50	OPr	J-29-52	O- <i>t</i> -Bu	J-29-54
OMe	J-29-50	O- <i>i</i> -Pr	J-29-52	NMe ₂	J-29-54
OEt	J-29-50	O- <i>n</i> -Bu	J-29-52	NEt ₂	J-29-54
OPr	J-29-50	O- <i>t</i> -Bu	J-29-52	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-54
O- <i>i</i> -Pr	J-29-50	NMe ₂	J-29-52	1-piperdinyI	J-29-54
O- <i>n</i> -Bu	J-29-50	NEt ₂	J-29-52	1-pyrrolidinyI	J-29-54
O- <i>t</i> -Bu	J-29-50	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-52	4-morpholinyI	J-29-54
NMe ₂	J-29-50	1-piperdinyI	J-29-52	CH ₃	J-29-55
NEt ₂	J-29-50	1-pyrrolidinyI	J-29-52	CH ₂ Cl	J-29-55
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-50	4-morpholinyI	J-29-52	CH ₂ Br	J-29-55
1-piperdinyI	J-29-50	CH ₃	J-29-53	CH ₂ I	J-29-55
1-pyrrolidinyI	J-29-50	CH ₂ Cl	J-29-53	OH	J-29-55
4-morpholinyI	J-29-50	CH ₂ Br	J-29-53	OMe	J-29-55
CH ₃	J-29-51	CH ₂ I	J-29-53	OEt	J-29-55
CH ₂ Cl	J-29-51	OH	J-29-53	OPr	J-29-55
CH ₂ Br	J-29-51	OMe	J-29-53	O- <i>i</i> -Pr	J-29-55
CH ₂ I	J-29-51	OEt	J-29-53	O- <i>n</i> -Bu	J-29-55
OH	J-29-51	OPr	J-29-53	O- <i>t</i> -Bu	J-29-55
OMe	J-29-51	O- <i>i</i> -Pr	J-29-53	NMe ₂	J-29-55
OEt	J-29-51	O- <i>n</i> -Bu	J-29-53	NEt ₂	J-29-55
OPr	J-29-51	O- <i>t</i> -Bu	J-29-53	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-55
O- <i>i</i> -Pr	J-29-51	NMe ₂	J-29-53	1-piperdinyI	J-29-55
O- <i>n</i> -Bu	J-29-51	NEt ₂	J-29-53	1-pyrrolidinyI	J-29-55
O- <i>t</i> -Bu	J-29-51	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-53	4-morpholinyI	J-29-55
NMe ₂	J-29-51	1-piperdinyI	J-29-53	CH ₃	J-29-56
NEt ₂	J-29-51	1-pyrrolidinyI	J-29-53	CH ₂ Cl	J-29-56
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-51	4-morpholinyI	J-29-53	CH ₂ Br	J-29-56
1-piperdinyI	J-29-51	CH ₃	J-29-54	CH ₂ I	J-29-56
1-pyrrolidinyI	J-29-51	CH ₂ Cl	J-29-54	OH	J-29-56
4-morpholinyI	J-29-51	CH ₂ Br	J-29-54	OMe	J-29-56
CH ₃	J-29-52	CH ₂ I	J-29-54	OEt	J-29-56
CH ₂ Cl	J-29-52	OH	J-29-54	OPr	J-29-56
CH ₂ Br	J-29-52	OMe	J-29-54	O- <i>i</i> -Pr	J-29-56
CH ₂ I	J-29-52	OEt	J-29-54	O- <i>n</i> -Bu	J-29-56

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
O- <i>i</i> -Bu	J-29-56	OPr	J-29-57	OH	J-29-58
NMe ₂	J-29-56	O- <i>i</i> -Pr	J-29-57	OMe	J-29-58
NEt ₂	J-29-56	O- <i>n</i> -Bu	J-29-57	OEt	J-29-58
N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-56	O- <i>t</i> -Bu	J-29-57	OPr	J-29-58
1-piperdinyI	J-29-56	NMe ₂	J-29-57	O- <i>i</i> -Pr	J-29-58
1-pyrrolidinyI	J-29-56	NEt ₂	J-29-57	O- <i>n</i> -Bu	J-29-58
4-morpholinyI	J-29-56	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-57	O- <i>t</i> -Bu	J-29-58
CH ₃	J-29-57	1-piperdinyI	J-29-57	NMe ₂	J-29-58
CH ₂ Cl	J-29-57	1-pyrrolidinyI	J-29-57	NEt ₂	J-29-58
CH ₂ Br	J-29-57	4-morpholinyI	J-29-57	N(<i>n</i> -Pr) ₂	J-29-58
CH ₂ I	J-29-57	CH ₃	J-29-58	1-piperdinyI	J-29-58
OH	J-29-57	CH ₂ Cl	J-29-58	1-pyrrolidinyI	J-29-58
OMe	J-29-57	CH ₂ Br	J-29-58	4-morpholinyI	J-29-58
OEt	J-29-57	CH ₂ I	J-29-58		

A Tabela 8 acima identifica compostos específicos que compreendem um grupo J¹ selecionado a partir de J-29-1 a J-29-58. Como muitos J-29-1 a J-29-58 incluem um centro quiral, estes grupos J¹ são ilustrados em uma configuração enantiomérica específica que, em alguns casos pode fornecer a maior atividade fungicida para compostos da Fórmula 1. Os técnicos no assunto reconhecem imediatamente o antípodo (ou seja, enantiômero oposto) para cada um dos compostos relacionados e, além disso, compreende que os enantiômeros podem estar presentes na forma de enantiômeros puros ou em misturas enriquecidas em um enantiômero ou em misturas racêmicas.

FORMULAÇÃO/UTILIDADE

Um composto da Fórmula 1 de acordo com a presente invenção geralmente será utilizado como ingrediente ativo fungicida em uma composição, ou seja formulação, com pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos, que serve de veículo. Os ingredientes da composição ou formulação são selecionados para que sejam consistentes com as propriedades físicas do ingrediente ativo, modo de aplicação e fatores

ambientais tais como tipo de solo, umidade e temperatura.

Formulações úteis incluem composições líquidas e sólidas. As composições líquidas incluem soluções (incluindo concentrados emulsionáveis), suspensões, emulsões (incluindo microemulsões e/ou 5 suspoemulsões) e similares, que podem ser opcionalmente espessadas na forma de géis. Os tipos gerais de composições líquidas aquosas são concentrado solúvel, concentrado em suspensão, suspensão de cápsulas, emulsão concentrada, microemulsão e suspoemulsão. Os tipos gerais de composições líquidas não aquosas são concentrado emulsionável, concentrado 10 microemulsionável, concentrado dispersível e dispersão em óleo.

Os tipos gerais de composições sólidas são pós secos, pós, grânulos, pelotas, pílulas, pastilhas, tabletes, filmes preenchidos (incluindo revestimentos de sementes) e similares, que podem ser dispersíveis em água (“molháveis”) ou hidrossolúveis. Filmes e revestimentos formados com 15 suspensões fluidas ou soluções formadoras de filme são particularmente úteis para o tratamento de sementes. O ingrediente ativo pode ser (micro)encapsulado e adicionalmente moldado na forma de suspensão ou formulação sólida; alternativamente, toda a formulação de ingrediente ativo pode ser encapsulada (ou “sobrerrevestida”). A encapsulação pode controlar 20 ou retardar a liberação do ingrediente ativo. Um grânulo emulsionável combina as vantagens de formulação concentrada emulsionável e formulação granular seca. Composições de alta resistência são principalmente utilizadas como intermediários para formulação adicional.

Formulações pulverizáveis são tipicamente estendidas em um 25 meio apropriado antes da pulverização. Essas formulações líquidas e sólidas são formuladas para que sejam facilmente diluídas no meio de pulverização, normalmente água. Volumes de pulverização podem variar de cerca de um a vários milhares de litros por hectare, mas encontram-se mais tipicamente na

faixa de cerca de dez a várias centenas de litros por hectare. Formulações pulverizáveis podem ser misturadas no tanque com água ou outro meio apropriado para tratamento foliar por meio de aplicação aérea ou no solo, ou para aplicação ao meio de crescimento da planta. Formulações líquidas e secas podem ser medidas diretamente em sistemas de irrigação por gotejamento ou medidas no sulco durante o plantio. Formulações líquidas e sólidas podem ser aplicadas sobre sementes vegetais na forma de tratamentos de sementes antes do plantio para proteger raízes em desenvolvimento e outras partes subterrâneas das plantas e/ou folhagem por meio de absorção sistêmica.

As formulações conterão tipicamente quantidades eficazes de ingrediente ativo, diluente e tensoativo dentro das faixas aproximadas a seguir, que somam 100% em peso.

	<u>Percentual em peso</u>		
	<u>Ingrediente</u>		
	<u>Ativo</u>	<u>Diluente</u>	<u>Tensoativo</u>
Pós, pastilhas e grânulos dispersíveis em água e hidrossolúveis	0.001–90	0–99.999	0–15
Soluções, emulsões, suspensões e dispersões em óleo (incluindo concentrados emulsionáveis)	1–50	40–99	0–50
Pós secos	1–25	70–99	0–5
Grânulos e pelotas	0.001–99	5–99.999	0–15
Composições de alta resistência	90–99	0–10	0–2

Os diluentes sólidos incluem, por exemplo, argilas tais como bentonita, montmorilonita, atapulgita e caulim, gesso, celulose, dióxido de titânio, óxido de zinco, amido, dextrina, açúcares (tais como lactose e sacarose), sílica, talco, mica, terra diatomácea, uréia, carbonato de cálcio, carbonato e bicarbonato de sódio e sulfato de sódio. Diluentes sólidos típicos são descritos em Watkins et al, *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, segunda edição, Dorland Books, Caldwell, Nova Jérsei.

Os diluentes líquidos incluem, por exemplo, água, *N,N*-dimetilalcanamidas (tais como *N,N*-dimetilformamida), limoneno, sulfóxido de dimetila, *N*-alquilpirrolidonas (tais como *N*-metilpirrolidinona), etileno glicol, trietileno glicol, propileno glicol, dipropileno glicol, polipropileno glicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (tais como óleos minerais brancos, parafinas normais, isoparafinas), alquilbenzenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, triacetin, hidrocarbonetos aromáticos, alifáticos desaromatizados, alquilbenzenos, alquilnaftalenos, cetonas tais como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona e 4-hidróxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tais como acetato de isoamila, acetato de hexila, acetato de heptila, acetato de octila, acetato de nonila, acetato de tridecila e acetato de isobornila, outros ésteres tais como ésteres de lactato alquilados, ésteres dibásicos e γ -butirolactona e álcoois, que podem ser lineares, ramificados, saturados ou insaturados, tais como metanol, etanol, *n*-propanol, álcool isopropílico, *n*-butanol, álcool isobutílico, *n*-hexanol, 2-etil hexanol, *n*-octanol, decanol, álcool isodecílico, isooctadecanol, álcool cetílico, álcool laurílico, álcool tridecílico, álcool oleílico, ciclohexanol, álcool tetraidrofurfurílico, álcool diacetona e álcool benzílico. Diluentes líquidos também incluem glicerol ésteres de ácidos graxos saturados e insaturados (tipicamente C₆-C₂₂), tais como óleos de frutas e sementes de plantas (tais como óleos de oliva, mamona, linhaça, gergelim, milho, amendoim, girassol, semente de uva, açafrão, semente de algodão,

soja, colza, coco e semente de palma), gorduras de fontes animais (tais como sebo de boi, sebo de porco, banha, óleo de fígado de bacalhau, óleo de peixe) e suas misturas. Diluentes líquidos também incluem ácidos graxos alquilados (tais como metilados, etilados e butilados), em que os ácidos graxos podem ser obtidos por meio de hidrólise de glicerol ésteres de fontes vegetais e animais e podem ser purificados por meio de destilação. Diluentes líquidos típicos são descritos em Marsden, *Solvents Guide*, segunda edição, Interscience, Nova Iorque, 1950.

As composições líquidas e sólidas de acordo com a presente invenção freqüentemente incluem um ou mais tensoativos. Os tensoativos podem ser classificados como não iônicos, aniônicos ou catiônicos. Os tensoativos não iônicos úteis para as composições do presente incluem, mas sem limitar-se a: alcóxilados álcoois tais como alcóxilados álcoois baseados em álcoois naturais e sintéticos (que podem ser lineares ou ramificados) e preparados a partir dos álcoois e óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou suas misturas; etóxilados amina, alcanolamidas e alcanolamidas etoxiladas; triglicérides alcóxilados, tais como óleos de soja, mamona e colza etoxilados; alcóxilados de alquilfenol, tais como etóxilados de octilfenol, etóxilados de nonilfenol, etóxilados de dinonil fenol e etóxilados de dodecil fenol (preparados a partir dos fenóis e óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou suas misturas); polímeros de bloco preparados a partir de óxido de etileno ou óxido de propileno e polímeros de bloco reversos em que os blocos terminais são preparados a partir de óxido de propileno; ácidos graxos etoxilados; óleos e ésteres graxos etoxilados; metil ésteres etoxilados; triestirilfenol etoxilado (incluindo os preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou suas misturas); ésteres de ácidos graxos, glicerol ésteres, derivados com base em lanolina, ésteres polietoxilados tais como ésteres de ácidos graxos de sorbitan polietoxilado, ésteres de ácido

graxo de sorbitol polietoxilado e ésteres de ácidos graxos de glicerol polietoxilado; outros derivados de sorbitan tais como ésteres de sorbitan; tensoativos poliméricos, tais como copolímeros aleatórios, copolímeros de bloco, resinas peguiladas alquiladas (polietileno glicol), polímeros de enxerto ou
 5 de pente e polímeros estrelados; polietileno glicóis (pegs); ésteres de ácidos graxos de polietileno glicol; tensoativos com base em silicone; e derivados de açúcar, tais como ésteres de sacarose, alquil poliglicosídeos e alquil polissacarídeos.

Tensoativos aniônicos úteis incluem, mas sem limitar-se a: ácidos
 10 alquilaril sulfônicos e seus sais; álcool carboxilado ou etoxilados de alquilfenol; derivados de sulfonato de difenila; lignina e derivados de lignina, tais como lignossulfonatos; ácidos maleico ou succínico ou seus anidridos; sulfonatos de olefina; ésteres de fosfato tais como fosfato ésteres de alcóxilados álcoois, fosfato ésteres de alcóxilados de alquilfenol e fosfato ésteres de etoxilados de
 15 estiril fenol; tensoativos com base em proteína; derivados de sarcosina; éter sulfato de estiril fenol; sulfatos e sulfonatos de óleos e ácidos graxos; sulfatos e sulfonatos de alquilfenóis etoxilados; sulfatos de álcoois; sulfatos de álcoois etoxilados; sulfonatos de aminas e amidas tais como tauratos de *N,N*-alquila; sulfonatos de benzeno, cumeno, tolueno, xileno e dodecil e tridecilbenzenos;
 20 sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno e alquil naftaleno; sulfonatos de petróleo fracionado; sulfossuccinamatos; e sulfossuccinatos e seus derivados, tais como sais de sulfossuccinato de dialquila.

Tensoativos catiônicos úteis incluem, mas sem limitar-se a:
 25 amidas e amidas etoxiladas; aminas, tais como *N*-alquil propanodiaminas, tripropilenotriaminas e dipropilenotetraminas, e aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas e aminas propoxiladas (preparadas a partir das aminas e óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou suas misturas); sais de amina,

tais como acetatos de amina e sais de diamina; sais de amônio quaternário, tais como sais quaternários, sais quaternários etoxilados e sais diquaternários; e óxidos de amina, tais como óxidos de alquildimetilamina e óxidos de bis-(2-hidroxietil)-alquilamina.

5 Também são úteis para as composições do presente misturas de tensoativos aniônicos e não iônicos ou misturas de tensoativos não iônicos e catiônicos. Tensoativos não iônicos, aniônicos e catiônicos e seus usos recomendados são descritos em uma série de referências publicadas que incluem *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, edições anuais norte-americanas e internacionais publicadas pela Divisão McCutcheon's, The
10 Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely e Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., Nova Iorque, 1964; e A. S. Davidson e B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, sétima edição, John Wiley and Sons, Nova Iorque, 1987.

15 As composições de acordo com a presente invenção podem também conter aditivos e auxiliares de formulação, conhecidos dos técnicos no assunto como auxiliares de formulação. Esses aditivos e auxiliares de formulação podem controlar: pH (tampões), formação de espuma durante o processamento (antiespumantes tais como poliorganossiloxanos (por exemplo, Rhodorsil® 416)), sedimentação de ingredientes ativos (agentes formadores de
20 suspensão), viscosidade (espessantes tixotrópicos), crescimento microbiano em recipientes (antimicrobianos), congelamento de produto (anticongelantes), cor (tinturas/dispersões de pigmento (por exemplo, Corante Vermelho Pro-lized®)), lavagem (formadores de filme ou aglutinantes), evaporação
25 (retardantes da evaporação) e outros atributos da formulação. Os formadores de filme incluem, por exemplo, acetatos de polivinila, copolímeros de acetato de polivinila, copolímero de acetato de vinila e polivinilpirrolidona, álcoois polivinílicos, copolímeros de álcool polivinílico e ceras. Exemplos de aditivos e

auxiliares de formulação incluem os relacionados em *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, edições anuais internacionais e norte-americanas publicadas pela Divisão McCutcheon, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. e Patente PCT nº WO 03/024222.

5 Soluções, incluindo concentrados emulsionáveis, podem ser preparadas por meio da simples mistura dos ingredientes. Caso o solvente de uma composição líquida destinada a uso como concentrado emulsionável seja imiscível em água, adiciona-se tipicamente um emulsificante para emulsificar o solvente que contém ativo mediante diluição com água. Caldas de ingredientes

10 ativos, com diâmetros de partículas de até 2000 μm , podem ser moídas úmidas utilizando moinhos de meios para obter partículas com diâmetros médios de menos de 3 μm . Caldas aquosas podem ser elaboradas em concentrados em suspensão terminados (vide, por exemplo, a Patente Norte-Americana nº 3.060.084) ou processadas adicionalmente por meio de secagem por

15 pulverização para formar grânulos dispersíveis em água. Formulações secas normalmente necessitam de processos de moagem seca, que produzem diâmetros médios de partícula na faixa de 2 a 10 μm . Pós e pós secos podem ser preparados por meio de mistura e, normalmente, moagem como em moinho martelo ou moinho de energia fluida. Grânulos e pelotas podem ser

20 preparados por meio de pulverização do material ativo sobre veículos granulares formados previamente ou por meio de métodos de aglomeração. Vide Browning, *Agglomeration, Chemical Engineering*, quatro de dezembro de 1967, págs. 147–48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, quarta edição, McGraw-Hill, Nova Iorque, 1963, págs. 8–57 e seguintes, e WO 91/13546.

25 Pelotas podem ser preparadas conforme descrito em US 4.172.714. Grânulos dispersíveis em água e hidrossolúveis podem ser preparados conforme ensinado em US 4.144.050, US 3.920.442 e DE 3.246.493. Pastilhas podem ser preparadas conforme ensinado em US 5.180.587, US 5,232,701 e US

5.208.030. Filmes podem ser preparados conforme ensinado em GB 2.095.558 e US 3.299.566.

Para informações adicionais referentes à técnica de formulação, vide T. S. Woods, *The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture* em *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks e T. R. Roberts, Eds., *Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry*, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, págs. 120–133. Vide também US 3.235.361, Col. 6, linha 16 até Col. 7, linha 19 e Exemplos 10–41; US 3.309.192, Col. 5, linha 43 até Col. 7, linha 62 e Exemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 e 169–182; US 2.891.855, Col. 3, linha 66 até Col. 5, linha 17 e Exemplos 1–4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., Nova Iorque, 1961, págs. 81–96; Hance et al, *Weed Control Handbook*, oitava edição, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; e *Developments in Formulation Technology*, PJB Publications, Richmond, Grã-Bretanha, 2000.

Nos Exemplos a seguir, todos os percentuais são em peso e todas as formulações são preparadas de formas convencionais. Os números dos compostos designam compostos na Tabela Índice A.

EXEMPLO A

20	<u>Concentrado de Alta Resistência</u>	
	Composto 1	98.5%
	Sílica aerogel	0.5%
	Sílica fina amorfa sintética	1.0%.

EXEMPLO B

25	<u>Pó molhável</u>	
	Composto 2	65.0%
	Dodecifenol polietileno glicol éter	2.0%
	Ligninossulfonato de sódio	4.0%

Silicoaluminato de sódio	6.0%
Montmorilonita (calcinada)	23.0%.

EXEMPLO C**Grânulos**

5	Composto 16	10.0%
	grânulos de atapulgita (matéria de baixa volatilidade, 0,71/0,30 mm; peneiras padrão norte-americano nº 25-50)	90.0%.

EXEMPLO D**Suspensão Aquosa**

10	Composto 37	25.0%
	atapulgita hidratada	3.0%
	ligninossulfonato de cálcio bruto	10.0%
	di-hidrogênio fosfato de sódio	0.5%
15	água	61.5%.

EXEMPLO E**Pelotas extrudadas**

	Composto 107	25.0%
	Sulfato de sódio anidro	10.0%
20	Ligninossulfonato de cálcio bruto	5.0%
	Alquilnaftalenossulfonato de sódio	1.0%
	Bentonita de cálcio/magnésio	59.0%.

EXEMPLO F**Microemulsão**

25	Composto 44	1.0%
	Triacetina	30.0%
	Alquilpoliglicosídeo C ₈ -C ₁₀	30.0%
	Monooleato de glicerila	19.0%

Água	20.0%.

EXEMPLO GConcentrado emulsionável

Composto 1	10.0%

5	Metil éster de ácido graxo C ₈ -C ₁₀	70.0%

	Hexoleato de polioxietileno sorbitol	20.0%.

Os compostos da Fórmula 1 de acordo com a presente invenção são úteis como agentes de controle de doenças das plantas. A presente invenção compreende ainda, portanto, um método de controle de doenças de

10 plantas causadas por patógenos vegetais fúngicos que compreende a aplicação à planta ou parte dela a ser protegida, ou à semente de planta a ser protegida, de uma quantidade eficaz de um composto de acordo com a presente invenção ou uma composição fungicida que contenha o mencionado composto. Os compostos e/ou composições de acordo com a presente

15 invenção fornecem o controle de doenças causadas por um amplo espectro de patógenos vegetais fúngicos nas classes basidiomicetes, ascomicetes, oomicetes e deuteromicetes. Eles são eficazes no controle de um amplo espectro de doenças das plantas, particularmente patógenos foliares de plantas ornamentais, grama, legumes, safras de campo, cereais e frutas. Estes

20 patógenos incluem: oomycetes, incluindo doenças de *Phytophthora*, tais como *Phytophthora infestans*, *Phytophthora megasperma*, *Phytophthora parasitica*, *Phytophthora cinnamoni*, *Phytophthora capsici*; doenças de *Pythium*, tais como *Pythium aphanidermatum*; e doenças na família das peronosporáceas, tais como *Plasmopara viticola*, *Peronospora* spp. (incluindo *Peronospora tabacina* e

25 *Peronospora parasitica*), *Pseudoperonospora* spp. (incluindo *Pseudoperonospora cubensis*) e *Bremia lactucae*; *Ascomycetes*, incluindo doenças *Alternaria* tais como *Alternaria solani* e *Alternaria brassicae*; doenças *Guignardia* tais como *Guignardia bidwell*; doenças *Venturia* tais como *Venturia*

inaequalis; doenças *Septoria* tais como *Septoria nodorum* e *Septoria tritici*; doenças de míldeo do pó tais como *Erysiphe* spp. (incluindo *Erysiphe graminis* e *Erysiphe polygoni*), *Uncinula necator*, *Sphaerotheca fuliginea* e *Podosphaera leucotricha*; *Pseudocercospora herpotrichoides*; doenças *Botrytis* tais como

5 *Botrytis cinerea*; *Monilinia fructicola*; doenças *Sclerotinia* tais como *Sclerotinia sclerotiorum*; *Magnaporthe grisea*; *Phomopsis viticola*; doenças *Helminthosporium* tais como *Helminthosporium tritici repentis*; *Pyrenophora teres*; doenças de antracnose tais como *Glomerella* ou *Colletotrichum* spp. (tais como *Colletotrichum graminicola* e *Colletotrichum orbiculare*); e

10 *Gaeumannomyces graminis*; Basidiomicetes, incluindo doenças da ferrugem causadas por *Puccinia* spp. (tais como *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia hordei*, *Puccinia graminis* e *Puccinia arachidis*); *Hemileia vastatrix*; e *Phakopsora pachyrhizi*; outros patógenos que incluem *Rhizoctonia* spp (tais como *Rhizoctonia solani*); doenças *Fusarium* tais como *Fusarium roseum*,

15 *Fusarium graminearum* e *Fusarium oxysporum*; *Verticillium dahliae*; *Sclerotium rolfsii*; *Rynchosporium secalis*; *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola* e *Cercospora beticola*; e outros gêneros e espécies relacionados de perto com esses patógenos. Além da sua atividade como fungicida, as composições ou combinações também possuem atividade contra bactérias tais

20 como *Erwinia amylovora*; *Xanthomonas compestris*; *Pseudomonas syringae* e outras espécies relacionadas. Merece observação o controle fornecido a doenças causadas pelas classes ascomicetes e oomicetes. Merece observação específica o controle fornecido a doenças causadas pela classe oomicetes.

25 O controle de doenças das plantas normalmente é obtido por meio da aplicação de uma quantidade eficaz de um composto de acordo com a presente invenção antes ou depois da infecção, à parte da planta a ser protegida tal como as raízes, haste, folhagem, frutas, sementes, tubérculos ou

bulbos, ou aos meios (solo ou areia) nos quais as plantas a serem protegidas estão crescendo. Os compostos podem também ser aplicados às sementes para proteger as sementes e as mudas que se desenvolvem a partir das sementes. Os compostos podem também ser aplicados por meio da água de
5 irrigação para o tratamento de plantas.

As taxas de aplicação para estes compostos podem ser influenciadas por vários fatores do ambiente e deverão ser determinadas sob condições de uso real. A folhagem pode normalmente ser protegida quando tratada em uma taxa de menos de cerca de 1 g/ha a cerca de 5000 g/ha de
10 ingrediente ativo. Sementes e mudas podem normalmente ser protegidas quando a semente for tratada em uma taxa de cerca de 0,1 a cerca de 10 g p/ kg de semente.

Os compostos de acordo com a presente invenção podem também ser misturados com um ou mais outros inseticidas, fungicidas,
15 nematocidas, bactericidas, acaricidas, reguladores do crescimento, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrativos, feromônios, estimulantes da alimentação ou outros compostos biologicamente ativos para formar um pesticida de múltiplos componentes gerando um espectro ainda mais amplo de proteção agrícola. Exemplos desses protetores agrícolas com
20 os quais os compostos de acordo com a presente invenção podem ser formulados são: inseticidas tais como abamectina, acefato, acetamiprid, amidoflomet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfós-metil, bifentrina, bifenazato, buprofezina, carbofuran, cartap, clorantraniliprol (DPX-E2Y45), clorfenapir, clorfluazuron, clorpirifós, clorpirifós-metil, cromafenozida,
25 clotianidin, ciflumetofen, ciflutrin, beta-ciflutrina, cialotrina, lambda-cialotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuron, diazinon, dieldrina, diflubenzuron, dimeflutrina, dimetoato, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endossulfan, esfenvarelato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina,

fenvarelato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato,
 flufenerim (UR-50701), flufenoxuron, fonofós, halofenozida, hexaflumuron,
 hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, isofenfós, lufenuron, malation,
 metaflumizona, metaldeído, metamidofós, metidation, metomil, metoprene,
 5 metoxiclor, metoflutrina, monocrotofós, metoxifenoazida, nitenpiram, nitiazina,
 novaluron, noviflumuron (XDE-007), oxamil, paration, paration-metil,
 permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofós,
 proflutrina, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridalil, pirifluquinazon, piriprol,
 piriproxifen, rotenona, rianodina, espinoteram, espinosad, espiroclorfen,
 10 espiromesifen (BSN 2060), espirotetramat, sulprofós, tebufenozida,
 teflubenzuron, teflutrina, terbufós, tetracloprid, tiacloprid, tiametoxam,
 tiodicarb, tiossultap-sódio, tralometrina, triazamato, triclorfon e triflumuron;
 fungicidas tais como acibenzolar, aldimorf, amisulbrom, anilazina, azaconazol,
 azoxistrobina, benalaxil, benodanil, benomil, bentiavalicarb, bentiavalicarb-
 15 isopropil, binapacril, bifenil, bitertanol, bixafen, blasticidina-S, mistura de
 Bordéus (sulfato de cobre tribásico), boscalid/nicobifen, bromuconazol,
 bupirinato, butiobato, carboxin, carpropamid, captafol, captan, carbendazim,
 cloroneb, clorotalonil, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-
 il)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, clozolinato, clotrimazol, oxicloreto de cobre,
 20 sais de cobre, tais como sulfato de cobre e hidróxido de cobre, ciazofamid,
 ciflufenamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, diclofluanid, diclocimet,
 diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimetirimol, *N*-
 [2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazolo-4-carboxamida,
 dimethomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap,
 25 discostrobina, ditianon, dodemorf, dodina, econazol, edifenfós, enestroburina,
 epoxiconazol, etaconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona,
 fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fencaramid, fenfuram, fenhexamida,
 fenoxanil, fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de

fentina, ferbam, ferfurazoato, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumetover,
 flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol,
 flusulfamida, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetil-alumínio, fuberidazol, furalaxil,
 furametapir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalil, imibenconazol,
 5 iminoctadina, iodcarb, ipconazol, iprobenfós, iprodiona, iprovalicarb,
 isoconazol, isoprothiolano, isotianil, casugamicina, cresoxim-metil, mancozeb,
 mandipropamid, maneb, mapanipirina, mefenoxam, mepronil, meptildinocap,
 metalaxil, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobin, mepanipirim,
 metiram, metrafenona, miconazol, miclobutanil, naftifina, neo-asozina
 10 (metanoarsonato férrico), nuarimol, octilinona, ofurace, orisastrobina, oxadixil,
 , ácido oxalínico, oxpoconazol, oxicarboxina, paclobutrazol, penconazol,
 pencycuron, pentiopirad, perfurazoato, ácido fosfônico, ftalida, picobenzamid,
 picoxistrobina, piperalina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona,
 propamocarb, cloridrato de propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid,
 15 protiocarb, protioconazol, piraclostrobina, priazofós, piribencarb, pirifenox,
 pirimetanil, pirifenox, pirolnitrina, piroquilon, quinconazol, quinoxifen,
 quintozene, siltiofam, simeconazol, espiroxamina, estreptomicina, enxofre,
 tebuconazol, tecrazeno, tecloftalam, tecnazeno, terbinafina, tetraconazol,
 tiabendazol, tifluzamida, tiofanato, tiofanato-metil, tiram, tiadinil, tolclofós-metil,
 20 tolifluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazóxido, triciclazol, tridemorf,
 triflumizol, trimorfamida triciclazol, trifloxistrobina, triforina, triticonazol,
 uniconazol, validamicina, vinclozolina, zineb, ziram e zoxamida, nematicidas
 tais como aldoxicarb, aldoxicarb, fenamifós, imiciafós e oxamil; bactericidas tais
 como estreptomicina; acaricidas tais como amitraz, chinometionat,
 25 clorobenzilato, cienopirafen, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquin,
 óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita,
 piridaben e tebufenpirad; e agentes biológicos tais como *Bacillus thuringiensis*,
Bacillus thuringiensis delta endotoxina, bacilovírus e bactérias, vírus e fungos

entomopatogênicos. Descrições de vários compostos disponíveis comercialmente relacionados acima podem ser encontradas em *The Pesticide Manual*, décima-terceira edição, C. D. S. Thomlin, ed., British Crop Protection Council, 2003. Para realizações em que um ou mais desses vários parceiros de
5 mistura são utilizados, a razão em peso entre esses vários parceiros de mistura (no total) e o composto da Fórmula 1 é tipicamente de cerca de 1:100 a cerca de 3000:1. Merecem observação razões em peso de cerca de 1:30 a cerca de 300:1 (tais como razões de cerca de 1:1 a cerca de 30:1). Será evidente que a inclusão destes componentes adicionais pode expandir o espectro de doenças
10 controladas além do espectro controlado pelo composto da Fórmula 1 isoladamente.

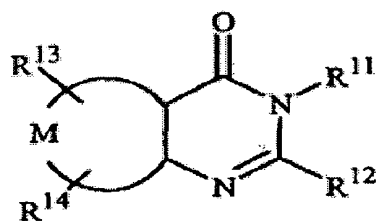
Em uma realização de mistura, grânulos de uma composição sólida que compreende um composto da Fórmula 1 são misturados com grânulos de uma composição sólida que compreende um outro protetor
15 agrícola. Estas misturas de grânulos podem estar de acordo com a descrição de mistura de grânulos geral da Patente PCT nº WO 94/24861 ou, de maior preferência, o ensinamento de mistura de grânulos homogênea da Patente Norte-Americana nº 6.022.552.

Merecem observação combinações (tais como na forma de
20 composições) de um composto da Fórmula 1 com pelo menos um outro fungicida. Merecem observação específica as composições em que o outro fungicida possui um local de ação diferente do composto da Fórmula 1. Em certos casos, combinações com outros fungicidas que possuem um espectro de controle similar mas local de ação diferente serão particularmente
25 vantajosas para administração de resistência. Merecem observação específica composições que, além do composto da Fórmula 1, incluem pelo menos um composto selecionado a partir do grupo que consiste de: (1) fungicidas alquilenobis(ditiocarbamato); (2) cimoxanil; (3) fungicidas de fenilamida; (4)

fungicidas de pirimidinona; (5) clorotalonil; (6) carboxamidas que agem no complexo II do local de transferência de elétrons respiratórios mitocôndricos fúngicos; (7) quinoxifen; (8) metrafenona; (9) ciflufenamid; (10) ciprodinil; (11) compostos de cobre; (12) fungicidas de ftalimida; (13) fosetil-alumínio; (14) fungicidas de benzimidazol; (15) ciazofamid; (16) fluazinam; (17) iprovalicarb; (18) propamocarb; (19) validomicina; (20) fungicidas de diclorofenil dicarboximida; (21) zoxamida; (22) fluopicolida; (23) mandipropamid; (24) amidas de ácido carboxílico que agem sobre a biossíntese de fosfolipídios e deposição nas paredes celulares; (25) dimetomorf; (26) inibidores da biossíntese de esteróis não-DMI; (27) inibidores da desmetilase na biossíntese de esteróis; (28) fungicidas do complexo *bc₁*; e sais dos compostos de (1) até (28).

São fornecidas abaixo descrições adicionais de classes de compostos fungicidas.

Os fungicidas de pirimidinona (grupo (4)) incluem os compostos da Fórmula A1:



A1

em que M forma um anel fenila fundido, tiofeno ou piridina; R^{11} é alquila C_1 - C_6 ; R^{12} é alquila C_1 - C_6 ou alcóxi C_1 - C_6 ; R^{13} é halogênio; e R^{14} é hidrogênio ou halogênio.

Fungicidas de pirimidinona são descritos no Pedido de Patente PCT Publicado nº WO 94/26722 e nas Patentes Norte-Americanas nº 6.066.638, 6.245.770, 6.262.058 e 6.277.858. Merecem observação fungicidas de pirimidinona selecionados a partir do grupo: 6-bromo-3-propil-2-propilóxi-4

(3*H*)-quinazolinona; 6,8-diiodo-3-propil-2-propilóxi-4 (3*H*)-quinazolinona; 6-iodo-3-propil-2-propilóxi-4 (3*H*)-quinazolinona (proquinazid); 6-cloro-2-propóxi-3-propiltieno[2,3-*d*]pirimidin-4 (3*H*)-ona; 6-bromo-2-propóxi-3-propiltieno[2,3-*d*]pirimidin-4 (3*H*)-ona; 7-bromo-2-propóxi-3-propiltieno[2,3-*d*]pirimidin-4 (3*H*)-ona; 6-bromo-2-propóxi-3-propilpirido[2,3-*d*]pirimidin-4 (3*H*)-ona; 6,7-dibromo-2-propóxi-3-propiltieno[3,2-*d*]pirimidin-4 (3*H*)-ona; e 3-(ciclopropilmetil)-6-iodo-2-(propiltio)pirido[2,3-*d*]pirimidin-4 (3*H*)-ona.

Os inibidores da biossíntese de esteróis (grupo (27)) controlam fungos inibindo enzimas no processo de biossíntese de esteróis. Fungicidas inibidores da demetilase possuem um local comum de ação no processo de biossíntese de esteróis fúngicos, que envolve a inibição da demetilação na posição 14 de lanosterol ou 24-metileno di-hidrolanosterol, que são precursores de esteróis em fungos. Os compostos que agem neste local são freqüentemente denominados inibidores da demetilase, fungicidas DMI ou DMIs. A enzima demetilase às vezes é indicada por outros nomes na literatura bioquímica, que incluem citocromo P-450 (14DM). A enzima demetilase é descrita, por exemplo, em *J. Biol. Chem.* 1992, 267, 13175–79 e referências ali mencionadas. Os fungicidas DMI são divididos em várias classes químicas: azóis (incluindo triazóis e imidazóis), pirimidinas, piperazinas e piridinas. Os triazóis incluem azaconazol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol (incluindo diniconazol-M), epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, penconazol, propiconazol, protioconazol, quinconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol e uniconazol. Os imidazóis incluem clotrimazol, econazol, imazalil, isoconazol, miconazol, oxpoconazol, procloraz e triflumizol. As pirimidinas incluem fenarimol, nuarimol e triarimol. As piperazinas incluem triforina. As piridinas incluem butiobato e pirifenox. Pesquisas bioquímicas demonstraram

que todos os fungicidas mencionados acima são fungicidas DMI conforme descrito por K. H. Kuck et al em *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: Nova Iorque, 1995, 205-258.

5 Fungicidas do complexo bc_1 (grupo (28)) possuem um modo de ação fungicida que inibe o complexo bc_1 na cadeia de respiração mitocôndrica. O complexo bc_1 às vezes é indicado por outros nomes na literatura bioquímica, que incluem complexo III da cadeia de transferência de elétrons, e ubihidroquinona: citocromo *c* oxidoreductase. Este complexo é identificado
10 exclusivamente pela Comissão de Enzimas número EC1.10.2.2. O complexo bc_1 é descrito, por exemplo, em *J. Biol. Chem.* 1989, 264, 14543–48; *Methods Enzymol.* 1986, 126, 253–71; e referências ali mencionadas. Fungicidas de estrobilurina tais como azoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina (SYP-Z7071), fluoxastrobina, cresoxim-metil, metominostrobin, orisastrobina,
15 picoxistrobina, piraclostrobina e trifloxistrobina possuem conhecidamente este modo de ação (H. Sauter et al, *Angew. Chem. Int. Ed.* 1999, 38, 1328-1349). Outros compostos fungicidas que inibem o complexo bc_1 na cadeia de respiração mitocôndrica incluem famoxadona e fenamidona.

Fungicidas alquilenobis(ditiocarbamato) (grupo (1)) incluem
20 compostos tais como mancozeb, maneb, propineb e zineb. Fungicidas fenilamidas (grupo (3)) incluem compostos tais como metalaxil, benalaxil, furalaxil e oxadixil. Carboxamidas (grupo (6)) incluem compostos tais como boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxin, tifuluzamida, pentiopirad e *N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-
25 pirazolo-4-carboxamida (Patente PCT nº WO 2003/010149) e são conhecidas por inibirem a função mitocôndrica por meio de rompimento de complexo II (succinato desidrogenase) na cadeia de transporte de elétrons respiratória. Compostos de cobre (grupo (11)) incluem compostos tais como oxicloreto de

cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre, incluindo composições tais como mistura de Bordéus (sulfato de cobre tribásico). Fungicidas ftalimidas (grupo (12)) incluem compostos tais como folpet e captan. Fungicidas de benzimidazol (grupo (14)) incluem benomil e carbendazim. Fungicidas de diclorofenil dicarboximida (grupo (20)) incluem clozolinato, diclozolina, iprodiona, isovalediona, miclozolin, procimidona e vinclozolin.

Inibidores da biossíntese de esterol não de DMI (grupo (26)) incluem fungicidas morfolina e piperidina. As morfolinas e piperidinas são inibidores da biossíntese de esterol que se demonstrou inibirem etapas no processo de biossíntese de esterol posteriormente às inibições atingidas pela biossíntese de esterol DMI (grupo (27)). As morfolinas incluem aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf e trimorfamida. As piperidinas incluem fenpropidina.

Merecem observação os métodos em que são controladas doenças de plantas causadas por patógenos vegetais fúngicos de oomicetes.

A discussão acima com referência ao uso de compostos da Fórmula 1 em composições (tais como certas composições que compreendem tensoativos, diluentes sólidos, diluentes líquidos e/ou compostos biologicamente ativos) e em métodos de controle de doenças das plantas (tais como controle de doenças das plantas causadas por patógenos vegetais fúngicos de oomicetes) também se aplica a compostos dentro do escopo de exclusão da ressalva (a) da Fórmula 1.

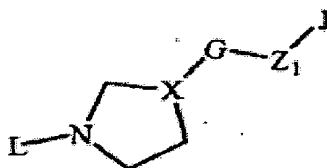
Os Testes a seguir demonstram a eficácia de controle de compostos de acordo com a presente invenção sobre patógenos específicos. A proteção de controle de patógenos gerada pelos compostos não se limita, entretanto, a estas espécies. Vide Tabelas Índice A para descrições de compostos. Os estereocentros marcados como “R” (reto) e “S” (sinistro) baseiam-se no sistema de Cahn-Ingold-Prelog, conforme utilizado por

Chemical Abstracts; uma marca de estereocentro seguida por asteriscos “***” indica que a descrição estereoquímica é relativa a outros estereocentros e o composto é racêmico. A abreviação “Ex.” indica “Exemplo” e é seguida por um algarismo que indica em qual exemplo o composto é preparado. A Tabela

5 Índice A relaciona o peso molecular do íon parental com mais alta abundância isotópica (M+1) formado pela adição de H⁺ (peso molecular de 1) à molécula, observado por meio de espectrometria de massa utilizando ionização química sob pressão atmosférica (AP⁺). Realizou-se separação quiral do Composto 1 em Compostos 3 e 4 utilizando uma coluna AD-RH CHIRALPAK® preparativa

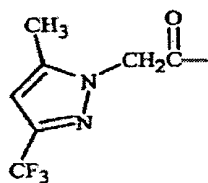
10 (Chiral Technologies, Inc., Wester Chester PA, Estados Unidos) contendo sílica gel revestida com amilose-tris(carbamato de 3,5-dimetilfenila) e eluída com um gradiente de água e metanol. A rotação específica ([α]_D) foi medida em uma solução de etanol a 25 °C utilizando uma célula de trajeto de 100 mm.

TABELA ÍNDICE A

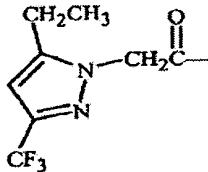


15

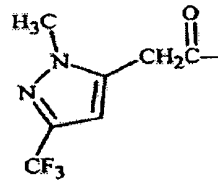
G é conforme definido na Ilustração 2; R^{3a} em G é H. Os grupos L são definidos conforme ilustrado abaixo.



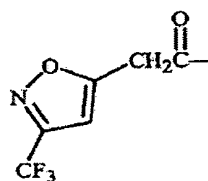
L-1



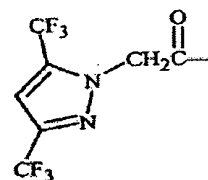
L-2



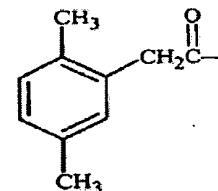
L-3



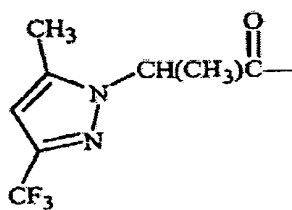
L-4



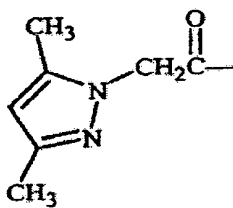
L-5



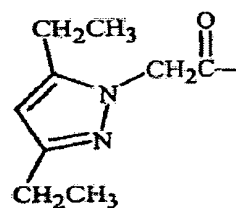
L-6



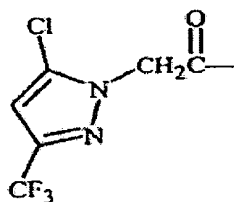
L-7



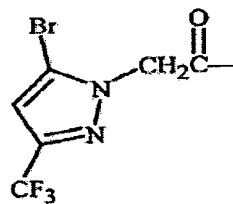
L-8



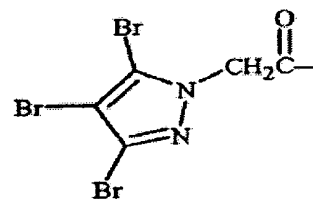
L-9



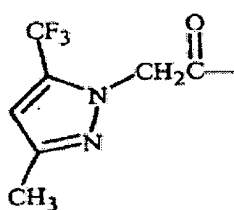
L-10



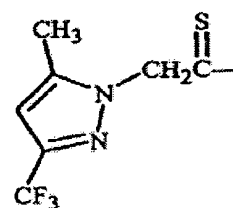
L-11



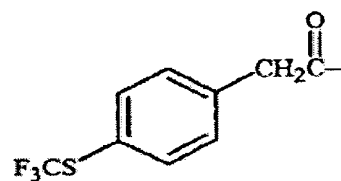
L-12



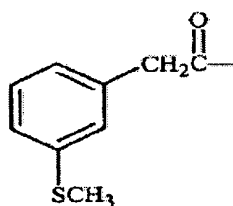
L-13



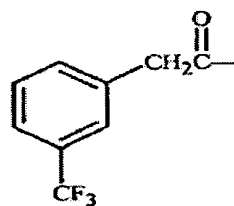
L-14



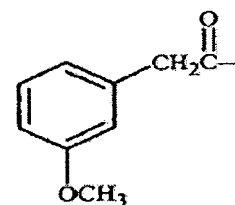
L-15



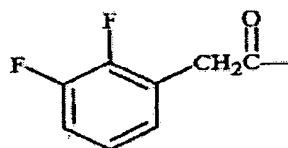
L-16



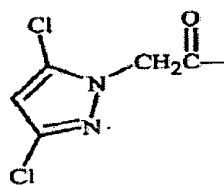
L-17



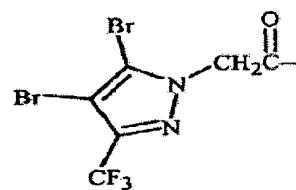
L-18



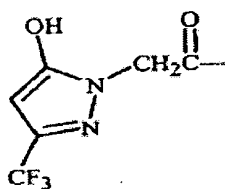
L-19



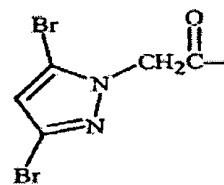
L-20



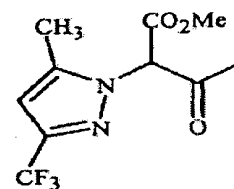
L-21



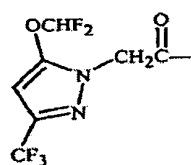
L-22



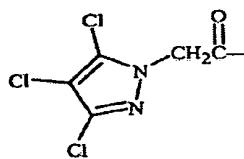
L-23



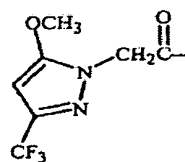
L-24



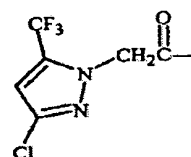
L-25



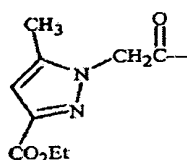
L-26



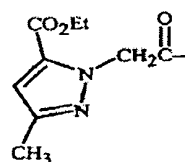
L-27



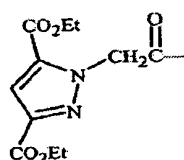
L-28



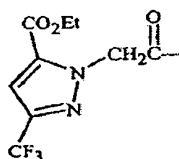
L-29



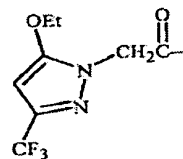
L-30



L-31

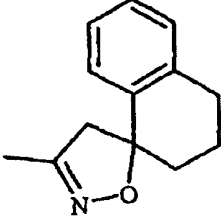
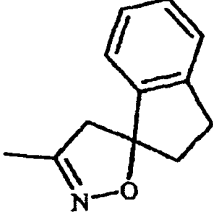
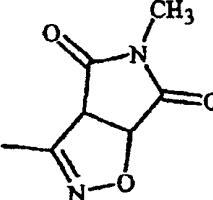


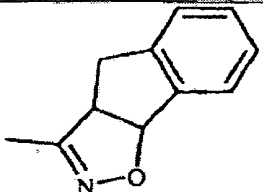
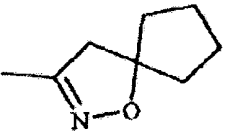
L-32

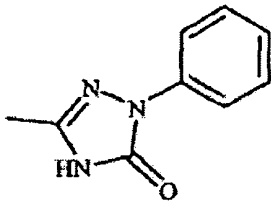
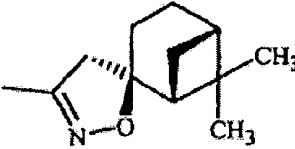
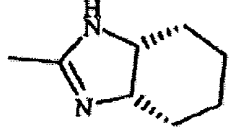
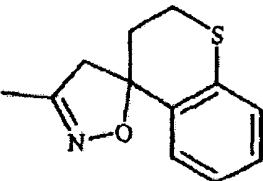


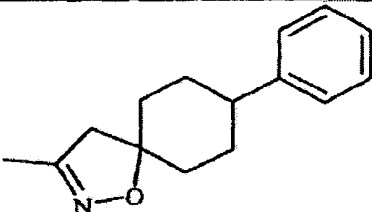
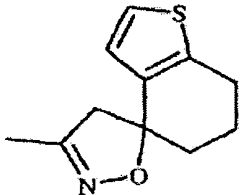
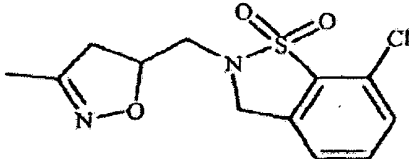
L-33

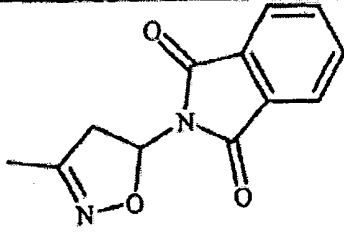
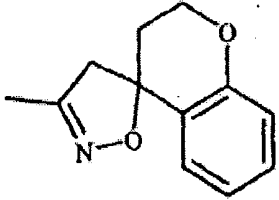
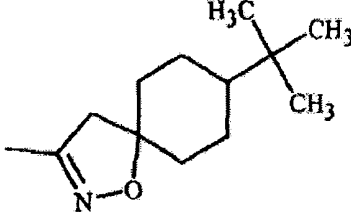
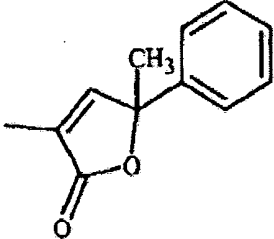
Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺
					(M+1)
1 (Ex. 1)	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	504
2 (Ex. 2)	L-1	X ¹	G-1	5-phenyl-3-isoxazolyl	502
3 (Ex. 12)	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl [Note 1]	504
4	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl [Note 2]	504
5	L-1	X ¹	G-1	5,6-dihydro-6-phenyl-4 <i>H</i> -1,2-oxazin-3-yl	518
6 (Ex. 4)	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-3-phenyl-5-isoxazolyl	504
7 (Ex. 3)	L-1	X ¹	G-1	(5 <i>S</i>)-4,5-dihydro-1-methyl-5-phenyl-1 <i>H</i> -imidazol-2-yl	517
8 (Ex. 5)	L-1	X ¹	G-1	5-(2-chlorophenyl)-4,5-dihydro-3-isoxazolyl	538
9	L-1	X ¹	G-1	5-(4-chlorophenyl)-4,5-dihydro-3-isoxazolyl	538
10	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(4-methylphenyl)-3-isoxazolyl	518
11	L-1	X ¹	G-1	(4 <i>R</i> *,5 <i>R</i> *)-4,5-dihydro-4-methyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	518
12	L-1	X ¹	G-27	3-phenyl-1 <i>H</i> -pyrazol-1-yl	483
13	L-1	X ¹	G-1	4-phenyl-2-oxazolidinyl	506
14	L-1	X ¹	G-1	3-acetyl-4-phenyl-2-oxazolidinyl	548
15 (Ex. 8)	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-methyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	518
16 (Ex. 8)	L-1	X ¹	G-1	3 <i>a</i> ,4,5,9 <i>b</i> -tetrahydronaphth[2,1- <i>d</i>]isoxazol-3-yl	530
17	L-1	X ¹	G-1	5-(3-chlorophenyl)-4,5-dihydro-3-isoxazolyl	538
18 (Ex. 8)	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(4-methoxyphenyl)-3-isoxazolyl	534
19 (Ex. 1)	L-2	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	518
20	L-3	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	504
21	L-4	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	491
22 (Ex. 1)	L-5	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	558
23	L-6	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	460
24	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(phenylmethyl)-3-isoxazolyl	518
25	L-1	X ¹	G-1	(4 <i>R</i> *,5 <i>S</i> *)-4,5-dihydro-4-methyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	518
26	L-1	X ¹	G-1	4-biphenyl	511
27	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(3-methylbutyl)-3-isoxazolyl	498
28	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2,2-dimethylpropyl)-3-isoxazolyl	498

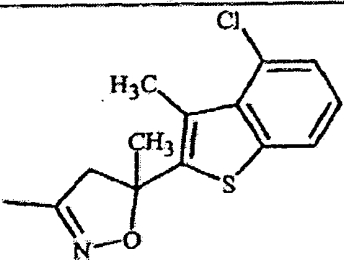
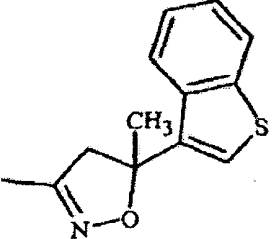
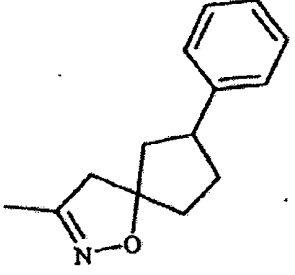
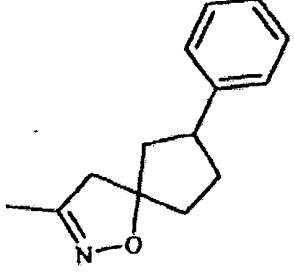
Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
29	L-1	X ¹	G-1	5,6-dihydro-6-methyl-6-phenyl-4 <i>H</i> -1,2-oxazin-3-yl	532
30	L-1	X ¹	G-1	3-phenyl-5-isoxazolyl	502
31	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-4-phenyl-2-oxazolyl	504
32	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-1-(phenylmethyl)-1 <i>H</i> -imidazol-2-yl	517
33	L-1	X ¹	G-27	3-biphenyl	494
34	L-1	X ¹	G-27	6-phenyl-2-pyridyl	495
35	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-5-(trifluoromethyl)-3-isoxazolyl	572
36	L-1	X ¹	G-1	5-[3-(trifluoromethyl)phenyl]-3-isoxazolyl	570
37 (Ex. 8)	L-1	X ¹	G-1		544
38	L-1	X ¹	G-1	5-(4-biphenyl)-3-isoxazolyl	578
39	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(3,5-dichlorophenyl)-5-(trifluoromethyl)-3-isoxazolyl	640
40	L-1	X ¹	G-1	5-phenyl-1,3,4-oxadiazol-2-yl	503
41	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-2-oxazolyl	504
42	L-1	X ¹	G-1	5-phenyl-2-oxazolyl	502
43	L-1	X ¹	G-1	2-benzothiazolyl	492
44 (Ex. 8)	L-1	X ¹	G-1		530
45	L-1	X ¹	G-1		511
46	L-1	X ¹	G-1	(4 <i>R</i>)-4,5-dihydro-4-phenyl-2-oxazolyl	504
47	L-1	X ¹	G-1	(5 <i>S</i>)-4,5-dihydro-5-phenyl-2-oxazolyl	504
48	L-1	X ¹	G-1	5,6-dihydro-6-phenyl-4 <i>H</i> -1,3-oxazin-2-yl	518
49	L-1	X ¹	G-1	(4 <i>S</i>)-4,5-dihydro-4-phenyl-2-oxazolyl	504
50	L-1	X ¹	G-1	(5 <i>R</i>)-4,5-dihydro-5-phenyl-2-oxazolyl	504

Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
51	L-1	X ¹	G-1		516
52	L-1	X ¹	G-1	2-benzoxazolyl	475
53	L-1	X ¹	G-1	5,6-dihydro-5-phenyl-4H-1,3-oxazin-2-yl	518
54	L-1	X ¹	G-1	5,6-dihydro-4-phenyl-4H-1,3-oxazin-2-yl	518
55	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(methoxycarbonyl)-3-isoxazolyl	486
56	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(1,1-dimethylethyl)-3-isoxazolyl	484
57	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-bromoethyl)-3-isoxazolyl	534
58	L-1	X ¹	G-1	2-benzimidazolyl	475
59	L-1	X ¹	G-1	5-(2-fluorophenyl)-3-isoxazolyl	520
60	L-1	X ¹	G-1	5-(2-trifluoromethylphenyl)-3-isoxazolyl	570
61	L-1	X ¹	G-1	2-naphthalenyl	485
62	L-1	X ¹	G-1	phenyl	435
63	L-7	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	518
64	L-1	X ¹	G-1	5-(2,4-difluorophenyl)-3-isoxazolyl	538
65	L-1	X ¹	G-1	1-phenyl-2-pyrrolidon-4-yl	518
66	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-cyano-3-isoxazolyl	453
67	L-1	X ¹	G-1		482
68	L-1	X ¹	G-1	3-phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl	503
69	L-15	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	532
70	L-16	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	478
71	L-17	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	500
72	L-1	X ¹	G-1	4-phenoxyphenyl	527
73	L-1	X ¹	G-1	1-naphthalenyl	485
74	L-1	X ¹	G-1	3-biphenyl	511
75	L-1	X ¹	G-1	3-phenoxyphenyl	527
76	L-1	X ¹	G-1	1-phenylpyrazol-3-yl	501
77	L-1	X ¹	G-1	1-(4-methylphenyl)-1,2,3-triazol-4-yl	516
78	L-1	X ¹	G-1	1-phenylpyrazol-5-yl	501
79	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-fluorophenyl)-3-isoxazolyl	522
80	L-17	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-fluorophenyl)-3-isoxazolyl	518

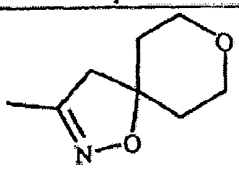
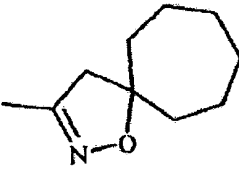
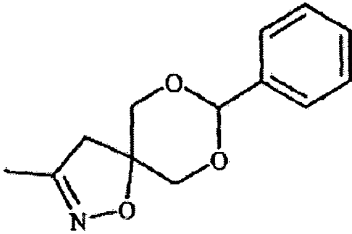
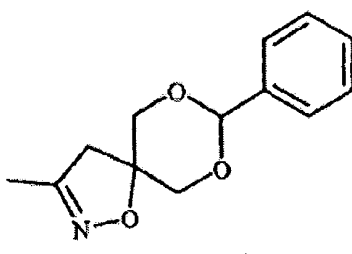
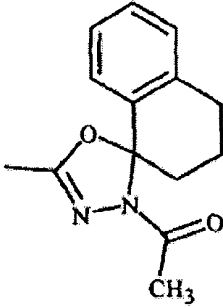
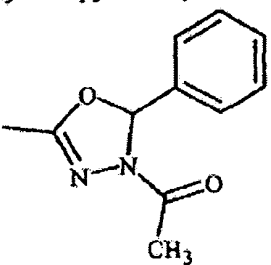
Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
81	L-1	X ¹	G-1	5,6-dihydro-5-phenyl-6-methoxy-4 <i>H</i> -1,2-oxazin-3-yl	548
82	L-1	X ¹	G-1		518
83	L-1	X ¹	G-1	5-phenyl-2-furanyl	501
84	L-1	X ¹	G-1	2-phenyl-4-thiazoyl	518
85	L-1	X ¹	G-1	5-phenyl-2-thienyl	517
86	L-1	X ¹	G-1	3-(2,4-dichlorophenyl)-5-isoxazolyl	570
87	L-1	X ¹	G-1	3-(3,4-dichlorophenyl)-5-isoxazolyl	570
88	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(naphthalen-2-yl)-3-isoxazolyl	554
89	L-18	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	462
90	L-19	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	468
91	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(4- <i>t</i> -butylphenyl)-3-isoxazolyl	560
92	L-1	X ¹	G-1	(5 <i>R</i>)-4,5-dihydro-5-phenyl-1 <i>H</i> -imidazol-2-yl	503
93	L-8	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	450
94	L-9	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	478
95	L-1	X ¹	G-1		536
96	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(4-fluorophenyl)-3-isoxazolyl	522
97	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(4-trifluoromethylphenyl)-3-isoxazolyl	572
98 (Ex. 9)	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-pyridyl)-3-isoxazolyl	505
99	L-1	X ¹	G-1		481
100	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-isopropyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	546
101	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-propyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	546
102 (Ex. 1)	L-1	X ¹	G-1		562
103	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-cyclopropyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	544

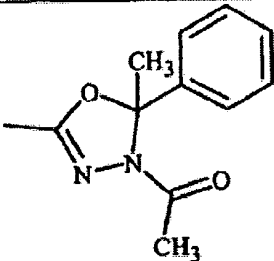
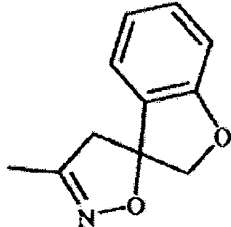
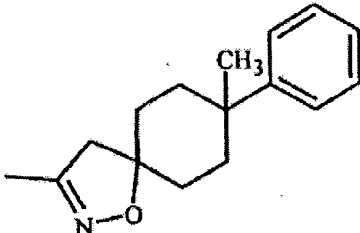
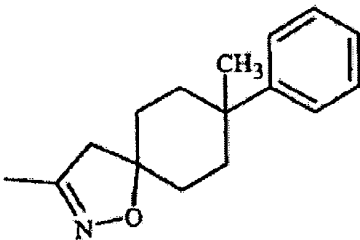
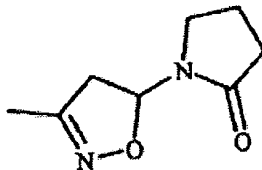
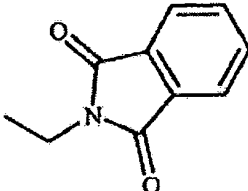
Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
104	L-1	X ¹	G-1		572
105	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-ethyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	532
106	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(4-biphenyl)-3-isoxazolyl	580
107 (Ex. 10)	L-10	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	524
108	L-1	X ¹	G-1	(4 <i>R</i> ,5 <i>R</i>)-4,5-dihydro-4,5-diphenyl-1 <i>H</i> -imidazol-2-yl	579
109	L-1	X ¹	G-1		550
110	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(4-hydroxyphenyl)-3-isoxazolyl	520
111	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-pyrazinyl)-3-isoxazolyl	506
112	L-1	X ¹	G-1		643
113	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(4-acetoxyphenyl)-3-isoxazolyl	562
114	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-trifluoromethylphenyl)-3-isoxazolyl	572
115	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(3-trifluoromethylphenyl)-3-isoxazolyl	572
116	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(methoxycarbonylmethyl)-3-isoxazolyl	500
117	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(phenylsulfonyl)-3-isoxazolyl	568
118	L-1	X ¹	G-1	(5 <i>R</i>)-4,5-dihydro-1-methyl-5-phenyl-1 <i>H</i> -imidazol-2-yl	517
119	L-1	X ¹	G-1	(4 <i>S</i> ,5 <i>R</i>)-4,5-dihydro-4,5-diphenyl-1 <i>H</i> -imidazol-2-yl	579
120	L-1	X ¹	G-1	4-chlorophenyl	469
121	L-1	X ¹	G-1	2-chlorophenyl	469
122	L-1	X ¹	G-1	4-(trifluoromethyl)phenyl	503
123	L-1	X ¹	G-1	3-chlorophenyl	469
124	L-1	X ¹	G-1	3-pyridyl	436
125	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(3,4-dihydroxyphenyl)-3-isoxazolyl	536
126 (Ex. 11)	L-11	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	568
127	L-12	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	658
128 (Ex. 1)	L-13	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	504

Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
129	L-1	X ¹	G-1		573
130 (Ex. 6)	L-14	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	520
131	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-methoxyphenyl)-3-isoxazolyl	534
132	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-methyl-5-(2,5-dichloro-3-thienyl)-3-isoxazolyl	592
133	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2,5-dimethylphenyl)-3-isoxazolyl	532
134	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(4-methoxycarbonylphenyl)-3-isoxazolyl	562
135	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2,6-dichlorophenyl)-3-isoxazolyl	572
136	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2,4-dimethylphenyl)-3-isoxazolyl	532
137 (Ex. 1)	L-1	X ¹	G-1		546
138	L-1	X ¹	G-1		552
139	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5,5-diphenyl-3-isoxazolyl	580
140	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-methoxyphenyl)-5-methyl-3-isoxazolyl	548
141	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(methoxymethyl)-5-phenyl-3-isoxazolyl	548
142	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(methylthiomethyl)-5-phenyl-3-isoxazolyl	564
143	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(methylsulfonylmethyl)-5-phenyl-3-isoxazolyl	596
144	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(methylsulfinylmethyl)-5-phenyl-3-isoxazolyl	580
145	L-1	X ¹	G-1		531

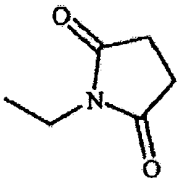
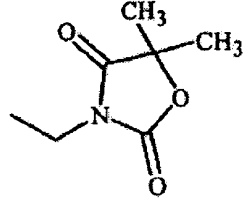
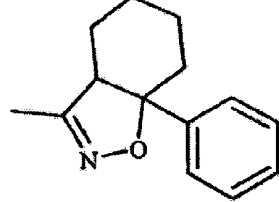
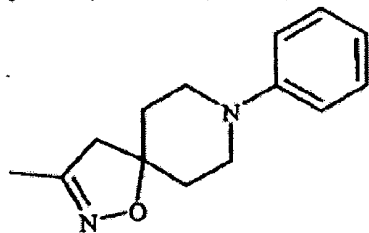
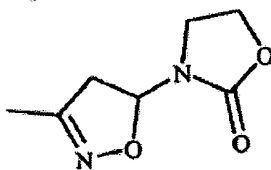
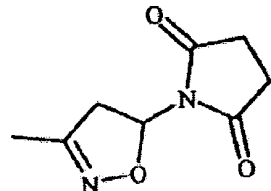
Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
146	L-1	X ¹	G-1		622
147	L-1	X ¹	G-1		574
148	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(3-thienyl)-3-isoxazolyl	510
149	L-1	X ¹	G-1	3-methylphenyl	449
150	L-1	X ¹	G-1	4-methoxyphenyl	465
151	L-1	X ¹	G-1	4-methylphenyl	449
152	L-1	X ¹	G-1	3-methoxyphenyl	465
153	L-1	X ¹	G-1	2-methoxyphenyl	465
154 (Ex. 7)	L-1	X ²	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	505
155	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2,4,6-trimethoxyphenyl)-3-isoxazolyl	594
156	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-acetoxymethyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	576
157	L-1	X ¹	G-1	 [Note 3]	558
158	L-1	X ¹	G-1	 [Note 4]	558
159	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-hydroxymethyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	534

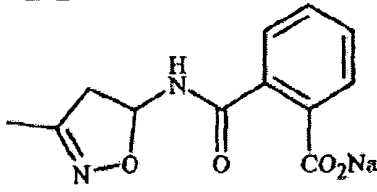
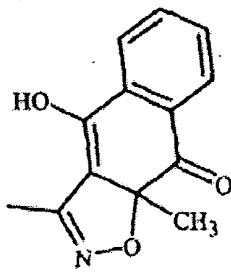
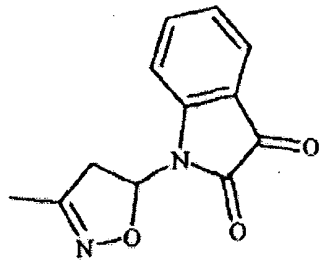
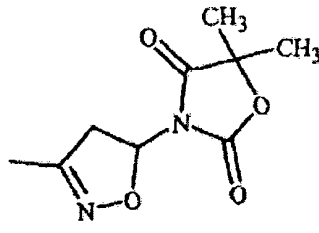
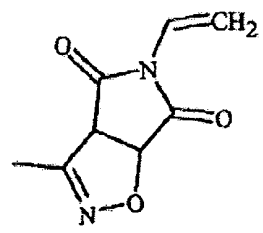
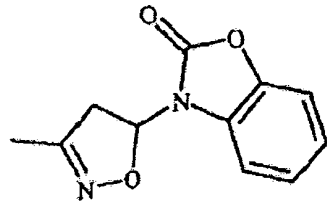
Cmpd.	L	X	G	Z _J -J	AP ⁺ (M+1)
160	L-1	X ¹	G-1		515
161	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-methylphenyl)-3-isoxazolyl	518
162	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-thien-2-yl-3-isoxazolyl	510
163	L-8	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-methyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	464
164	L-8	X ¹	G-1		490
165	L-8	X ¹	G-1		476
166	L-20	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	490
167	L-21	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	647
168	L-23	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	579
169	L-1	X ¹	G-1		496
170	L-1	X ¹	G-1	 [Note 5]	572
171	L-1	X ¹	G-1	 [Note 5]	572
172	L-24	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	562

Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
173	L-1	X ¹	G-1		498
174	L-1	X ¹	G-1		510
175	L-1	X ¹	G-1	 [Note 3]	576
176	L-1	X ¹	G-1	 [Note 4]	576
177	L-1	X ¹	G-1		587
178	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2,6-dimethylphenyl)-3-isoxazolyl	532
179	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2,4,6-trimethylphenyl)-3-isoxazolyl	546
180	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-pyridin-4-yl-3-isoxazolyl	505
181	L-1	X ¹	G-1		547

Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
182	L-1	X ¹	G-1		561
183	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-1H-pyrazol-3-yl	503
184	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-(1-methyl-1H-pyrazol-3-yl)	517
185	L-1	X ¹	G-1		532
186	L-1	X ¹	G-1	 [Note 3]	586
187	L-1	X ¹	G-1	 [Note 4]	586
188	L-1	X ¹	G-1		511
189	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-bromo-phenyl)-3-isoxazolyl	582
190	L-26	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	524
191	L-1	X ¹	G-1		518

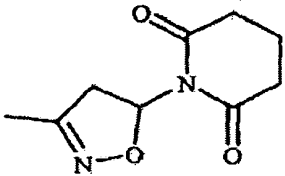
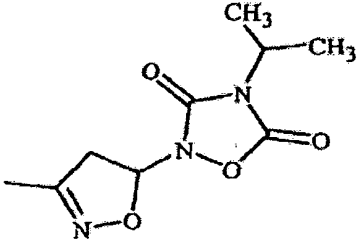
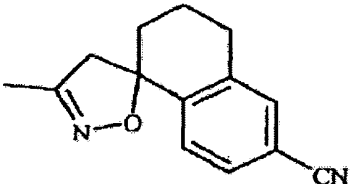
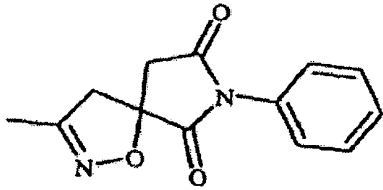
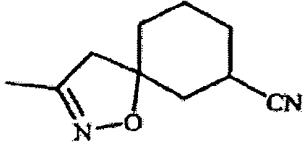
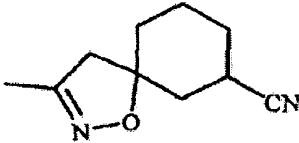
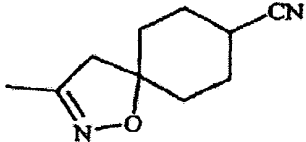
Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
192	L-1	X ¹	G-1		558
193	L-1	X ¹	G-1		468
194	L-1	X ¹	G-1		597
195	L-1	X ¹	G-1		497
196	L-1	X ¹	G-1		539
197	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-(1-acetyl-1H-pyrazol-3-yl)	545
198	L-28	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	524
199	L-1	X ¹	G-1		500
200	L-1	X ¹	G-1		484
201	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(4-methylthiazol-5-yl)-3-isoxazolyl	525
202	L-1	X ¹	G-1		566

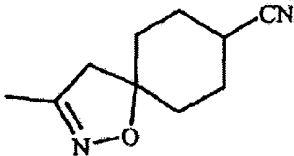
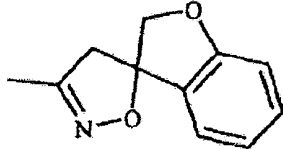
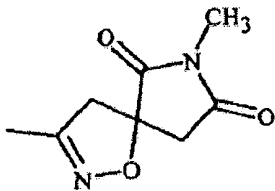
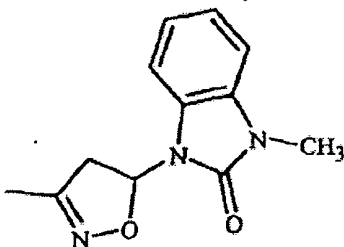
Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
203	L-1	X ¹	G-1	3-isoxazolyI	425
204	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenoxy-3-isoxazolyI	520
205	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-methyl -5-(2-methylphenyl)-3-isoxazolyI	532
206	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2,6-dimethoxyphenyl)-3-isoxazolyI	564
207	L-1	X ¹	G-1		469
208	L-1	X ¹	G-1		500
209	L-1	X ¹	G-1		558
210	L-1	X ¹	G-1	5-(2-hydroxycarbonylphenyl)-3-isoxazolyI	546
211	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(1,1-dimethylethoxy)-3-isoxazolyI	500
212	L-1	X ¹	G-1		573
213	L-1	X ¹	G-1		513
214	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2,6-difluorophenyl)-3-isoxazolyI	540
215	L-1	X ¹	G-1		525

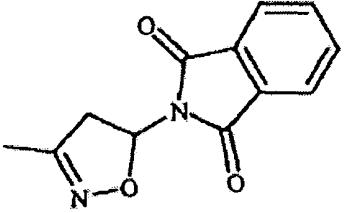
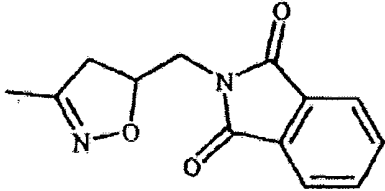
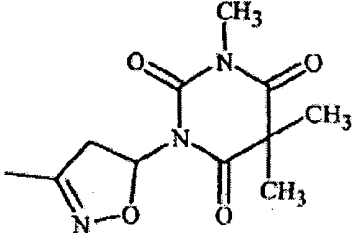
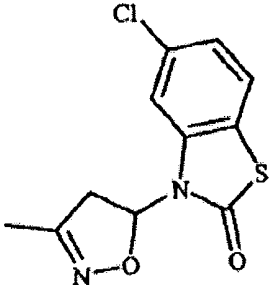
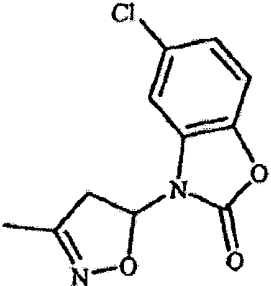
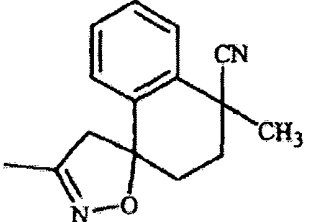
Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
216	L-1	X ¹	G-1		613
217 (Ex. 13)	L-1	X ³	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	502
218	L-1	X ¹	G-1		572
219	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(1-methylbenzimidazol-2-yl)-3-isoxazolyl	558
220	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-cyanophenyl)-3-isoxazolyl	529
221	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-2-methoxycarbonylphenyl-3-isoxazolyl	562
222	L-1	X ¹	G-1		573
223	L-1	X ¹	G-1		555
224	L-1	X ¹	G-1		523
225	L-1	X ¹	G-1		561

Cmpd.	L	X	G	$Z_1 \cdot J$	AP^+ (M+1)
226	L-1	X^1	G-1		541
227	L-1	X^1	G-1		601
228	L-1	X^1	G-1		615
229	L-5	X^1	G-1		598
230	L-10	X^1	G-1		564
231	L-5	X^1	G-1		584

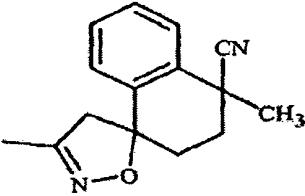
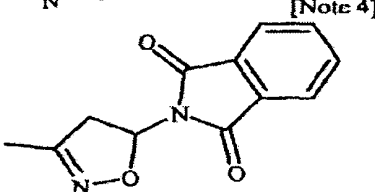
Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
232	L-10	X ¹	G-1		550
233	L-1	X ¹	G-1		559
234	L-1	X ¹	G-1		540
235	L-1	X ¹	G-1		568
236	L-1	X ¹	G-1		609
237	L-29	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	508
238	L-30	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	508
239	L-31	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	566
240	L-32	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	562
241	L-33	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	534
242	L-1	X ¹	G-1		520

Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
243	L-1	X ¹	G-1		539
244	L-1	X ¹	G-1		570
245	L-1	X ¹	G-1	4-fluorophenyl	453
246	L-1	X ¹	G-1	4-t-butylphenyl	491
247	L-1	X ¹	G-1	4-cyanophenyl	460
248	L-1	X ¹	G-1	4-nitrophenyl	480
249	L-1	X ¹	G-1	4-bromophenyl	513
250	L-1	X ¹	G-1	4-iodophenyl	561
251	L-1	X ¹	G-1		569
252	L-1	X ¹	G-1		587
253	L-1	X ¹	G-1	 [Note 3]	521
254	L-1	X ¹	G-1	 [Note 4]	521
255	L-1	X ¹	G-1	 [Note 3]	521

Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
256	L-1	X ¹	G-1		521
				[Note 4]	
257	L-22	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	506
258	L-25	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	556
259	L-27	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-phenyl-3-isoxazolyl	520
260	L-5	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-methyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	572
261	L-10	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-methyl-5-phenyl-3-isoxazolyl	538
262	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-aminosulfonylbenzyl)-3-isoxazolyl	597
263	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2-acetoxyphenyl)-3-isoxazolyl	562
264	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(N-methyl-N-phenylcarbonylamino)-3-isoxazolyl	561
265	L-1	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-cyano-5-phenyl-3-isoxazolyl	529
266	L-8	X ¹	G-1		478
267	L-1	X ¹	G-1		525
268	L-1	X ¹	G-1	4-ethylphenyl	463
269	L-1	X ¹	G-1	4-trifluoromethoxyphenyl	519
270	L-1	X ¹	G-1	4-methoxycarbonylphenyl	493
271	L-1	X ¹	G-1	4-propylphenyl	477
272	L-1	X ¹	G-1	4-methylthiophenyl	481
273	L-1	X ¹	G-1	4-isopropylphenyl	477
274	L-1	X ¹	G-1	4-isobutylphenyl	491
275	L-1	X ¹	G-1		574

Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
276	L-5	X ¹	G-1		627
277	L-8	X ¹	G-1	4,5-dihydro-5-(2,4,6-trimethoxyphenyl)-3-isoxazolyl	540
278	L-1	X ¹	G-1		587
279	L-1	X ¹	G-1		596
280	L-1	X ¹	G-1		611
281	L-1	X ¹	G-1		595
282	L-1	X ¹	G-1		583

[Note 3]

Cmpd.	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
283	L-1	X ¹	G-1		583
284	L-8	X ¹	G-1		519

Obs. 1: enantiômero com eluição mais rápida da coluna AD-RH CHIRALPAK® utilizando metanol em água como eluente, rotação específica = -98,8°. Análise utilizando coluna AD-RH CHIRALPAK® analítica indicou cerca de 100% de pureza ótica.

5 Obs. 2: enantiômero com eluição mais lenta da coluna de fase reversa AD-RH CHIRALPAK® utilizando metanol em água como eluente, rotação específica = +88°. Análise utilizando coluna AD-RH CHIRALPAK® analítica indicou cerca de 93% de pureza ótica.

Obs. 3: Diaestereômero A.

10 Obs. 4: Diaestereômero B.

Obs. 5: Mistura de isômeros.

EXEMPLOS BIOLÓGICOS DA INVENÇÃO

Protocolo geral de preparação de suspensões de teste para os Testes A a C: Os compostos de teste foram dissolvidos em primeiro lugar em acetona em uma quantidade igual a 3% do volume final e suspensos em
 15 seguida na concentração desejada (em ppm) em acetona e água purificada (mistura 50/50 em volume) que contém 250 ppm do tensoativo Trem® 014 (ésteres de álcool poli-hídrico). As suspensões de teste resultantes foram utilizadas em seguida nos Testes A a C. Pulverização de uma suspensão de
 20 teste de 200 ppm até o ponto de encharcamento das plantas de teste foi

equivalente a uma taxa de 500 g/ha.

TESTE A

Mudas de uva foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Plasmopara viticola* (o agente causador do míldo felpudo da uva) e incubadas em uma atmosfera saturada a 20 °C por 24 horas. Após um curto período de secagem, a suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento sobre as mudas de uva, que foram movidas em seguida para uma câmara de crescimento a 20 °C por cinco dias, após o quê a muda de uva foi colocada de volta em uma atmosfera saturada a 20 °C por 24 horas. Mediante remoção, foram realizadas avaliações visuais da doença.

TESTE B

A suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento sobre mudas de tomate. No dia seguinte, as mudas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Phytophthora infestans* (o agente causador da ferrugem posterior do tomate), incubadas em uma atmosfera saturada a 20 °C por 24 horas e movidas em seguida para uma câmara de crescimento a 20 °C por cinco dias, após o quê foram realizadas avaliações visuais da doença.

TESTE C

Mudas de tomate foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Phytophthora infestans* (o agente causador de ferrugem posterior do tomate) e incubadas em atmosfera saturada a 20 °C por dezessete horas. Após um curto período de secagem, a suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento sobre as mudas de tomate, que foram movidas em seguida para uma câmara de crescimento a 20 °C por quatro dias, após o quê foram realizadas avaliações visuais da doença.

Além dos Testes A a C, os compostos foram também pulverizados sobre dois conjuntos separados de plantas de tomate, que foram inoculadas com *Botrytis cinerea* ou *Alternaria solani* 24 horas após o tratamento, plantas de grama azul, que foram inoculadas com *Pythium aphanidermatum* 24 horas após o tratamento e três conjuntos separados de plantas de trigo, que foram inoculadas com *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, *Puccinia recondita* ou *Septoria nodorum* 24 horas após o tratamento. Os compostos testados não exibiram atividade observável contra esses patógenos adicionais sob as condições de teste nas taxas de aplicação testadas.

Os resultados dos Testes A a C são fornecidos na Tabela A. Na tabela, uma avaliação de 100 indica 100% de controle da doença e avaliação de 0 indica ausência de controle de doença (com relação aos controles). Traço (-) indica ausência de substituintes.

TABELA A

RESULTADOS DE TESTES BIOLÓGICOS

Percent Disease Control				Percent Disease Control			
<u>Compound</u>	<u>Test A</u>	<u>Test B</u>	<u>Test C</u>	<u>Compound</u>	<u>Test A</u>	<u>Test B</u>	<u>Test C</u>
1	100	100	99	10	97	100	99
2	100	99	99	11	99	100	99
3**	100	100	99	12	52	47	0
4**	100	100	99	13	0	95	86
5	96	100	99	14	25	99	99
6*	95	100	99	15	100	100	98
7	0	93	59	16	99	100	99
8	100	100	99	17*	100	99	99
9	99	100	99	18*	100	100	99

Percent Disease Control			
<u>Compound</u>	<u>Test A</u>	<u>Test B</u>	<u>Test C</u>
19*	100	100	99
20*	96	99	99
21*	46	50	7
22*	100	100	99
23*	99	100	99
24	99	100	93
25*	100	100	99
26	76	83	33
27	100	100	98
28	99	100	94
29	99	100	99
30**	31	57	50
31**	84	83	60
32	0	26	0
33	15	9	0
34	0	40	0
*	100	100	96
36	58	57	24
37*	100	100	99
38	0	9	0
39	8	67	0
40	47	100	99
41	0	100	99
42	62	100	96
43	0	43	0
44*	100	100	99
45	30	26	0
46	0	99	53
47	0	85	47
48	0	85	0
49	0	100	96
50	0	100	99
51	99	100	99
52	85	100	67
53*	24	68	26
54	16	73	0

Percent Disease Control			
<u>Compound</u>	<u>Test A</u>	<u>Test B</u>	<u>Test C</u>
55	17	26	0
56	99	100	99
57	99	100	99
58	0	99	0
59*	97	100	91
60	100	95	94
61	80	77	0
62	73	73	26
63	80	100	98
64	90	99	88
65	46	100	83
66	48	63	73
67*	100	100	99
68	96	95	88
69	40	9	0
70	8	24	0
71	-	99	33
72	72	100	52
73	27	40	0
74	50	40	0
75	72	24	0
76	72	92	67
77	87	100	99
78	0	0	0
79	100	100	66
80	99	100	57
81	93	92	77
82	0	88	26
83	46	92	0
84	67	33	0
85	85	70	0
86	83	79	14
87	76	44	0
88*	99	100	99
89	49	73	0
90	66	57	0

Percent Disease Control			
<u>Compound</u>	<u>Test A</u>	<u>Test B</u>	<u>Test C</u>
91*	99	100	91
92*	13	33	9
93*	78	100	99
94*	99	100	99
95*	100	100	95
96*	100	100	99
97*	99	100	95
98*	77	100	99
99	31	33	0
100*	100	100	99
101*	100	100	99
102*	100	100	99
103*	100	100	99
104	100	100	99
105*	100	100	99
106*	80	85	24
107*	100	100	99
108	0	58	0
109*	100	100	98
110*	97	100	99
111*	97	100	97
112*	76	100	68
113*	99	100	99
114*	100	100	99
115*	100	100	99
116	46	100	79
117*	93	100	99
118*	0	87	16
119	0	82	0
120	99	88	0
121	83	47	0
122	99	46	0
123	95	68	0
124	8	98	26
125	31	53	0
126	100	100	99

Percent Disease Control			
<u>Compound</u>	<u>Test A</u>	<u>Test B</u>	<u>Test C</u>
127	73	40	0
128*	100	100	99
129*	99	100	99
130**	100	100	99
131*	100	100	99
132*	85	100	91
133*	100	100	99
134*	90	100	66
135*	100	100	99
136*	99	100	99
137*	100	100	99
138*	93	100	99
139*	87	98	87
140*	98	100	57
141*	99	100	99
142*	97	100	98
143*	99	100	99
144*	99	100	93
145	17	58	0
146	83	100	53
147*	100	100	95
148**	100	100	99
149	99	97	-
150	99	100	-
151	100	99	-
152	91	89	-
153	73	0	-
154*	90	100	99
155*	100	100	99
156*	100	100	99
157*	100	100	94
158	96	100	99
159	94	100	99
160	68	80	17
161*	100	100	99
162*	100	100	99

<u>Compound</u>	<u>Percent Disease Control</u>		
	<u>Test A</u>	<u>Test B</u>	<u>Test C</u>
163**	99	100	98
164**	99	100	99
165**	99	100	99
166**	100	100	98
167	67	64	24
168**	100	100	99
169	100	100	99
170*	99	100	93
171*	99	100	98
172*	91	63	0
173*	100	100	99
174*	100	100	99
175	68	100	33
176	68	100	63
177*	93	100	99
178*	100	100	99
179*	99	100	98
180	50	100	99
181	80	100	97
182	99	100	97
183*	92	92	33
184*	99	95	73
185*	100	100	98
186*	95	100	86
187*	99	100	93
188*	99	100	99
189*	100	100	99
190	80	68	17
191	99	100	99
192*	99	100	99
193*	100	100	99
194*	94	100	99
195	48	92	80
196*	99	100	99
197*	89	100	90
198*	100	100	99

<u>Compound</u>	<u>Percent Disease Control</u>		
	<u>Test A</u>	<u>Test B</u>	<u>Test C</u>
199	91	99	98
200	80	100	90
201*	99	100	99
202	95	100	98
203*	99	100	92
204*	99	100	99
205*	99	100	99
206*	99	100	99
207	40	83	0
208	79	64	0
209*	99	100	90
210	91	100	83
211*	100	100	99
212*	98	100	99
213*	94	100	98
214*	100	100	99
215*	99	100	99
216*	100	100	99
217*	95	100	99
218*	73	63	47
219	100	100	99
220	100	100	99
221	100	100	99
222	100	100	100
223	100	100	100
224	0	63	0
225	100	100	100
226	83	100	99
227	100	100	100
228	99	100	100
229**	100	100	100
230**	100	100	100
231**	100	100	100
232**	100	100	100
233*	100	100	100
234*	99	100	100

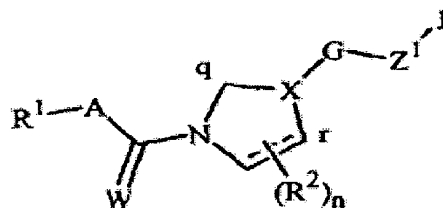
Percent Disease Control				Percent Disease Control			
<u>Compound</u>	<u>Test A</u>	<u>Test B</u>	<u>Test C</u>	<u>Compound</u>	<u>Test A</u>	<u>Test B</u>	<u>Test C</u>
235*	99	100	100	261**	100	100	93
236*	100	100	100	262*	79	100	91
237*	22	47	16	263*	99	84	83
238*	100	100	100	264*	99	100	88
239*	14	0	0	265**	100	100	98
240*	100	100	100	266*	100	100	100
241*	100	100	100	267	100	100	100
242*	99	100	85	268	100	100	88
243**	99	100	100	269	100	100	0
244*	98	100	99	270	99	83	0
245*	99	74	0	271	100	100	72
246*	99	79	40	272	100	100	100
247*	99	100	88	273	100	100	90
248*	90	73	26	274	99	100	100
249*	99	64	0	275**	99	100	98
250*	86	58	0	276**	100	100	97
251*	99	100	99	277*	86	100	99
252*	88	91	97	278*	94	100	99
253*	100	100	95	279*	100	100	99
254*	100	100	93	280**	92	100	98
255*	95	100	93	281**	100	100	99
256*	100	100	99	282	-	-	-
257*	17	0	0	283	-	-	-
258**	100	100	98	284	-	-	-
259*	100	100	99				
260**	100	100	96				

* indica compostos testados a 40 ppm.

** indica compostos testados a 10 ppm.

REIVINDICAÇÕES

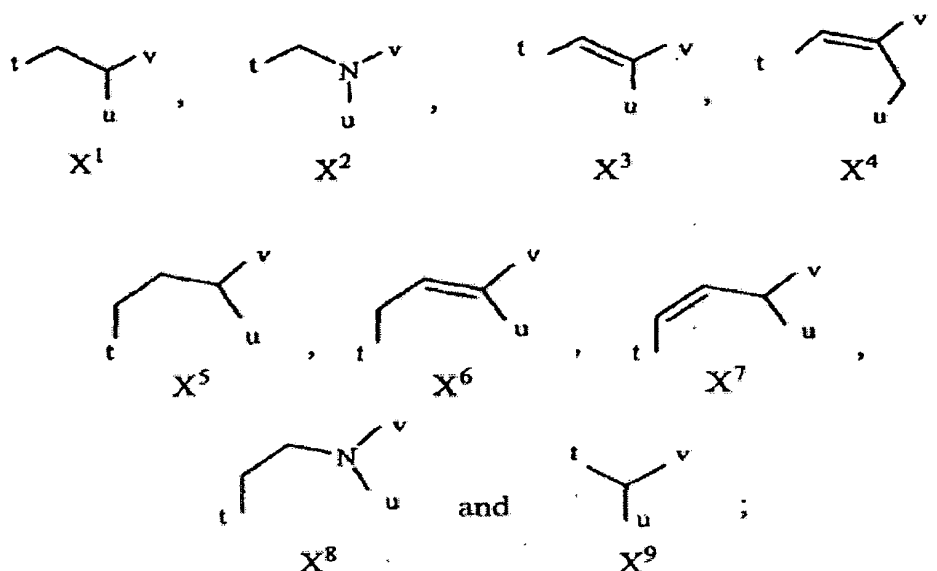
1. COMPOSTO, selecionado a partir da Fórmula 1, seu *N*-óxido e sal:

**1**

em que:

- 5 - R¹ é fenila opcionalmente substituído, naftalenila ou anel heteroaromático com cinco ou seis membros;
- A is CHR¹⁵ ou NR¹⁶;
- R¹⁵ é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, haloalquila C₁-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄, alcoxialquila C₂-C₄, alquiltioalquila C₂-C₄, alquilsulfinilalquila C₂-C₄, alquilsulfonylalquila C₂-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, haloalquilcarbonila C₂-C₄, alcoxycarbonila C₂-C₅, alcoxycarbonilalquila C₃-C₅, alquilaminocarbonila C₂-C₅, dialquilaminocarbonila C₃-C₅, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonyl C₁-C₄ ou haloalquilsulfonyl C₁-C₄;
- 10 - R¹⁶ é H, alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, haloalquila C₁-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄, alcoxialquila C₂-C₄, alquiltioalquila C₂-C₄, alquilsulfinilalquila C₂-C₄, alquilsulfonylalquila C₂-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, haloalquilcarbonila C₂-C₄, alcoxycarbonila C₂-C₅, alcoxycarbonilalquila C₃-C₅, alquilaminocarbonila C₂-C₅, dialquilaminocarbonila C₃-C₅, dialquilaminocarbonila C₃-C₅, alquilsulfonyl C₁-C₄ ou haloalquilsulfonyl C₁-C₄;
- 15 - W é O ou S;

- X é um radical selecionado a partir de:



em que a união de X^1 , X^2 , X^3 , X^4 , X^5 , X^6 , X^7 , X^8 ou X^9 que é
 5 identificada com "t" é conectada ao átomo de carbono identificado com "q" da
 Fórmula 1, a união que é identificada com "u" é conectada ao átomo de
 carbono identificado com "r" da Fórmula 1 e a união que é identificada com "v"
 é conectada a G;

- cada R^2 é independentemente alquila C_1 - C_4 , alquenila C_1 -
 10 C_4 , haloalquila C_1 - C_4 , alcóxi C_1 - C_4 , halogênio, ciano ou hidróxi; ou

- dois R^2 são tomados em conjunto como alquilenos C_1 - C_4 ou
 alquilenos C_2 - C_4 para formar um sistema de anéis bicíclicos em ponte ou
 bicíclicos fundidos; ou

- dois R^2 ligados a átomos de carbono de anéis adjacentes
 15 unidos por uma união dupla são tomados em conjunto como $-CH=CH-CH=CH-$
 opcionalmente substituído com um a três substituintes selecionados a partir de
 alquila C_1 - C_4 , haloalquila C_1 - C_4 , alcóxi C_1 - C_4 , haloalcóxi C_1 - C_4 , halogênio,
 hidróxi, amino, ciano e nitro;

- G é um anel heteroaromático com cinco membros
 20 opcionalmente substituído ou um anel heterocíclico saturado ou parcialmente

saturado com cinco membros;

- J é um anel com cinco, seis ou sete membros, sistema de anéis bicíclicos com oito a onze membros ou um sistema de anéis espirocíclicos com sete a onze membros, em que cada anel ou sistema de anéis contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e, opcionalmente, um a quatro heteroátomos selecionados a partir de até 2 O, até 2 S e até 4 N e que inclui opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂ e SiR¹⁷R¹⁸, em que cada anel ou sistema de anéis é opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁵;

- cada R⁵ é independentemente H, halogênio, ciano, hidróxi, amino, nitro, -CHO, -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, -NR²⁵R²⁶, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₈, halocicloalquila C₃-C₈, alquilocicloalquila C₄-C₁₀, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, cicloalquilocicloalquila C₆-C₁₄, halocicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquila C₅-C₁₀, cicloalquenila C₃-C₈, halocicloalquenila C₃-C₈, alcoxialquila C₂-C₆, cicloalcoxialquila C₄-C₁₀, alcoxialcoxialquila C₃-C₈, alquiltioalquila C₂-C₆, alquilsulfinilalquila C₂-C₆, alquilsulfonilalquila C₂-C₆, alquilaminoalquila C₂-C₆, dialquilaminoalquila C₃-C₈, haloalquilaminoalquila C₂-C₆, cicloalquilaminoalquila C₄-C₁₀, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, cicloalquilcarbonila C₄-C₈, alcoxycarbonila C₂-C₆, cicloalcoxycarbonila C₄-C₈, cicloalquilalcoxycarbonila C₅-C₁₀, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈, cicloalquilaminocarbonila C₄-C₈, haloalcoxialquila C₂-C₆, hidroxialquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈, halocicloalcóxi C₃-C₈, cicloalquilalcóxi C₄-C₁₀, alquenilóxi C₂-C₆, haloalquenilóxi C₂-C₆, alquinilóxi C₂-C₆, haloalquinilóxi C₂-C₆, alcoxialcóxi C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, haloalquilcarbonilóxi C₂-C₆, cicloalquilcarbonilóxi C₄-C₈, alquilcarbonilalcóxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-

C₈, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, cicloalquilsulfonila C₃-C₈, trialquilsilila C₃-C₁₀, alquilsulfonilamino C₁-C₆, haloalquilsulfonilamino C₁-C₆ ou $-Z^2Q$;

5 - R²⁵ é H, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₆ ou haloalcoxycarbonila C₂-C₆;

 - R²⁶ é alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₆, haloalcoxycarbonila C₂-C₆ ou $-Z^4Q$;

10 - cada R¹⁷ e R¹⁸ é independentemente alquila C₁-C₅, alquenila C₂-C₅, alquinila C₂-C₅, cicloalquila C₃-C₅, halocicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₇, alquilcicloalquilalquila C₅-C₇, haloalquila C₁-C₅, alcóxi C₁-C₅ ou haloalcóxi C₁-C₅;

 - cada Q é independentemente fenila, benzila, naftalenila,
15 um anel heteroaromático com cinco ou seis membros ou um sistema de anéis bicíclicos heteroaromáticos com oito a onze membros, cada qual opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁷ sobre membros de anéis de átomos de carbono e R¹² sobre membros de anéis de átomos de nitrogênio; ou

20 - cada Q é independentemente um anel carbocíclico não aromático com três a sete membros, um anel heterocíclico não aromático com cinco, seis ou sete membros ou um sistema de anéis bicíclicos não aromáticos com oito a onze membros, em que cada qual inclui opcionalmente membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂
25 e SiR¹⁷R¹⁸ e opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁷ sobre membros de anéis de átomos de carbono e R¹² sobre membros de anéis de átomos de nitrogênio;

 - cada R⁷ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-

C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₈, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄,
 5 alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcóxi C₁-C₄, hidroalquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;

10 ou

- R⁵ e R⁷ são tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído que contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1
 15 S e até 1 N e que incluem opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂ e SiR¹⁷R¹⁸;

- R¹² é H, alquila C₁-C₃, alquilcarbonila C₁-C₃, alcóxi C₁-C₃ ou alcóxi C₁-C₃;

20 - cada Z¹ e Z² é independentemente uma união direta, O, C(=O), S(O)_m, CHR²⁰ ou NR²¹;

- cada Z⁴ é independentemente O, C(=O), S(O)_m ou CHR²⁰;

- cada R²⁰ é independentemente H, alquila C₁-C₄ ou haloalquila C₁-C₄;

25 - cada R²¹ é independentemente H, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, alcóxi C₁-C₄, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆ ou haloalcoxycarbonila C₂-C₆;

- cada m é independentemente 0, 1 ou 2; e

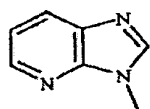
- n é 0, 1 ou 2;

desde que:

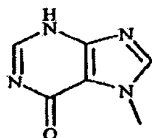
(a) quando R^1 for tienila não substituído, X for X^1 e o anel que contém X for saturado, G for um anel tiazol não substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z^1 na Fórmula 1, A for CHR^{15} , R^{15} for H e J for um anel isoxazol conectado na sua posição 4 a Z^1 , substituído na sua posição 5 com metila e na sua posição 3 com fenila meta-substituído, Z^1 é O, $C(=O)$, $S(O)_m$, CHR^{20} ou NR^{21} ;

(b) quando A for NR^{16} , X for X^1 ou X^2 , Z^1 for uma união direta e J for fenila, J é substituído com pelo menos um R^5 diferente de H, F, Cl, CN, OCH_3 , CF_3 e CH_3 ; e

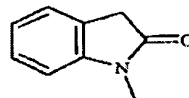
(c) quando A for CHR^{15} , R^{15} for H, W for O, X for X^1 , n for 0, G for um anel tiazol conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z^1 na Fórmula 1 e unido na sua posição 5 a H, F, Cl ou Br, Z^1 for uma união direta e R^1 for:



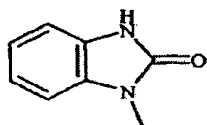
R¹-1



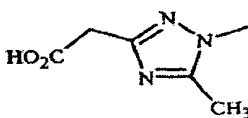
R¹-2



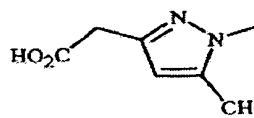
R¹-3



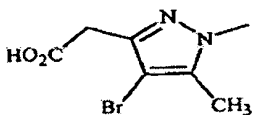
R¹-4



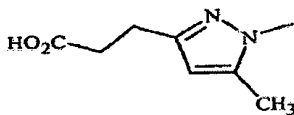
R¹-5



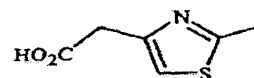
R¹-6



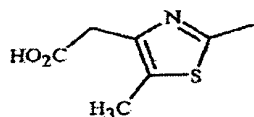
R¹-7



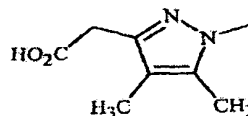
R¹-8



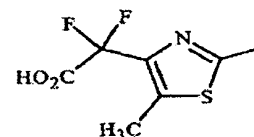
R¹-9



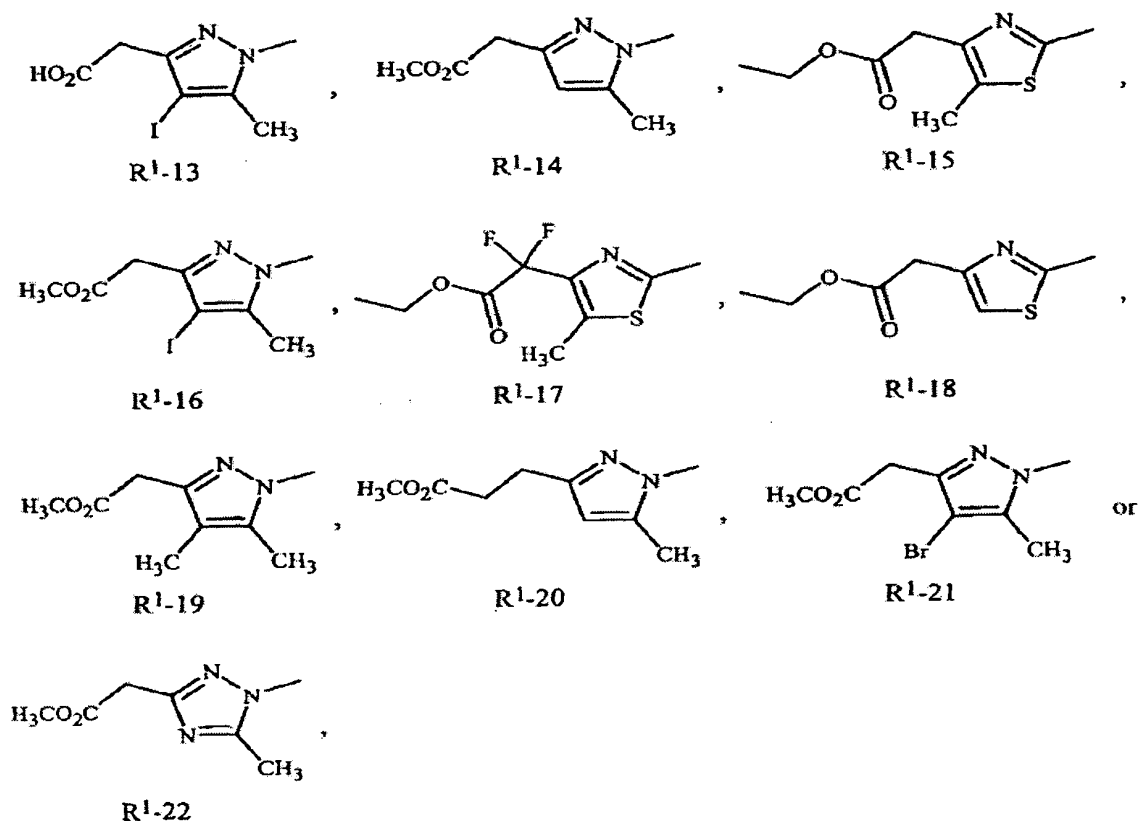
R¹-10



R¹-11



R¹-12



quando J for um fenila substituído ou pirimidin-4-ila substituído, ele é substituído com pelo menos um R⁵ diferente de H, SCF₃, OCF₃, C(CH₃)₃, S(O)₂CF₃, OCH₃, CF₃, Br, ciclopropila, 1-metilciclopropila, OH ou CF₂CH₃ e, quando J for um 2,3-di-hidro-1H-inden-4-ila ou 5,6,7,8-tetraidronaftalen-2-ila, ele é substituído com pelo menos um R⁵ diferente de H, CH₃ ou C(CH₃)₃.

2. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, em que:

G é um anel heteroaromático com cinco membros ou um anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado com cinco membros, em que cada anel é opcionalmente substituído com até dois substituintes selecionados a partir de R³ sobre membros de anéis de carbono e selecionados a partir de R¹¹ sobre membros de anéis de nitrogênio;

R¹ é fenila ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituído com um a dois substituintes selecionados independentemente a partir de R^{4a} sobre membros de anéis de carbono e R^{4b}

sobre membros de anéis de nitrogênio;

- cada R^2 é independentemente alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , alcóxi C_1-C_2 , halogênio, ciano ou hidróxi;

- cada R^3 é independentemente alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 ou halogênio;

- cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilocicloalquila C_4-C_{10} , alquilocicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialquilsilila C_3-C_6 ;

- cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_3-C_6 , alquinila C_3-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_3-C_6 , haloalquinila C_3-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 ou alcoxialquila C_2-C_4 ;

- cada R^{11} é independentemente alquila C_1-C_3 ;

- R^{15} é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 ou alcoxicarbonila C_2-C_5 ;

- R^{16} é H, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , haloalquilcarbonila C_2-C_4 ou alcoxicarbonila C_2-C_4 ;

- quando R^5 e R^7 forem tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído, R^5 e R^7 são tomados em conjunto com os átomos que ligam R^5 e R^7 para formar um anel com cinco a sete membros que contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e opcionalmente um a três

heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N e que incluem opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂ e SiR¹⁷R¹⁸, em que o anel é opcionalmente substituído sobre membros de anéis diferentes dos átomos que ligam R⁵ e R⁷ com até quatro substituintes selecionados a partir de R⁸;

- cada R⁸ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcovicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;
- e

- cada Z⁴ é independentemente C(=O) ou S(O)₂.

3. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 2, em que:

- G é um dentre G-1 a G-59, em que a união que se projeta para a esquerda é unida a X e a união que se projeta para a direita é unida a Z¹;

- J é um dentre J-1 a J-82, em que a união exibida projetando-se para a esquerda é unida a Z¹;

- Q é um dentre Q-1 a Q-102;

- R¹ é um dentre U-1 a U-50;

- cada R² é independentemente metila, metóxi, ciano ou hidróxi;

- cada R^{3a} é selecionado independentemente a partir de H e

R³;

- cada R⁵ é independentemente H, ciano, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₈, halocicloalquila C₃-C₈, alquilocicloalquila C₄-C₁₀, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alcoxialquila C₂-C₆, cicloalcoxialquila C₄-C₁₀, alcoxialcoxialquila C₃-C₈, alquiltioalquila C₂-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈, halocicloalcóxi C₃-C₈, cicloalquilalcóxi C₄-C₁₀, alquenilóxi C₂-C₆, haloalquenilóxi C₂-C₆, alquinilóxi C₂-C₆, haloalquinilóxi C₂-C₆, alcoxialcóxi C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, haloalquilcarbonilóxi C₂-C₆, cicloalquilcarbonilóxi C₄-C₈, alquilcarbonilalcóxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈, trialquilsilila C₃-C₁₀, - NR²⁵R²⁶ ou Z²Q;

- R^{11a} é selecionado a partir de H e R¹¹;
- R¹⁵ é H, ciano, hidróxi, metila ou metoxicarbonila;
- R¹⁶ é H, metila, metilcarbonila ou metoxicarbonila;
- cada Z⁴ é C(=O);
- k é 0, 1 ou 2;
- p é 0, 1, 2 ou 3; e
- x é um número inteiro de 0 a 5;

desde que:

- (a) quando R⁴ for ligado a um membro de anel de carbono, o mencionado R⁴ é selecionado a partir de R^{4a};
- (b) quando R⁴ for ligado a um membro de anel de nitrogênio (tal como em U-4, U-11 a U-15, U-24 a U-26, U-31 ou U-35), o mencionado R⁴ é selecionado a partir de R^{4b};
- (c) quando G for G-6, G-16 ou G-42 e cada R^{3a} for diferente de H, R^{11a} é H;
- (d) quando G for G-25 ou G-31, pelo menos um R^{3a} é H; e

(e) quando G for um dentre G-31 a G-35, Z^1 é uma união direta ou CHR^{20} .

4. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 3, em que:

- G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, 5 G-23, G-24, G-26, G-27, G-36, G-37, G-38, G-49, G-50 e G-55;
- J é selecionado a partir de J-1, J-2, J-3, J-4, J-5, J-7, J-8, J-9, J-10, J-11, J-12, J-14, J-15, J-16, J-20, J-24, J-25, J-26, J-29, J-30, J-37, J-38, J-45 e J-69;
- cada Q é independentemente Q-1, Q-20, Q-32 a Q-34, Q-10 45 a Q-47, Q-60 a Q-73, Q-76 a Q-79, Q-84 a Q-94 e Q-98 a Q-102;
- A é CH_2 ou NH;
- W é O;
- X é X^1 , X^2 ou X^3 ;
- cada R^5 é independentemente H, ciano, alquila C_1-C_6 , 15 haloalquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , halocicloalquila C_3-C_8 , alcóxialquila C_2-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , cicloalcóxi C_3-C_8 , alquenilóxi C_2-C_6 , haloalquenilóxi C_2-C_6 , alquinilóxi C_2-C_6 , alcóxialcóxi C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , haloalquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , trialquilsilila C_3-C_6 , $-NR^{25}R^{26}$ ou Z^2Q ;
- 20 - Z^1 é uma união direta;
- Z^2 é uma união direta ou NR^{21} ;
- R^1 é selecionado a partir de U-1 a U-3, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, U-36 a U-39 e U-50;
- cada R^3 é independentemente metila ou halogênio;
- 25 - cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , halogênio, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;
- cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 ;

- cada R^7 é independentemente halogênio, ciano, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , hidróxi, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;

- k é 1 ou 2; e

- n é 0.

5 5. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 4, em que:

- A é CH_2 ;

- G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 e G-38; e G é não substituído;

10 - J é selecionado a partir de J-4, J-5, J-8, J-11, J-15, J-16, J-20, J-29, J-30, J-37, J-38 e J-69;

- Q é selecionado a partir de Q-1, Q-45, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72, Q-73, Q-76, Q-78, Q-79, Q-84, Q-85, Q-98, Q-99, Q-100, Q-101 e Q-102;

- X é X^1 ou X^2 ; e o anel que compreende X é saturado;

15 - R^1 é U-1 ou U-50;

- cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_2 , trifluorometila, Cl, Br, I ou metóxi;

- cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_2 ou trifluorometila; e

20 - cada R^5 é independentemente H, ciano, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_4 , $-NR^{25}R^{26}$ ou Z^2Q .

6. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 5, em que:

- G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26 e G-36;

25 - J é selecionado a partir de J-4, J-5, J-11, J-20, J-29, J-37, J-38 e J-69;

- Q é selecionado a partir de Q-45, Q-63, Q-64, Q-65, Q-68, Q-69, Q-70, Q-71, Q-72 e Q-85; e

- X é X^1 .

7. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, em que:

- R^1 é fenila opcionalmente substituído ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros;

- A é CH_2 ou NH;

5

- X é $X^1, X^2, X^3, X^4, X^5, X^6, X^7$ ou X^8 ;

- cada R^2 é independentemente alquila C_1-C_4 , alquenila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 , halogênio, ciano ou hidróxi; ou

- dois R^2 são tomados em conjunto como alquilenos C_1-C_3 ou alquilenos C_2-C_3 para formar um sistema de anéis bicíclicos em ponte; ou

10

- dois R^2 ligados a átomos de carbono de anéis adjacentes unidos por uma união dupla são tomados em conjunto como $-CH=CH-CH=CH-$ opcionalmente substituído com um a três substituintes selecionados a partir de alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , halogênio, hidróxi, amino, ciano e nitro;

15

- G é um anel heteroaromático com cinco membros opcionalmente substituído ou anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado com cinco membros;

20

- J é um anel com cinco ou seis membros ou um sistema de anéis bicíclicos com oito a onze membros, em que cada anel ou sistema de anéis contém membros de anéis selecionados a partir de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 3 N e que inclui opcionalmente de um a três membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$ ou $S(O)_2$, em que cada anel ou sistema de anéis é opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R^5 ;

25

- cada R^5 é independentemente H, alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 ,

haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈,
 5 cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₆, haloalcoxialquila C₂-C₆, hidroxialquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₆, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈, trialquilsilila C₃-C₆ ou -Z²Q;

- cada Q é independentemente fenila, benzila, naftalenila,
 10 cicloalquila C₃-C₆, cicloalquenila C₃-C₆ ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituído, cada qual opcionalmente substituído com um a três substituintes selecionados a partir de R⁷ sobre membros de anéis de carbono e R¹² sobre membros de anéis de nitrogênio;

- cada R⁷ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-
 15 C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄,
 20 haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;
 ou

25 - R⁵ e R⁷ são tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituídos que contém como membros de anéis dois a sete átomos de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até

1 O, até 1 S e até 1 N;

- R^{12} é alquila C_1-C_3 ;
- cada Z^1 e Z^2 é independentemente uma união direta, O, $S(O)_m$, CHR^{20} ou NR^{21} ; e

5 - R^{21} é H ou alquila C_1-C_3 .

8. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 7, em que:

- G é um anel heteroaromático com cinco membros ou anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado com cinco membros, em que cada anel é opcionalmente substituído com até dois substituintes selecionados a partir de R^3 sobre membros de anéis de carbono e selecionados a partir de R^{11} sobre membros de anéis de nitrogênio;

10 - R^1 é fenila ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituídos com um a dois substituintes selecionados independentemente a partir de R^{4a} sobre membros de anéis de carbono e R^{4b} sobre membros de anéis de nitrogênio;

15 - cada R^3 é independentemente alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 ou halogênio;

20 - cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialquilsilila C_3-C_6 ;

25 - cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_3-

C₆, alquinila C₃-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₃-C₆, haloalquinila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆ ou alcoxialquila C₂-C₄;

- cada R¹¹ é independentemente alquila C₁-C₃; e
- quando R⁵ e R⁷ forem tomados em conjunto com os

5 átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído, R⁵ e R⁷ são tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros que contém como membros de anéis dois a sete átomos de carbono e opcionalmente um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 1 N
10 opcionalmente substituídos com até dois substituintes selecionados a partir de R⁸; e cada R⁸ é independentemente alquila C₁-C₃.

9. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 8, em que:

- G é um dentre G-1 a G-55;
- J é um dentre J-1 a J-82;
- 15 - Q é um dentre Q-1 a Q-55;
- R¹ é um dentre U-1 a U-50;
- cada R^{3a} é selecionado independentemente a partir de H e

R³;

- R^{11a} é selecionado a partir de H e R¹¹;
- 20 - k é 0, 1 ou 2;
- p é 0, 1 ou 2; e
- x é um número inteiro de 0 a 5;

desde que:

(a) quando R⁴ for ligado a um membro de anel de carbono, o
25 mencionado R⁴ é selecionado a partir de R^{4a};

(b) quando R⁴ for ligado a um membro de anel de nitrogênio (tal como em U-4, U-11 a U-15, U-24 a U-26, U-31 ou U-35), o mencionado R⁴ é selecionado a partir de R^{4b};

(c) quando G for G-6, G-16 ou G-42 e cada R^{3a} for diferente de H, R^{11a} é H;

(d) quando G for G-25 ou G-31, o pelo menos um R^{3a} é H; e

(e) quando G for um dentre G-31 a G-35, Z^1 é uma união direta
5 ou CHR^{20} .

10. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 9, em que:

- G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 e G-38;

- J é selecionado a partir de J-1, J-2, J-3, J-4, J-5, J-7, J-8, J-9, J-10, J-11, J-12, J-14, J-15, J-16, J-20, J-24, J-25, J-26, J-29, J-30, J-45 e J-69;

- cada Q é independentemente Q-1, Q-20, Q-32 a Q-34, Q-45, Q-46 ou Q-47;

- W é O;

15 - X é X^1 , X^2 ou X^3 ;

- cada Z^1 e Z^2 é uma união direta;

- R^1 é selecionado a partir de U-1 a U-3, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, U-36 a U-39 e U-50;

- cada R^3 é independentemente metila ou halogênio;

20 - cada R^{4a} é independentemente alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , halogênio ou alcóxi C_1-C_2 ;

- cada R^{4b} é independentemente alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 ;

- um caso de R^5 é Z^2Q e os outros casos de R^5 são
25 selecionados independentemente a partir de H, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 e halogênio;

- cada R^7 é independentemente halogênio, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , hidróxi, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;

- k é 1 ou 2; e

- n é 0.

11. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 10, em que:

- A é CH₂;

5 - G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26 e G-36; e

G é não substituído;

- J é selecionado a partir de J-11, J-25, J-26, J-29 e J-30;

- Q é selecionado a partir de Q-1 e Q-45;

- X é X¹ ou X²; e o anel que compreende X é saturado;

10 - R¹ é U-1 ou U-50;

- cada R^{4a} é independentemente alquila C₁-C₂, trifluorometila, Cl, Br, I ou metóxi; e

- cada R^{4b} é independentemente alquila C₁-C₂ ou trifluorometila.

15 12. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 11, em que:

- J é selecionado a partir de J-11 e J-29;

- X é X¹; e

- cada R^{4a} é independentemente alquila C₁-C₂, trifluorometila ou Cl.

20 13. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, em que:

- R¹ é U-1 ou U-50 em que, quando R⁴ for ligado a um membro de anel de carbono, o mencionado R⁴ é selecionado a partir de R^{4a} e, quando R⁴ for ligado a um membro de anel de nitrogênio, o mencionado R⁴ é selecionado a partir de R^{4b};

25 - cada R^{4a} é independentemente alquila C₁-C₂, trifluorometila, Cl, Br, I ou metóxi;

- cada R^{4b} é independentemente alquila C₁-C₂ ou trifluorometila;

- A é CH₂;
 - W é O;
 - X é X¹ ou X² e o anel que compreende X é saturado;
 - cada R² é independentemente etila, metóxi, ciano ou
- 5 hidróxi;
- G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26 e G-36, em que a união que se projeta para a esquerda é unida a X e a união que se projeta para a direita é unida a Z¹; e G é não substituído;
 - cada R^{3a} é selecionado independentemente a partir de H e
- 10 R³;
- cada R³ é independentemente metila ou halogênio;
 - J é selecionado a partir de J-11, J-25, J-26, J-29 e J-30, em que a união exibida projetando-se para a esquerda é unida a Z¹;
 - cada R⁵ é independentemente H, halogênio, ciano, hidróxi,
- 15 amino, nitro, -CHO, -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, -NR²⁵R²⁶, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₈, halocicloalquila C₃-C₈, alquilocicloalquila C₄-C₁₀, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, cicloalquilocicloalquila C₆-C₁₄, halocicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquila C₅-C₁₀, cicloalquenila C₃-C₈, halocicloalquenila C₃-C₈, alcoxialquila C₂-C₆, cicloalcoxialquila C₄-C₁₀, alcoxialcoxialquila C₃-C₈, alquiltioalquila C₂-C₆, alquilsulfinilalquila C₂-C₆, alquilsulfonilalquila C₂-C₆, alquilaminoalquila C₂-C₆, dialquilaminoalquila C₃-C₈, haloalquilaminoalquila C₂-C₆, cicloalquilaminoalquila C₄-C₁₀, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, cicloalquilcarbonila C₄-C₈, alcoxycarbonila C₂-C₆, cicloalcoxycarbonila C₄-C₈, cicloalquilalcoxycarbonila C₅-C₁₀, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈, cicloalquilaminocarbonila C₄-C₈, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈, halocicloalcóxi C₃-C₈, cicloalquilalcóxi C₄-C₁₀, alquenilóxi C₂-C₆, haloalquenilóxi C₂-C₆, alquinilóxi C₂-C₆, haloalquinilóxi
- 20
- 25

C₂-C₆, alcoxialcóxi C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, haloalquilcarbonilóxi C₂-C₆, cicloalquilcarbonilóxi C₄-C₈, alquilcarbonilalcóxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, cicloalquilsulfonila C₃-C₈,
 5 trialquilsilila C₃-C₁₀, alquilsulfonilamino C₁-C₆, haloalquilsulfonilamino C₁-C₆ ou -Z²Q;

- R²⁵ é H, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, alcoxycarbonila C₂-C₆ ou haloalcoxycarbonila C₂-C₆;

10 - R²⁶ é alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, alcoxycarbonila C₂-C₆, haloalcoxycarbonila C₂-C₆ ou -Z⁴Q;

- cada Q é selecionado a partir de Q-1, Q-45 e Q-63;

- cada R⁷ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄,
 15 haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxycarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;
 20 ou

25 - R⁵ e R⁷ são tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros que contém como membros de anéis dois a sete átomos de carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S, até 1 Si e até 1

N, em que o anel é opcionalmente substituído sobre membros de anéis diferentes dos átomos que ligam R^5 e R^7 com até quatro substituintes selecionados a partir de R^8 ;

- cada R^8 é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcóxi C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcóxi C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialkilsilila C_3-C_6 ;
- R^{12} é alquila C_1-C_3 ;
- cada Z^1 e Z^2 é uma união direta;
- cada Z^4 é independentemente $C(=O)$ ou $S(O)_2$;
- n é 0, 1 ou 2;
- k é 0, 1 ou 2;
- p é 0, 1 ou 2; e
- x é um número inteiro de 0 a 5;

desde que, quando R^1 for tienila não substituído, X for X^1 , G for um anel tiazol não substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z^1 na Fórmula 1 e J for um anel isoxazol conectado na sua posição 4 a Z^1 e substituído na sua posição 5 com metila, J é não substituído na sua posição 3 com fenila meta-substituído.

14. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, em que:

- cada R^5 é independentemente H, halogênio, ciano, hidróxi, amino, nitro, $-CHO$, $-C(=O)OH$, $-C(=O)NH_2$, $-NR^{25}R^{26}$, alquila C_1-C_6 , alquenila

C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₈, halocicloalquila C₃-C₈, alquilocicloalquila C₄-C₁₀, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, cicloalquilocicloalquila C₆-C₁₄, halocicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquila C₅-C₁₀, cicloalquenila C₃-C₈, halocicloalquenila C₃-C₈, alcoxialquila C₂-C₆, cicloalcoxialquila C₄-C₁₀, alcoxialcoxialquila C₃-C₈, alquiltioalquila C₂-C₆, alquilsulfinilalquila C₂-C₆, alquilsulfonilalquila C₂-C₆, alquilaminoalquila C₂-C₆, dialquilaminoalquila C₃-C₈, haloalquilaminoalquila C₂-C₆, cicloalquilaminoalquila C₄-C₁₀, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, cicloalquilcarbonila C₄-C₈, alcoxycarbonila C₂-C₆, cicloalcoxycarbonila C₄-C₈, cicloalquilalcoxycarbonila C₅-C₁₀, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈, cicloalquilaminocarbonila C₄-C₈, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈, halocicloalcóxi C₃-C₈, cicloalquilalcóxi C₄-C₁₀, alquenilóxi C₂-C₆, haloalquenilóxi C₂-C₆, alquinilóxi C₂-C₆, haloalquinilóxi C₂-C₆, alcoxialcóxi C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, haloalquilcarbonilóxi C₂-C₆, cicloalquilcarbonilóxi C₄-C₈, alquilcarbonilalcóxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, cicloalquilsulfonila C₃-C₈, alquilsilila C₃-C₁₀, alquilsulfonilamino C₁-C₆, haloalquilsulfonilamino C₁-C₆ ou -Z²Q;

- cada Q é independentemente fenila, benzila, naftalenila, um anel heteroaromático com cinco ou seis membros ou um sistema de anéis bicíclicos heteroaromáticos com oito a onze membros, cada qual opcionalmente substituído com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁷ sobre membros de anéis de átomos de carbono e R¹² sobre membros de anéis de átomos de nitrogênio; ou

- cada Q é independentemente um anel carbocíclico não aromático com três a sete membros, um anel heterocíclico não aromático com cinco, seis ou sete membros ou um sistema de anéis bicíclicos não aromáticos

com oito a onze membros, cada qual incluindo opcionalmente membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), S(O), S(O)₂ e SiR¹⁷R¹⁸, opcionalmente substituídos com um a cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R⁷ sobre membros de anéis de

5 átomos de carbono e R¹² sobre membros de anéis de átomos de nitrogênio;

- cada R⁷ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;

10 ou

- R⁵ e R⁷ são tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído que contém como membros de anéis dois a sete átomos de

20 carbono e, opcionalmente, um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S, até 1 Si e até 1 N; e

- R¹² é alquila C₁-C₃;

- cada Z¹ e Z² é independentemente uma união direta, O, C(=O), S(O)_m, CHR²⁰ ou NR²¹;

25 - cada Z⁴ é independentemente O, C(=O), S(O)_m ou CHR²⁰;

- cada R²⁰ é independentemente H, alquila C₁-C₄ ou haloalquila C₁-C₄;

- cada R²¹ é independentemente H, alquila C₁-C₆, haloalquila

C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆,
alcoxicarbonila C₂-C₆ ou haloalcoxicarbonila C₂-C₆;

- cada m é independentemente 0, 1 ou 2; e
- n é 0, 1 ou 2;

5 desde que:

- quando R¹ for tienila não substituído, X for X¹ e o anel que contém X for saturado, G for um anel tiazol não substituído conectado na sua posição 2 a X e na sua posição 4 a Z¹ na Fórmula 1, A for CHR¹⁵, R¹⁵ for H e J for um anel isoxazol conectado na sua posição 4 a Z¹, substituído na sua
10 posição 5 com metila e na sua posição 3 com fenila meta-substituído, Z¹ é O, C(=O), S(O)_m, CHR²⁰ ou NR²¹.

15. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 14, em que:

- G é um anel heteroaromático com cinco membros ou um anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado com cinco membros, em
15 que cada anel é opcionalmente substituído com até dois substituintes selecionados a partir de R³ sobre membros de anéis de carbono e selecionado a partir de R¹¹ sobre membros de anéis de nitrogênio;

- R¹ é fenila ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituído com um a dois substituintes selecionados
20 independentemente a partir de R^{4a} sobre membros de anéis de carbono e R^{4b} sobre membros de anéis de nitrogênio;

- cada R² é independentemente alquila C₁-C₂, haloalquila C₁-C₂, alcóxi C₁-C₂, halogênio, ciano ou hidróxi;

- cada R³ é independentemente alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃ ou halogênio;
25

- cada R^{4a} é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆,

- haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈,
 5 cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;
 - cada R^{4b} é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆,
 10 haloalquinila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆ ou alcoxialquila C₂-C₄;
 - cada R¹¹ é independentemente alquila C₁-C₃;
 - R¹⁵ é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄ ou alcoxicarbonila C₂-C₅;
 - R¹⁶ é H, alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, haloalquilcarbonila C₂-C₄ ou alcoxicarbonila C₂-C₄;
 15 - quando R⁵ e R⁷ forem tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros opcionalmente substituído, R⁵ e R⁷ são tomados em conjunto com os átomos que ligam R⁵ e R⁷ para formar um anel com cinco a sete membros que contém
 20 como membros de anéis dois a sete átomos de carbono e opcionalmente um a três heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S, até 1 Si e até 1 N, em que o anel é opcionalmente substituído sobre membros de anéis diferentes dos átomos que ligam R⁵ e R⁷ com até quatro substituintes selecionados a partir de R⁸;
 25 - cada R⁸ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano,

nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₆, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆; e

- cada Z⁴ é independentemente C(=O) ou S(O)₂.

16. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, selecionado a partir do grupo que consiste de:

- 4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]piperidina e seu enantiômero;
- 1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-[4-(5-fenil-3-isoxazolil)-2-tiazolil]piperidina;
- 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-metil-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;
- 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(3*aS*, 9*bR*),3*a*,4,5,9*b*-tetraidronaft[2,1-*d'*]isoxazol-3-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero;
- 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-etil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;
- 2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero;
- 1-[4-[4-[(5*R*)-3',4'-di-hidrospiro[isoxazol-5 (4*H*),1',(2'*H*)-naftalen]-3-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;
- 1-[4-[4-[(5*R*)-2,3-di-hidrospiro[1*H*-indeno-1,5'(4'*H*)-isoxazol]-

3'-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;

- 2-[5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero;

5 - 2-[(5*R*)-4,5-di-hidro-3-[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil-5-isoxazolil]-1*H*-isoindol-1,3 (2*H*)-diona e seu enantiômero;

- 2-[5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(1*R*)-2,3-di-hidrospiro[1*H*-indeno-1,5'(4'*H*)-isoxazol]-3'-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero;

- 2-[5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(1'*R*)-3',4'-di-hidrospiro[isoxazol-5(4*H*),1'(2'*H*)-naftalen]-3-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero;

- 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(3*R*)-espiro[benzofuran-3(2*H*),5'(4'*H*)-isoxazol-3'-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero;

- 1-[4-[4-[(1*R*)-2,3-di-hidrospiro[1*H*-indeno-1,5'(4'*H*)-isoxazol]-3'-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-(3,5-dimetil-1*H*-pirazol-1-il)etanona e seu enantiômero;

20 - 2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(1'*R*)-3',4'-di-hidrospiro[isoxazol-5(4*H*),1'(2'*H*)-naftalen]-3-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero;

- 2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(1*R*)-2,3-di-hidrospiro[1*H*-indeno-1,5'(4'*H*)-isoxazol]-3'-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero;

25 - 1-[4-[4-[(5*R*)-5-(2,6-diclorofenil)-4,5-di-hidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;

- 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-[2-(trifluorometil)fenil]-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;
- 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-(2-metilfenil)-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;
- 1-[4-[4-[(5*R*)-5-(2,6-dimetilfenil)-4,5-di-hidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;
- 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-(2,4,6-trimetilfenil)-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;
- 1-[4-[4-[(1'*R*)-3',4'-di-hidrospiro[isoxazol-5(4*H*),1'(2'*H*)-naftalen]-3-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-(3,5-dimetil-1*H*-pirazol-1-il) etanona e seu enantiômero;
- 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-(2,4,6-trimetoxifenil)-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;
- 3-[(5*R*)-4,5-di-hidro-3-[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil]-5-isoxazolil]-2(3*H*)benzoxazolona e seu enantiômero;
- 1-[4-[4-[(5*R*)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-di-hidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;
- 2-[(5*R*)-4,5-di-hidro-3-[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil]-5-isoxazolil]benzonitrila e seu enantiômero;
- 2-[5-cloro-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-

di-hidro-5-metil-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero;

- 2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]-1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-metil-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona e seu enantiômero;

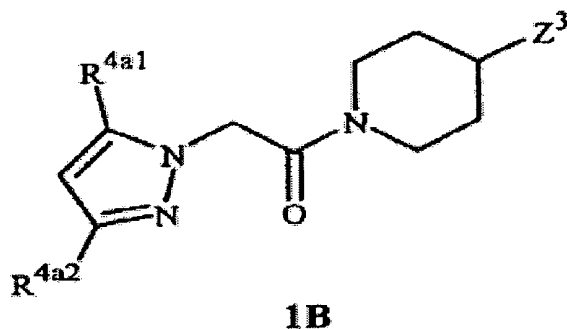
- 1-[4-[4-[(5*R*)-5-(2-clorofenil)-4,5-di-hidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;

- 1-[4-[4-[(5*R*)-4,5-di-hidro-5-fenil-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[3-metil-5-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero;

- 1-[4-[4-[(4*S*)-2,3-di-hidrospiro[4*H*-1-benzopiran-4,5'-(4'*H*)-isoxazol]-3'-il]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona e seu enantiômero; e

- (5*R*)-4,5-di-hidro-3-[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil]-5-fenil-5-isoxazolocarbonitrila e seu enantiômero.

17. COMPOSTO, selecionado a partir da Fórmula 1B, seus *N*-óxidos e sais:



em que:

- cada R^{4a1} e R^{4a2} é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila

C₂-C₃, haloalquinila C₂-C₃, halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₂, haloalcóxi C₁-C₂, alquiltio C₁-C₂, haloalquiltio C₁-C₂, alcoialquila C₂-C₃, alquilcarbonila C₂-C₃, alcóxicarbonila C₂-C₃, alquilaminocarbonila C₂-C₃ ou dialquilaminocarbonila C₃-C₄;

5 - Z³ é CN ou C(=S)NH₂.

18. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 17, em que cada R^{4a1} e R^{4a2} é independentemente alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, halogênio, ciano, alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂.

10 19. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 17, selecionado a partir do grupo que consiste de:

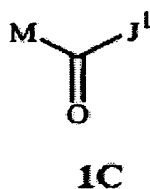
- 1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbotioamida;

- 1-[2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbotioamida;

15 - 1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbonitrila; e

- 1-[2-[3,5-bis(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinocarbonitrila.

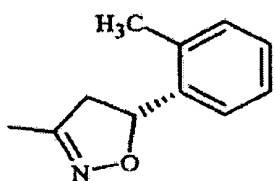
20 20. COMPOSTO, selecionado a partir da Fórmula 1C, seus *N*-óxidos e sais:



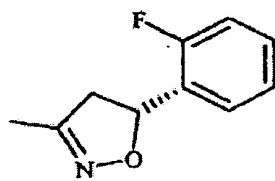
em que:

- M é alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, hidróxi, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₂, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, 1-piperidinila, 1-pirrolidinila ou 4-morfolinila; e

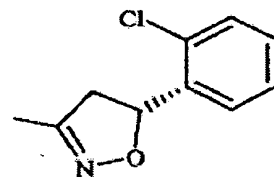
25

J¹ é:

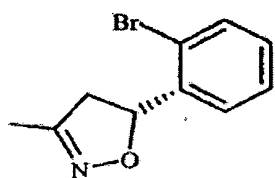
J-29-1



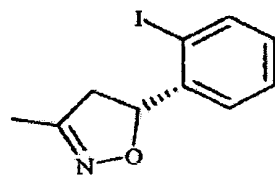
J-29-2



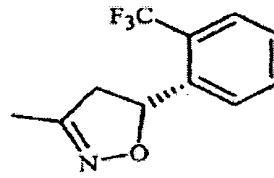
J-29-3



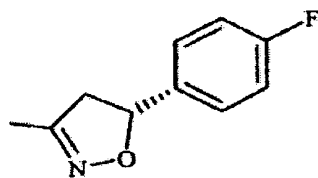
J-29-4



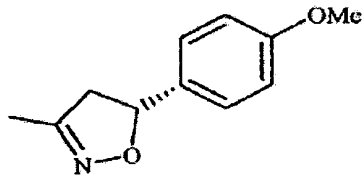
J-29-5



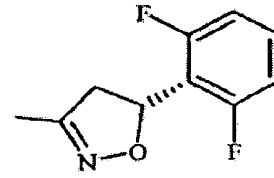
J-29-6



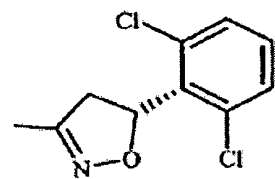
J-29-7



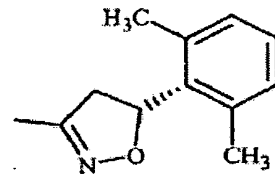
J-29-8



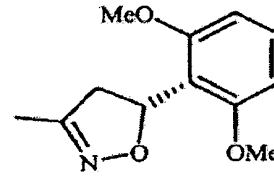
J-29-9



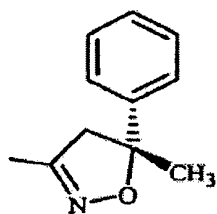
J-29-10



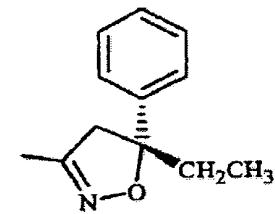
J-29-11



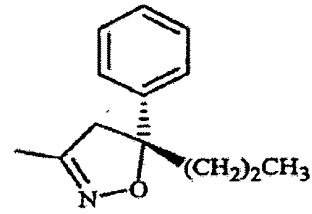
J-29-12



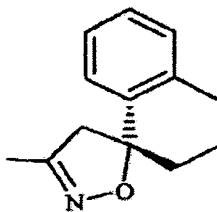
J-29-13



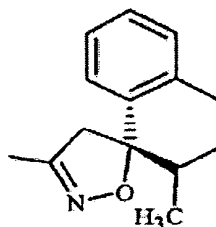
J-29-14



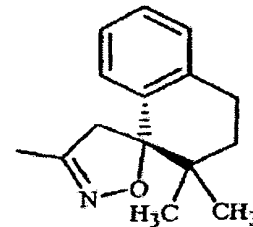
J-29-15



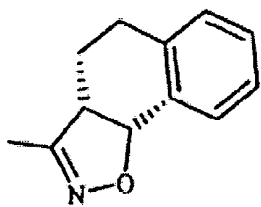
J-29-16



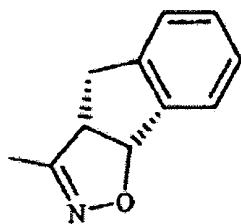
J-29-17



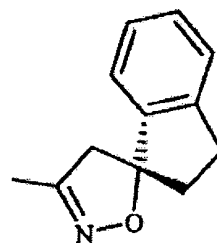
J-29-18



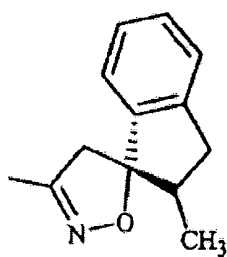
J-29-19



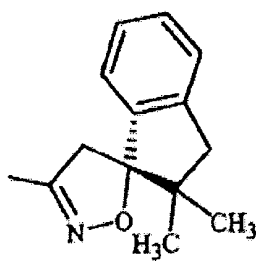
J-29-20



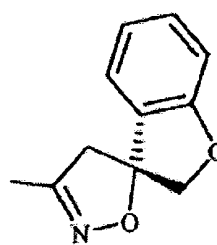
J-29-21



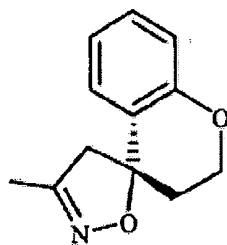
J-29-22



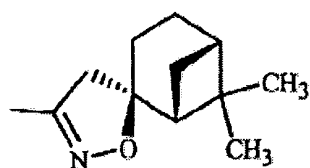
J-29-23



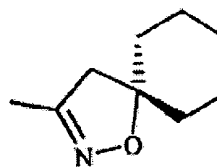
J-29-24



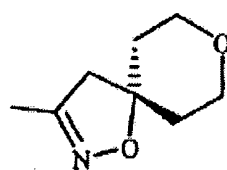
J-29-25



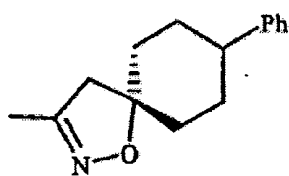
J-29-26



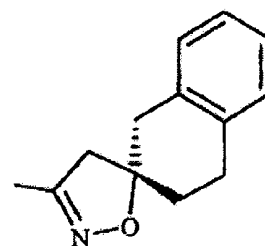
J-29-27



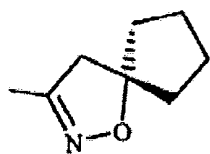
J-29-28



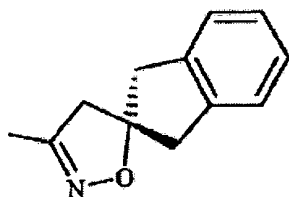
J-29-29



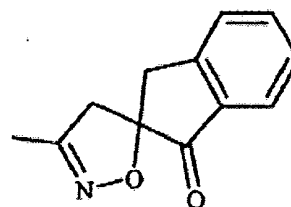
J-29-30



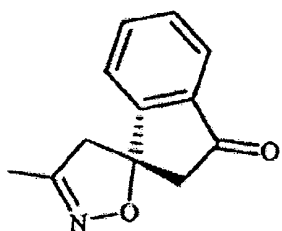
J-29-31



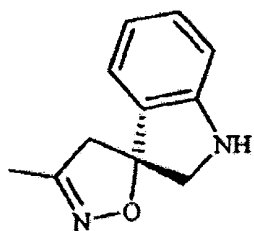
J-29-32



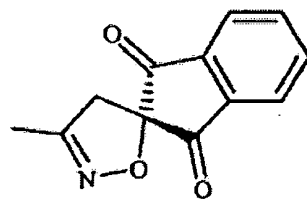
J-29-33



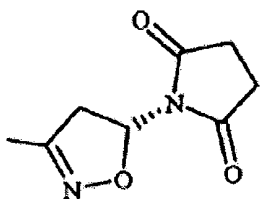
J-29-34



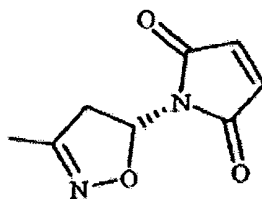
J-29-35



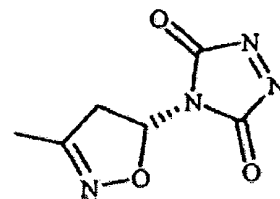
J-29-36



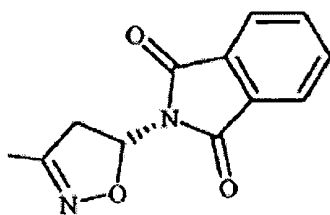
J-29-37



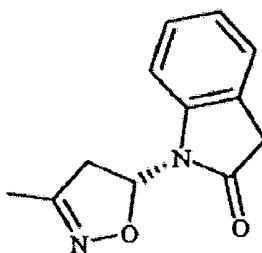
J-29-38



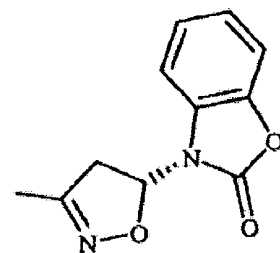
J-29-39



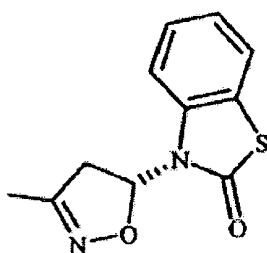
J-29-40



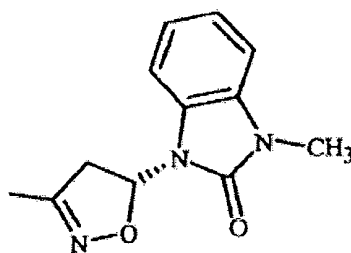
J-29-41



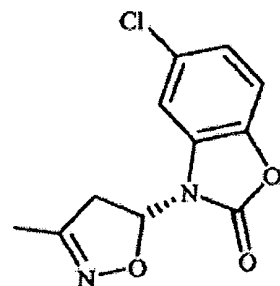
J-29-42



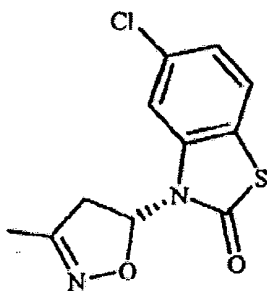
J-29-43



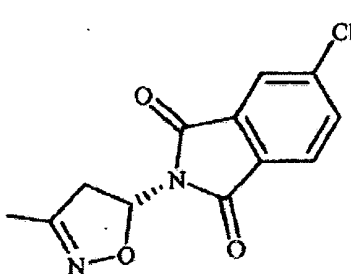
J-29-44



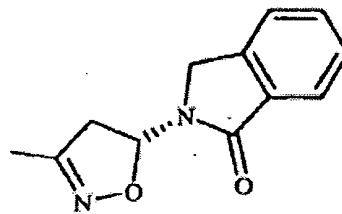
J-29-45



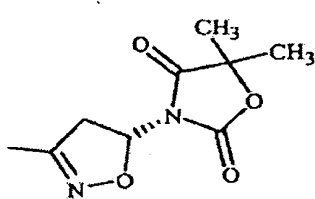
J-29-46



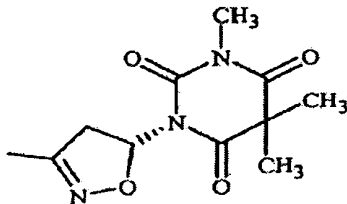
J-29-47



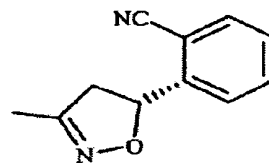
J-29-48



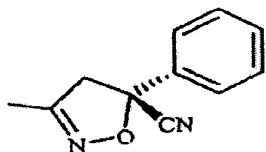
J-29-49



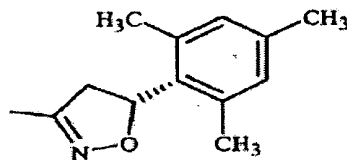
J-29-50



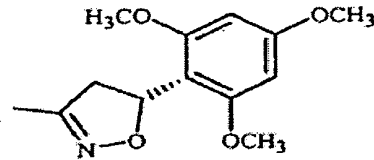
J-29-51



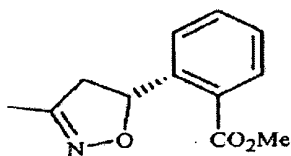
J-29-52



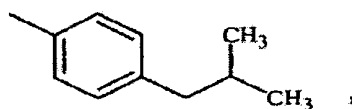
J-29-53



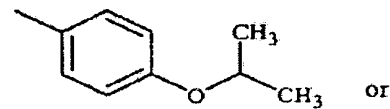
J-29-54



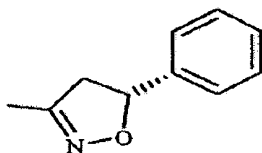
J-29-55



J-29-56 ,



J-29-57



J-29-58

21. MÉTODO DE CONTROLE DE DOENÇAS DE PLANTAS,

causadas por patógenos vegetais fúngicos Oomycete que compreende a aplicação à planta ou parte dela, ou à semente da planta, de uma quantidade eficaz como fungicida de um composto selecionado a partir do grupo que consiste dos compostos de acordo com a reivindicação 1, compostos dentro do escopo de exclusão da ressalva (a) da reivindicação 1, compostos dentro do escopo de exclusão da ressalva (b) da reivindicação 1 e compostos dentro do escopo de exclusão da ressalva (c) da reivindicação 1.

22. COMPOSIÇÃO FUNGICIDA, que compreende (1) um

composto selecionado a partir do grupo que consiste dos compostos de acordo com a reivindicação 1, compostos dentro do escopo de exclusão da ressalva (a) da reivindicação 1, compostos dentro do escopo de exclusão da ressalva

(b) da reivindicação 1 e compostos dentro do escopo de exclusão da ressalva (c) da reivindicação 1; e (2) pelo menos um outro fungicida.

23. COMPOSIÇÃO FUNGICIDA, que compreende (1) uma quantidade eficaz como fungicida de um composto selecionado a partir do grupo que consiste dos compostos de acordo com a reivindicação 1, compostos dentro do escopo de exclusão da ressalva (a) da reivindicação 1, compostos dentro do escopo de exclusão da ressalva (b) da reivindicação 1 e compostos dentro do escopo de exclusão da ressalva (c) da reivindicação 1; e (2) pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos.

RESUMO**“COMPOSTOS, MÉTODO DE CONTROLE DE DOENÇAS DE PLANTAS E
COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS”**

São descritos compostos das Fórmulas 1, 1A, 1B e 1C que
5 incluem todos os seus isômeros geométricos, estereoisômeros, *N*-óxidos e
sais, em que R^1 , R^2 , R^{4a1} , R^{4a2} , A, A^a , G, M, W, Z^1 , Z^3 , X, J, J^1 e n são conforme
definido no relatório descritivo. Também são descritas composições que
contêm os compostos da Fórmula 1 e métodos de controle de doenças das
plantas causadas por patógenos fúngicos, que compreendem a aplicação de
10 uma quantidade eficaz de um composto ou composição de acordo com a
presente invenção.