



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

(21) PI 0808241-3 A2



(22) Data de Depósito: 04/04/2008
(43) Data da Publicação: 29/07/2014
(RPI 2273)

(51) Int.Cl.:
A01N 55/00

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

(57) Resumo:

(30) Prioridade Unionista: 03/04/2007 US 60/921,600,
19/12/2007 US 61/008,425

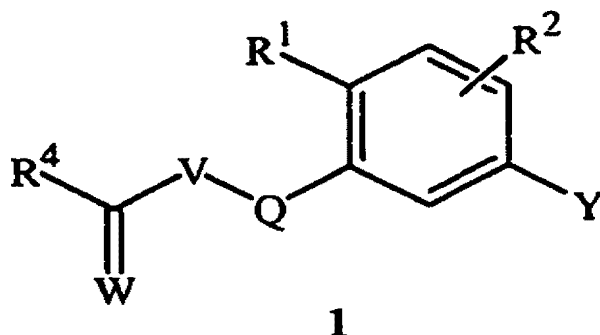
(73) Titular(es): E I Du Pont De Nemours And Company

(72) Inventor(es): CHI-PING TSENG, JEFFREY KEITH LONG,
STEPHEN FREDERICK MCCANN, STEVEN LEWIS SWANN JR,
AMY X DING, ANDREW EDMUND TAGGI, Bruce Lawrence
Finkelstein, PAULA LOUISE SHARPE

(74) Procurador(es): Cristiane Araújo Rodrigues

(86) Pedido Internacional: PCT US2008004443 de
04/04/2008

(87) Publicação Internacional: WO 2008/124092de
16/10/2008



“COMPOSTO, COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS E MÉTODO DE CONTROLE DE DOENÇAS DAS PLANTAS”

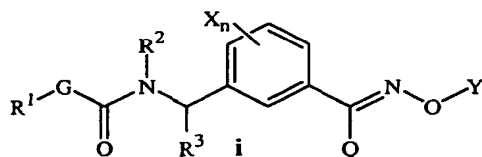
CAMPO DA INVENÇÃO

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

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

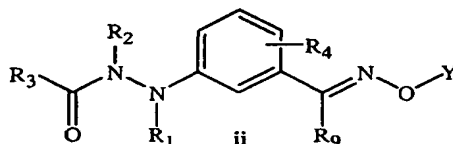
O controle de doenças das plantas causadas por patógenos vegetais
fúngicos é extremamente importante para atingir alta eficiência de produção. Danos
10 por doenças de plantas a safras ornamentais, de legumes, de campo, cereais e
frutas podem causar redução significativa da produtividade e, desta forma, 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
15 mais seguros ou possuam diferentes locais de ação.

A Patente Internacional nº WO 2001/010825 descreve certos
derivados de carbamato da Fórmula i como fungicidas:



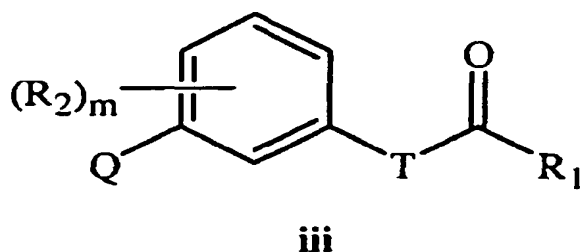
em que, entre outros, R¹ é alquila C₁-C₆; G é O, S ou NR⁴; R² é H
20 ou alquila C₁-C₆; R³ é H ou alquila C₁-C₆; X é halogênio; n é 0 a 4; Q é H ou
alquila C₁-C₆; e Y é alquila C₁-C₁₀.

A Patente Internacional nº WO 2004/037770 descreve certos
derivados de *N*-fenil hidrazina da Fórmula ii como fungicidas e inseticidas:



em que, entre outros, cada R^1 e R^2 é independentemente H ou alquila C_1-C_6 ; R^3 é alquila C_1-C_6 ou alcóxi C_1-C_6 ; R^4 é H ou halogênio; R^9 é H ou alquila C_1-C_6 ; Y é H ou alquila C_1-C_6 .

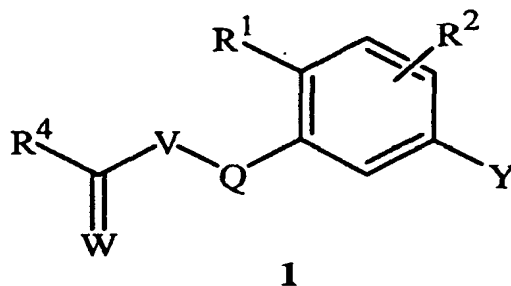
A Patente Internacional nº WO 2005/051932 descreve certos
5 derivados de aril heterociclos da Fórmula iii como fungicidas e inseticidas:



em que, entre outros, R_1 é alquila C_1-C_6 ou alcóxi C_1-C_6 ; R_2 é halogênio; m é 0 a 4; T é uma ponte C-N ou N-N substituída; e Q é um heterociclo N que também contém membros de anéis selecionados a partir de
10 O e S.

DESCRIÇÃO RESUMIDA DA INVENÇÃO

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



em que:

- cada R^1 e R^2 é independentemente H, halogênio, CN, alquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , haloalcóxi C_1-C_3 , cicloalquila C_3-

C₆, trialquilsilila C₃-C₁₅ ou halotrialquilsilila C₃-C₁₅;

- V é uma união direta ou NR³;

- R³ é H, alquila C₁-C₃, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₃,
alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆, alcoxicarbonila C₂-C₆ ou
5 haloalcoxicarbonila C₂-C₆;

- R⁴ é H, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆,
alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₆, alquilamino C₁-C₆,
haloalquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈, halodialquilamino C₂-C₈ ou
cicloalquilamino C₃-C₆;

10 - W é O ou S;

- Q é CR^{6a}R^{6b}, O, NR⁷, C(=N)-O-R⁷ ou C(=O);

- Y é -C(R⁵)=N-O-(CR^{8a}R^{8b})_p-X-(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c},

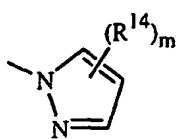
ou Z; ou um anel fenila substituído com um substituinte selecionado a partir
de haloalcóxi C₁-C₅, trialquilsilila C₃-C₁₅, halotrialquilsilila C₃-C₁₅,

15 trialquilsililalquila C₄-C₂₀, trialquilsililalcóxi C₄-C₂₀ e trialquilsililalcoxialquila
C₅-C₂₅ opcionalmente substituído com até quatro substituintes adicionais

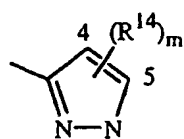
selecionados independentemente a partir de halogênio, CN, alquila C₁-C₃,
alcóxi C₁-C₃, haloalcóxi C₁-C₃, trialquilsilila C₃-C₁₅, halotrialquilsilila C₃-C₁₅,
trialquilsililalquila C₄-C₂₀, trialquilsililalcóxi C₄-C₂₀ e trialquilsililalcoxialquila

20 C₅-C₂₅; desde que, quando Y for um anel fenila, Q seja O, NR⁷, C=N-O-R⁷
ou C(=O);

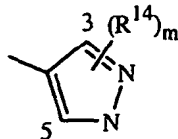
- Z é um anel heteroaromático com cinco ou seis membros
selecionado a partir de Z-1 a Z-24:



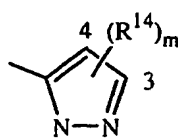
Z-1



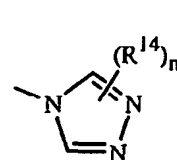
Z-2



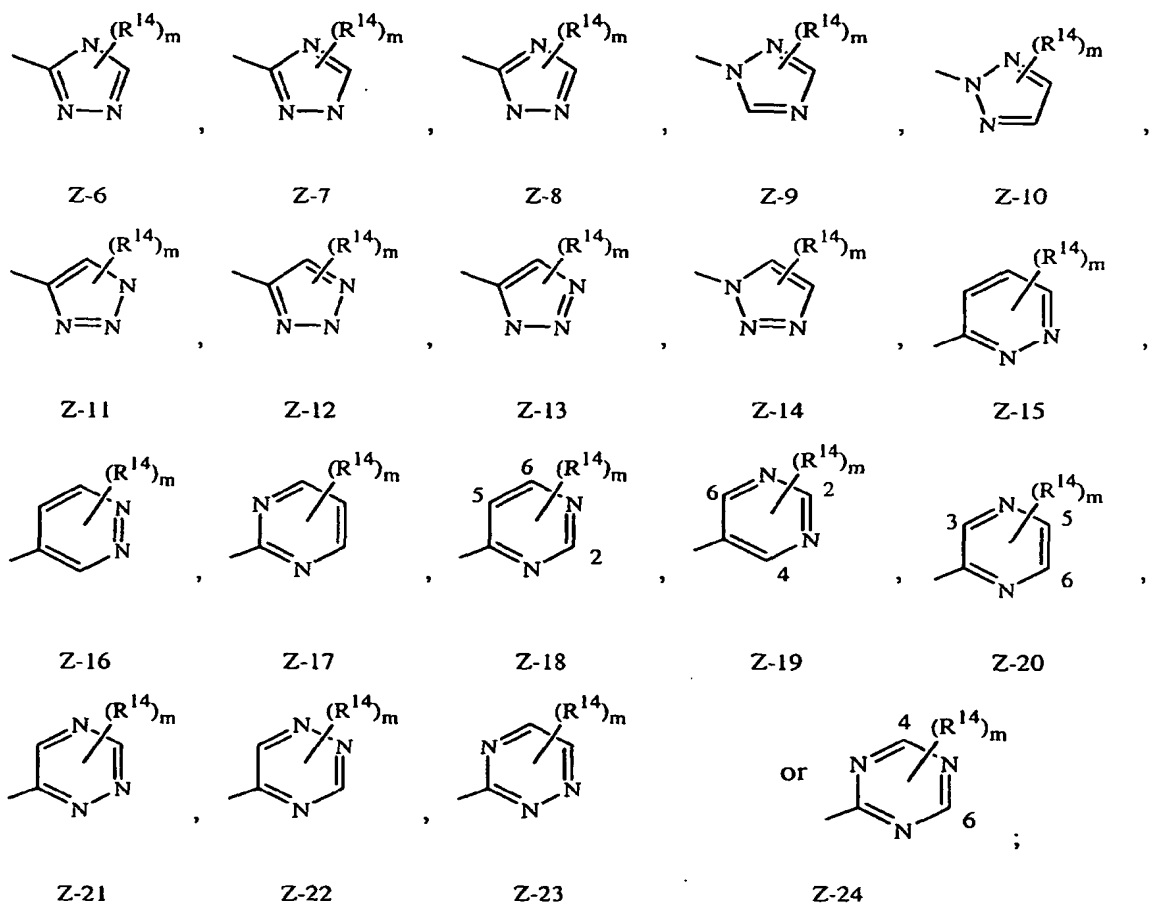
Z-3



Z-4



Z-5



- R^5 é H, CN, alquila C_1 - C_6 , cicloalquila C_3 - C_6 , haloalquila C_1 - C_6 , halocicloalquila C_3 - C_6 , trialquilsilila C_3 - C_{15} ou halotrialquilsilila C_3 - C_{15} ;
- R^{6a} é H, OH, halogênio, CN, alquila C_1 - C_6 , haloalquila C_1 - C_6 , alcoxialquila C_2 - C_6 , alcóxi C_1 - C_6 , haloalcóxi C_1 - C_6 ou alquilsulfonila C_1 - C_6 ;
- R^{6b} é H, alquila C_1 - C_6 , haloalquila C_1 - C_6 , alcoxialquila C_2 - C_6 , alcóxi C_1 - C_6 ou haloalcóxi C_1 - C_6 ; ou
- R^{6a} e R^{6b} são tomados em conjunto com o átomo de carbono ao qual são ligados para formar um anel cicloalquila C_3 - C_6 ou anel halocicloalquila C_3 - C_6 ;
- R^7 é H, alquila C_1 - C_3 , haloalquila C_1 - C_3 , alquilcarbonila C_2 - C_3 ou haloalquilcarbonila C_2 - C_3 ;
- cada R^8 e R^{9a} é independentemente H, OH, CN, halogênio, alquila C_1 - C_5 , haloalquila C_1 - C_5 ou alcóxi C_1 - C_5 ;

- cada R^{8b} e R^{9b} é independentemente H, CN, halogênio, alquila C_1-C_5 , haloalquila C_1-C_5 ou alcóxi C_1-C_5 ; ou

- cada par de R^{8a} e R^{8b} ou R^{9a} e R^{9b} ligados ao mesmo átomo de carbono pode ser tomado independentemente junto com o átomo de carbono ao qual são ligados para formar um anel cicloalquila C_3-C_6 ou halocicloalquila C_3-C_6 ; ou

- cada R^{8a} , R^{8b} , R^{9a} ou R^{9b} pode ser tomado independentemente junto com um R^{8a} , R^{8b} , R^{9a} ou R^{9b} ligado a um átomo de carbono adjacente e os átomos de carbono aos quais são ligados para formar um anel cicloalquila C_3-C_6 ou halocicloalquila C_3-C_6 ;

- cada R^{10a} , R^{10b} e R^{10c} é independentemente alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , alcóxialquila C_2-C_8 , haloalcóxialquila C_2-C_8 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , alquilcicloalquila C_4-C_7 , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquenila C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquilcarbonila C_2-C_6 , alcóxicarbonila C_2-C_6 , trialquilsililalquila C_4-C_{12} ou J;

- cada J é independentemente um anel fenila; um anel heteroaromático com cinco ou seis membros; ou um sistema de anéis bicíclicos fundidos com oito, nove ou dez membros, ou um anel carbocíclico ou heterocíclico não aromático com três a seis membros, em que o mencionado anel ou sistema de anéis inclui opcionalmente membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de $C(=O)$, $C(=S)$, $C(=NR^{11})$, NR^{11} , $SiR^{12a}R^{12b}$ e $S(=O)_u(=NR^{11})_z$ e cada anel ou sistema de anéis opcionalmente substituído com até cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R^{13} ; ou

- dois dentre R^{10a} , R^{10b} ou R^{10c} são tomados junto com o átomo de silício ao qual são ligados para formar um anel saturado que contém de três a seis átomos de carbono além do átomo de silício como membros de anéis, em que o anel é opcionalmente substituído sobre átomos de carbono

com halogênio;

- X é uma união direta, O, NR^{11} , $\text{C}(=\text{O})$, $\text{C}(=\text{S})$ ou $\text{C}(=\text{NR}^{11})$; ou um anel fenila, um anel heteroaromático com cinco ou seis membros ou um anel carbocíclico ou heterocíclico não aromático com três a oito membros, em
- 5 que o mencionado anel inclui opcionalmente membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de $\text{C}(=\text{O})$, $\text{C}(=\text{S})$, $\text{C}(=\text{NR}^{11})$, NR^{11} , $\text{SiR}^{12a}\text{R}^{12b}$ e $\text{S}(=\text{O})_u(=\text{NR}^{11})_z$, opcionalmente substituído com até cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R^{13} ;
- cada R^{11} é independentemente H, CN, NH_2 , OH, alquila C_1 -
- 10 C_6 , cicloalquila C_3 - C_8 , alquilcarbonila C_2 - C_6 , haloalquilcarbonila C_2 - C_6 ou alcóxi C_1 - C_6 ;
- cada R^{12a} e R^{12b} é independentemente alquila C_1 - C_5 , alquenila C_2 - C_5 , alquinila C_2 - C_5 , cicloalquila C_3 - C_8 , halocicloalquila C_3 - C_6 , cicloalquilalquila C_4 - C_{10} , alquilcicloalquila C_4 - C_7 , alquilcicloalquilalquila C_5 - C_8 ,
- 15 haloalquila C_1 - C_5 , alcóxi C_1 - C_5 ou haloalcóxi C_1 - C_5 ;
- cada R^{13} é independentemente halogênio, alquila C_1 - C_6 , alquenila C_2 - C_6 , alquinila C_2 - C_6 , cicloalquila C_3 - C_6 , halocicloalquila C_3 - C_6 , alquilcicloalquila C_4 - C_7 , haloalquila C_1 - C_6 , haloalquenila C_2 - C_6 , ciano, nitro, alcóxi C_1 - C_6 , haloalcóxi C_1 - C_6 , alquiltio C_1 - C_6 , alquilsulfonila C_1 - C_6 ,
- 20 alquilsulfonila C_1 - C_6 , haloalquiltio C_1 - C_6 , haloalquilsulfonila C_1 - C_6 , haloalquilsulfonila C_1 - C_6 , alquilamino C_1 - C_6 , dialquilamino C_2 - C_6 , alquilcarbonila C_2 - C_6 , alcoxicarbonila C_2 - C_6 , alquilaminocarbonila C_2 - C_6 , dialquilaminocarbonila C_3 - C_6 , trialquilsilila C_3 - C_{15} ou halotrialquilsilila C_3 - C_{15} ;
- cada R^{14} é independentemente H, halogênio, ciano, hidróxi,
- 25 amino, nitro, $-\text{CH}(=\text{O})$ ou $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$; ou alquila C_1 - C_6 , cicloalquila C_3 - C_8 , halocicloalquila C_3 - C_6 , alquenila C_2 - C_6 , alquinila C_2 - C_6 , haloalquila C_1 - C_6 , alquilcarbonila C_2 - C_8 , alcoxicarbonila C_2 - C_8 , alquilaminocarbonila C_2 - C_8 , dialquilaminocarbonila C_3 - C_{10} , alcóxi C_1 - C_6 , haloalcóxi C_1 - C_6 , cicloalcóxi C_3 - C_8 ,

halocicloalcóxi C₃-C₈, alquilcarbonilóxi C₂-C₈, cicloalquilcarbonilóxi C₄-C₁₀,
 alquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆,
 cicloalquilsulfonila C₃-C₈, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈,
 cicloalquilamino C₃-C₈, alquilcarbonilamino C₂-C₈, alquilsulfonilamino C₁-C₆,
 5 alquilaminossulfonila C₁-C₆, dialquilaminossulfonila C₂-C₈, naftalenila ou G^A,
 cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes
 selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio,
 ciano, hidróxi, amino, nitro, -CH(=O), -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, -C(R¹⁵)=N-O-R¹⁶,
 -C(R¹⁵)=N-R¹⁶, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆,
 10 haloalquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₈, haloalquilcarbonila C₂-C₈,
 cicloalquilcarbonila C₄-C₁₀, alcoxicarbonila C₂-C₈, cicloalcoxicarbonila C₄-C₁₀,
 alquilaminocarbonila C₂-C₈, dialquilaminocarbonila C₃-C₁₀,
 cicloalquilaminocarbonila C₄-C₁₀, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-
 C₈, halocicloalcóxi C₃-C₈, cicloalquilalcóxi C₄-C₁₀, alquenilóxi C₂-C₆,
 15 haloalquenilóxi C₂-C₆, alquinilóxi C₂-C₆, haloalquinilóxi C₃-C₆, alcoxialcóxi C₂-
 C₈, alquilcarbonilóxi C₂-C₈, haloalquilcarbonilóxi C₂-C₈, cicloalquilcarbonilóxi C₄-
 C₁₀, alquiltio C₁-C₆, benziltio, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈,
 alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆,
 haloalquilsulfonila C₁-C₆, cicloalquilsulfonila C₃-C₈, trialquilsilila C₃-C₁₀,
 20 alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈, haloalquilamino C₁-C₆,
 halodialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₈, alquilcarbonilamino C₂-C₈,
 haloalquilcarbonilamino C₂-C₈, alquilsulfonilamino C₁-C₆, haloalquilsulfonilamino
 C₁-C₆ e G^B;

- G^A é independentemente um anel fenila, benzila, benzilóxi,
 25 benzoíla, fenóxi ou fenilsulfonila ou um anel heteroaromático com cinco ou seis
 membros;

- cada G^B é independentemente um anel fenila ou um anel
 heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituído com

um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alquilocicloalquila C₄-C₇, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ e alquiltio C₁-C₆;

- cada R¹⁵ é H, alquila C₁-C₃, cicloalquila C₃-C₈ ou haloalquila C₁-C₃;

- cada R¹⁶ é H, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, alquilcarbonila C₂-C₃ ou haloalquilcarbonila C₂-C₃;

- m é um número inteiro de 1 a 3;

- p e q são independentemente um número inteiro de 0 a 5; desde que, quando p for 0, X seja diferente de O ou NR¹¹; e

- u e z em cada caso de S(=O)_u(=NR¹¹)_z são independentemente 0, 1 ou 2, desde que a soma de u e z em cada caso de S(=O)_u(=NR¹¹)_z seja 0, 1 ou 2.

Mais especificamente, a presente invenção refere-se a um composto da Fórmula 1, incluindo todos os seus isômeros geométricos e estereoisômeros, *N*-óxidos ou sais.

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

A presente invenção também se refere a uma composição fungicida que compreende (a) um composto de acordo com a presente invenção e (b) pelo menos um outro fungicida (tal como pelo menos um outro fungicida que possui um local de ação idêntico ou diferente).

A presente invenção refere-se ainda a um método de controle de

doenças de plantas causadas por patógenos vegetais fúngicos que compreende a aplicação à planta ou parte dela, ou à semente de planta, de uma quantidade eficaz como fungicida de um composto de acordo com a presente invenção (tal como na forma de uma composição descrita no presente).

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, os artigos indefinidos “um” e “uma” antes de um elemento ou componente de acordo com a presente invenção destinam-se a ser não restritivos com relação ao número de casos (ou seja, ocorrências) do elemento ou componente. “Um” ou “uma” deverão ser lidos, portanto, como incluindo um ou pelo menos um e a forma da palavra no singular do elemento ou componente também inclui o plural, a menos que seja óbvio que o número indica o singular.

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 crescem tipicamente abaixo da superfície do meio de crescimento (tal como 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.

Da forma indicada no presente, o termo “muda”, utilizado isoladamente ou em uma combinação de palavras, indica uma planta jovem em desenvolvimento a partir do embrião de uma semente.

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 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-hexadi-inila. “Alquilenio” indica alcanodi-ila de cadeia linear ou ramificado. Exemplos de “alquilenio” 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.

“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 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$. “Alcoxialcóxi” indica substituição alcóxi de cadeia linear ou

ramificada sobre um alcóxi de cadeia linear ou ramificado. Exemplos de “alcoxialcóxi” incluem $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{O}-$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2(\text{CH}_3\text{O})\text{CHCH}_2\text{O}-$ e $(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$. “Alquenilóxi” inclui porções alquenilóxi de cadeia linear ou ramificadas. Exemplos de “alquenilóxi” incluem $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$,
 5 $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ e $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. “Alquinilóxi” inclui porções alquinilóxi de cadeia linear ou ramificadas. Exemplos de “alquinilóxi” incluem $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ e $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$.

“Alquiltio” inclui porções alquiltio de cadeia linear ou ramificada
 10 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, pentilsulfinila e hexilsulfinila. Exemplos de “alquilsulfonila” incluem $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$,
 15 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ e os diferentes isômeros de butilsulfonila, pentilsulfonila e hexilsulfonila. “Alquilamino”, “dialquilamino” e similares são definidos de forma análoga aos exemplos acima.

“Trialkilsilila” inclui três radicais alkila de cadeia linear e/ou ramificada conectados e ligados por meio de um átomo de silício, tais como
 20 trimetilsilila, trietilsilila e *terc*-butildimetilsilila.

“Cicloalkila” inclui, por exemplo, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila e ciclo-hexila. O termo “alkilcicloalkila” indica substituição alkila sobre uma porção cicloalkila e inclui, por exemplo, etilciclopropila, *i*-propilciclobutila, 3-metilciclopentila e 4-metilciclo-hexila. O termo
 25 “cicloalkilalkila” indica substituição cicloalkila sobre uma porção alkila. Exemplos de “cicloalkilalkila” incluem ciclopropilmetila, ciclopentiletila e outras porções cicloalkila unidas a grupos alkila ramificados ou de cadeia linear.

O termo “cicloalcóxi” indica cicloalquila ligado por meio de um átomo de oxigênio tal como ciclopentilóxi e ciclo-hexilóxi. “Cicloalquilalcóxi” indica cicloalquilalquila ligado por meio de um átomo de oxigênio. Exemplos de “cicloalquilalcóxi” incluem ciclopropilmetóxi, ciclopentiletóxi e outras porções cicloalquila unidas a grupos alcóxi de cadeia linear ou ramificados.

“Alquilcarbonila” indica uma porção alquila ramificada ou de cadeia linear unida a uma porção $C(=O)$. Exemplos de “alquilcarbonila” incluem $CH_3C(=O)-$, $CH_3CH_2CH_2C(=O)-$ e $(CH_3)_2CHC(=O)-$. Exemplos de “alcoxicarbonila” incluem $CH_3OC(=O)-$, $CH_3CH_2OC(=O)-$, $CH_3CH_2CH_2OC(=O)-$, $(CH_3)_2CHOC(=O)-$ e os diferentes isômeros de butóxi ou pentoxicarbonila. Exemplos de alquilaminocarbonila incluem $CH_3NHC(=O)-$, $CH_3CH_2NHC(=O)-$, $CH_3CH_2CH_2NHC(=O)-$, $(CH_3)_2CHNHC(=O)-$ e os diferentes isômeros de butilamino ou pentilaminocarbonila. Exemplos de “dialquilaminocarbonila” incluem $(CH_3)_2NC(=O)-$, $(CH_3CH_2)_2NC(=O)-$, $CH_3CH_2(CH_3)NC(=O)-$, $(CH_3)_2CHN(CH_3)C(=O)-$ e $CH_3CH_2CH_2(CH_3)NC(=O)-$.

“Cicloalquilamino” indica cicloalquila ligado por meio de um grupo amina, tal como ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopentilamino e ciclo-hexilamino.

O termo “halogênio”, isoladamente ou em palavras compostas tais como “haloalquila”, ou quando utilizado em descrições tais como “alquila substituído com halogênio”, inclui flúor, cloro, bromo ou iodo. Além disso, quando utilizado em palavras compostas tais como “haloalquila”, ou quando utilizado em descrições tais como “alquila substituído com halogênio”, o mencionado alquila pode ser total ou parcialmente substituído com átomos de halogênio que podem ser idênticos ou diferentes. Exemplos de “haloalquila” ou “alquila substituído com halogênio” incluem F_3C- , $ClCH_2$, CF_3CH_2- e CF_3CCl_2- . Os termos “halocicloalquila”, “haloalcóxi”, “haloalquiltio”, “haloalquenila”, “haloalquenilóxi”, “haloalquinilóxi” e similares são definidos de forma análoga

ao termo “haloalquila”. Exemplos de “haloalcóxi” incluem $\text{CF}_3\text{O}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ e $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$. Exemplos de “haloalquiltio” incluem $\text{CCl}_3\text{S}-$, $\text{CF}_3\text{S}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ e $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$. Exemplos de “haloalquilsulfinila” incluem $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ e $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})-$. Exemplos de

5 “haloalquilsulfonila” incluem $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ e $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2-$. Exemplos de “haloalquenila” incluem $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$ e $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$. Exemplos de “halodialquilamino” incluem $\text{CF}_3(\text{CH}_3)\text{N}-$, $(\text{CF}_3)_2\text{N}-$ e $\text{CH}_2\text{Cl}(\text{CH}_3)\text{N}$. Exemplos de “halotrialquilsilila” incluem $\text{CF}_3(\text{CH}_3)_2\text{Si}-$, $(\text{CF}_3)_3\text{Si}-$ e $\text{CH}_2\text{Cl}(\text{CH}_3)_2\text{Si}-$.

10 A abreviação “CN” indica ciano.

O número total de átomos de carbono em um grupo substituinte é indicado pelo sufixo “C_i-C_j” em que i e j são números de 1 a 25. Alquilsulfonila C₁-C₄ designa, por exemplo, metilsulfonila até butilsulfonila; alcoxialquila C₂ designa CH_3OCH_2- ; alcoxialquila C₃ designa, por exemplo, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$,

15 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ ou $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$; e alcoxialquila C₄ 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 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ e $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$.

Quando um composto for substituído com um substituinte que

20 contém um subscrito que indica que a quantidade dos mencionados substituintes pode exceder 1, os mencionados substituintes (quando excederem 1) são selecionados independentemente a partir do grupo de substituintes definidos, tais como $-(\text{CR}^{\text{8a}}\text{R}^{\text{8b}})_p-$, em que p é 1, 2, 3, 4 ou 5. Além disso, quando o subscrito indicar uma faixa, tal como $(\text{R})_{i-j}$, o número de

25 substituintes pode ser selecionado a partir dos números inteiros de i a j, inclusive. Quando se afirmar que uma ou mais posições sobre um grupo são “não substituídas”, os átomos de hidrogênio são ligados para absorver qualquer valência livre.

A menos que indicado em contrário, um “anel” ou “sistema de anéis” como um componente da Fórmula 1 (tal como tal como substituinte J) é carbocíclico ou heterocíclico. A expressão “sistema de anéis” indica dois ou mais anéis fundidos. As expressões “sistema de anéis bicíclicos” e “sistema de anéis bicíclicos fundidos” indicam um sistema de anéis que consiste de dois anéis fundidos, em que cada anel pode ser saturado, parcialmente insaturado ou totalmente insaturado, a menos que indicado em contrário. 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.

As expressões “anel carbocíclico”, “carbociclo” ou “sistema de anéis carbocíclicos” indicam um anel ou sistema de anéis em que os átomos que formam a cadeia principal de anel são selecionados apenas a partir de carbono. A menos que indicado em contrário, um anel carbocíclico pode ser um anel saturado, parcialmente saturado ou totalmente insaturado. Quando um anel carbocíclico totalmente insaturado satisfizer a lei de Hückel, o mencionado anel também é denominado um “anel aromático”. “Carbocíclico saturado” indica um anel que contém uma estrutura que consiste de átomos de carbono ligados entre si por uniões duplas; a menos que especificado em contrário, as valências de carbono remanescentes são ocupadas por átomos de hidrogênio.

As expressões “anel heterocíclico”, “heterociclo” ou “sistema de anéis heterocíclicos” indicam um anel ou sistema de anéis em que pelo menos um átomo que forma a cadeia principal de anel não é carbono, tal como nitrogênio, oxigênio ou enxofre. Tipicamente, um anel heterocíclico contém não mais de quatro nitrogênios, não mais de dois oxigênios e não mais de dois enxofres. A menos que indicado em contrário, um anel heterocíclico pode ser um anel saturado, parcialmente insaturado ou totalmente insaturado. Quando um anel heterocíclico totalmente insaturado satisfizer a lei de Hückel, o

mencionado anel também é denominado “anel heteroaromático” ou “anel heterocíclico aromático”. A menos que indicado em contrário, anéis heterocíclicos e sistemas de anéis podem ser ligados por meio de qualquer carbono ou nitrogênio disponível por meio de substituição de um hidrogênio sobre o mencionado carbono ou nitrogênio.

“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 “sistema de anéis aromáticos” indica um sistema de anéis heterocíclicos ou carbocíclicos em que pelo menos um anel do sistema de anéis é aromático. A expressão “sistema de anéis carbocíclicos aromáticos” indica um sistema de anéis heterocíclicos em que pelo menos um anel do sistema de anéis é aromático. A expressão “sistema de anéis heterocíclicos aromáticos” indica um sistema de anéis heterocíclicos em que pelo menos um anel do sistema de anéis é aromático. A expressão “sistema de anéis não aromáticos” indica um sistema de anéis carbocíclicos ou heterocíclicos que pode ser totalmente saturado, bem como parcial ou totalmente insaturado, desde que nenhum dos anéis no sistema de anéis seja aromático.

A expressão “opcionalmente substituído”, com relação a R^{10a} , R^{10b} , R^{10c} , R^{14} , G^B , J e X , designa grupos que não são substituídos ou que contêm pelo menos um substituinte não de hidrogênio que não elimina a atividade biológica apresentada pelo análogo não substituído. Da forma utilizada no presente, as definições a seguir serão aplicáveis, a menos que indicado em contrário. A expressão “opcionalmente substituído” é utilizada de forma intercambiável com a expressão “substituído ou não substituído” ou com a expressão “(não) substituído”. A menos que indicado em contrário, um grupo opcionalmente substituído pode possuir um substituinte em cada posição

substituível do grupo e as substituições são independentes entre si. 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 r é um número inteiro de 0 a 4 na Ilustração 1) exceder o número de

5 posições disponíveis para substituintes em um anel (tal como uma posição disponível para $(R^v)_r$ em U-29 na Ilustração 3), a extremidade superior real da faixa é reconhecida como sendo o número de posições disponíveis. A expressão “opcionalmente substituído” indica que o número de substituintes pode ser zero. A expressão “opcionalmente substituído com até cinco

10 substituintes selecionados independentemente a partir de R^{13} ”, por exemplo, indica que podem estar presentes zero, um, dois, três, quatro ou cinco substituintes (caso o número de pontos de conexão potencial o permita) e, desta forma, o número de substituintes R^{13} pode ser zero.

Quando J for um anel heterocíclico que contém nitrogênio com

15 três a seis membros, ele pode ser ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de qualquer átomo de anel de nitrogênio ou carbono disponível, a menos que descrito em contrário.

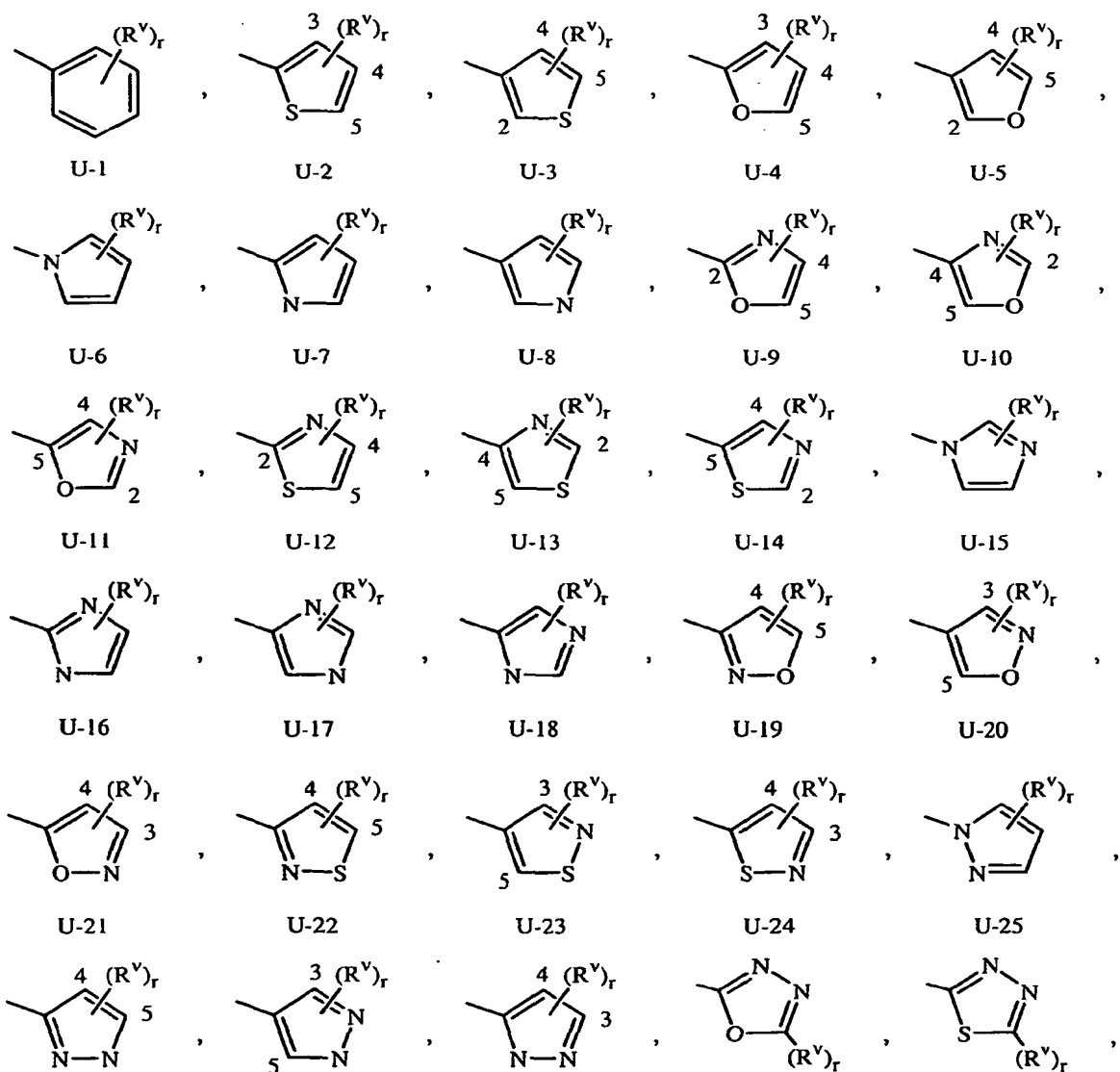
Conforme indicado acima, J pode ser (entre outros) um anel fenila opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir

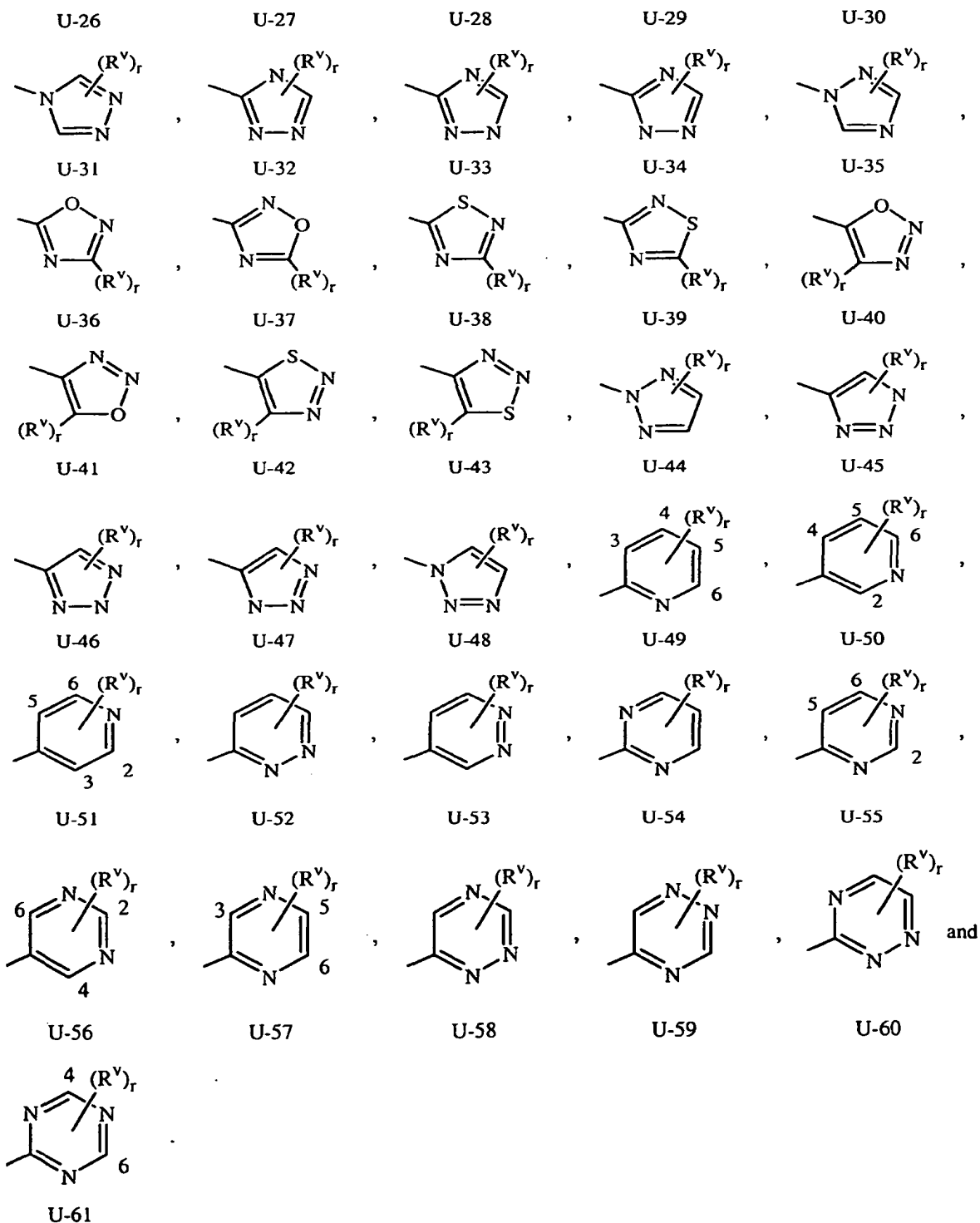
20 de um grupo de substituintes conforme definido na Descrição Resumida da Invenção (ou seja, R^{13}). Um exemplo de anel fenila opcionalmente substituído com até cinco substituintes é o anel ilustrado com U-1 na Ilustração 1, em que R^v é R^{13} conforme definido na Descrição Resumida da Invenção para J e r é um número inteiro de 0 a 5. Além disso, conforme indicado acima, J pode ser

25 (entre outros) um anel heteroaromático com cinco ou seis membros, opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de um grupo de substituintes conforme definido na Descrição Resumida da Invenção. Exemplos de um anel heteroaromático com cinco ou seis membros

opcionalmente substituído com um ou mais substituintes incluem os anéis U-2 a U-61 exibidos na Ilustração 1 em que R^v é qualquer substituinte conforme definido na Descrição Resumida da Invenção para J (ou seja, R^{13}) e r é um número inteiro de 0 a 4, limitado pelo número de posições disponíveis sobre cada grupo U. Como U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 e U-43 possuem apenas uma posição disponível, para esses grupos U, r é limitado aos números inteiros 0 ou 1, em que $r = 0$ indica que o grupo U é não substituído e um hidrogênio está presente na posição indicada por $(R^v)_r$.

ILUSTRAÇÃO 1





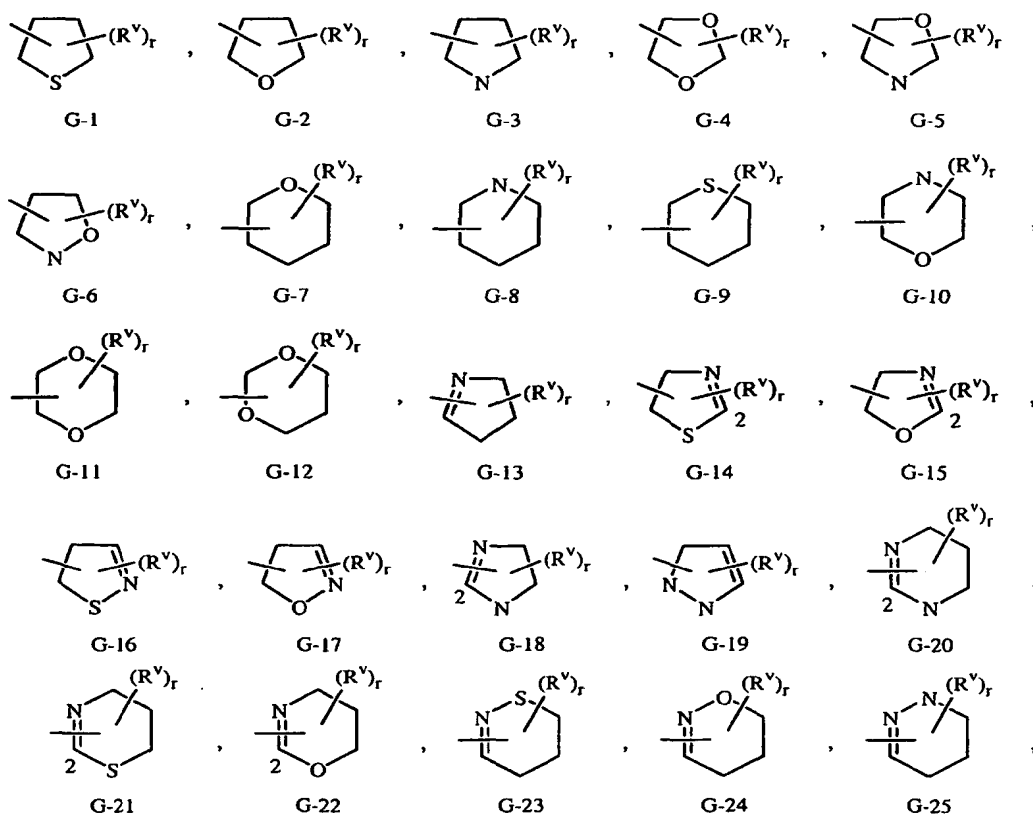
Exemplos de um anel heterocíclico insaturado não aromático com cinco ou seis membros incluem os anéis G-1 a G-35 conforme exibido na Ilustração 2, em que R^v é R^{13} conforme definido na Descrição Resumida da

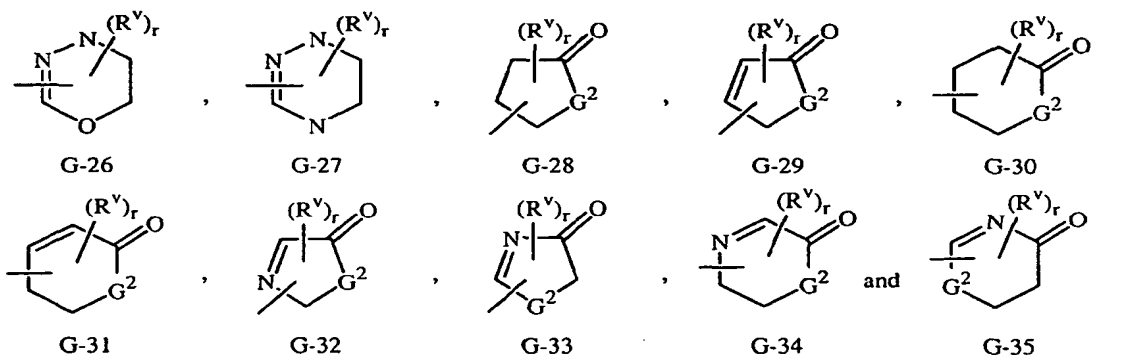
Invenção. Os substituintes opcionais correspondentes a R^v podem ser ligados a qualquer carbono ou nitrogênio disponível por meio da substituição de um átomo de hidrogênio. Para estes anéis G, r é tipicamente um número inteiro de 0 a 4, limitado pelo número de posições disponíveis sobre cada grupo G.

- 5 Observe-se que, quando o ponto de ligação sobre o grupo G for ilustrado como flutuante, o grupo G pode ser ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de qualquer carbono ou nitrogênio disponível do grupo G por meio de substituição de um átomo de hidrogênio.

- 10 Observe-se que, quando J compreender um anel selecionado a partir de G-28 a G-35, G^2 é selecionado a partir de O, S e N. Observe-se que, quando G^2 for N, o átomo de nitrogênio pode completar a sua valência por meio de substituição com H ou os substituintes correspondentes a R^v conforme definido na Descrição Resumida da Invenção para J (ou seja, R^{13}).

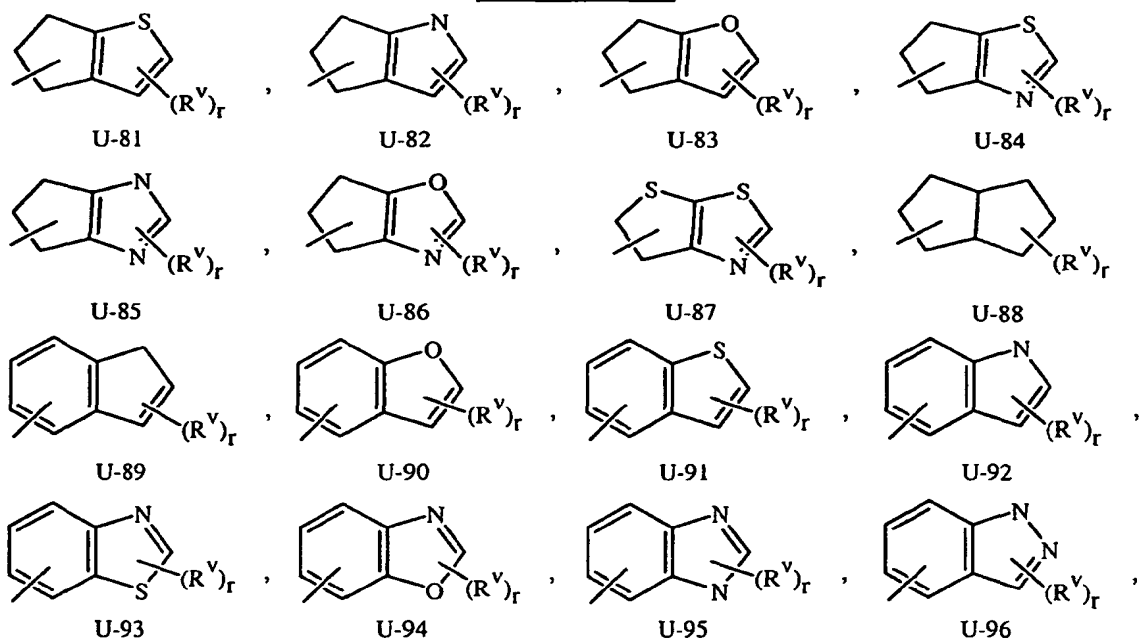
ILUSTRAÇÃO 2

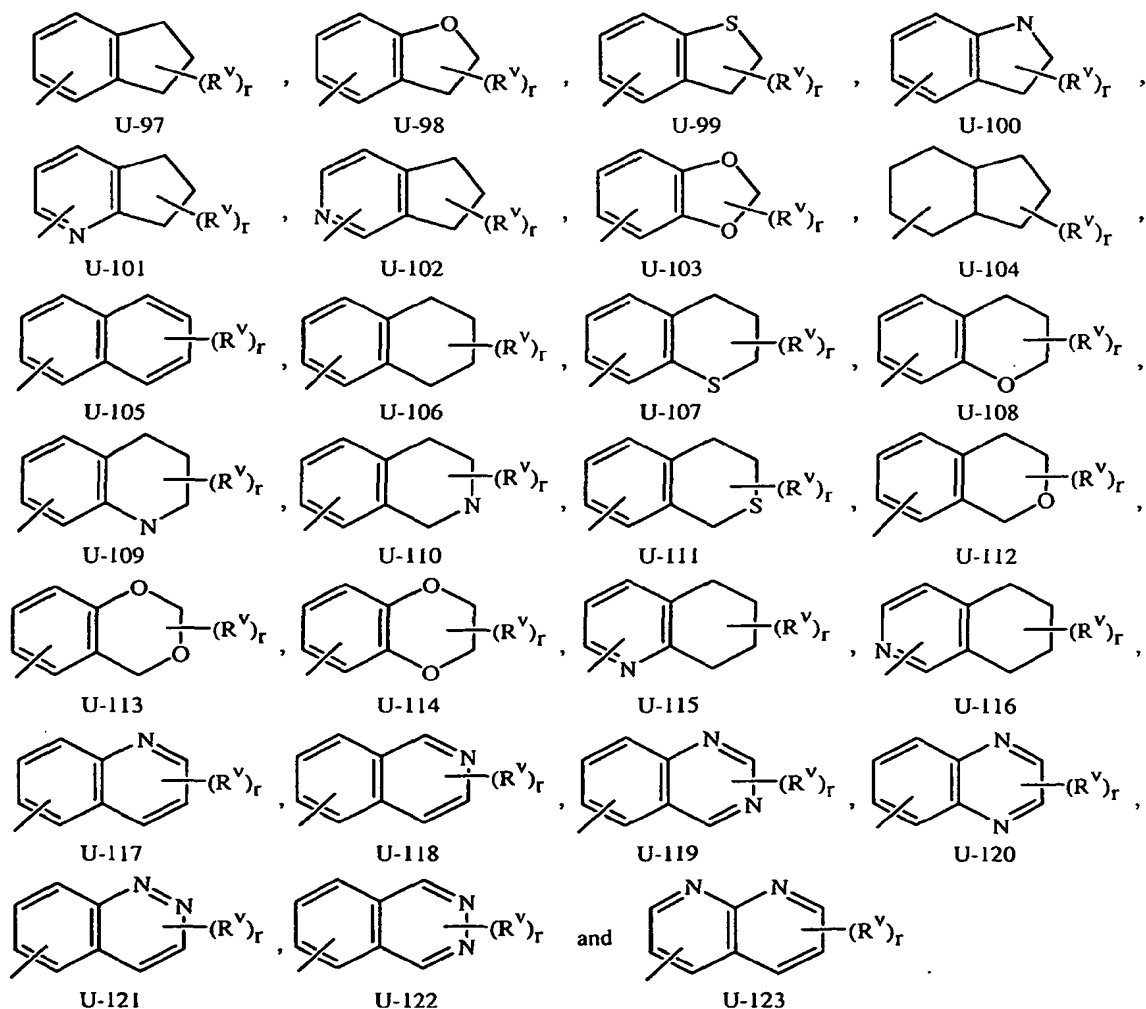




Conforme indicado acima, J pode ser (entre outros) um sistema de anéis bicíclicos fundidos com oito, nove ou dez membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de um grupo de substituintes conforme definido na Descrição Resumida da Invenção (ou seja, R^{13}). Exemplos de sistema de anéis bicíclicos fundidos com oito, nove ou dez membros opcionalmente substituído com até cinco substituintes incluem os anéis U-81 a U-123 exibidos na Ilustração 3, em que R^v é qualquer substituinte conforme definido na Descrição Resumida da Invenção para J (ou seja, R^{13}) e r é tipicamente um número inteiro de 0 a 5.

ILUSTRAÇÃO 3





Embora os grupos R^v sejam exibidos nas estruturas U-1 a U-123, observa-se que eles não necessitam estar presentes porque são substituintes opcionais. Os átomos de nitrogênio que necessitam de substituição para preencher a sua valência são substituídos com H ou R^v . Observe-se que, quando o ponto de ligação entre $(R^v)_r$ e o grupo U for ilustrado como flutuante, $(R^v)_r$ pode ser ligado a qualquer átomo de carbono ou átomo de nitrogênio disponível do grupo U. Observe-se que, quando o ponto de ligação sobre o grupo U for ilustrado como flutuante, o grupo U pode ser ligado ao restante da

5

10 Fórmula 1 por meio de qualquer carbono ou nitrogênio disponível do grupo por substituição de um átomo de hidrogênio. Observe-se que alguns grupos U somente podem ser substituídos com menos de quatro grupos R^v (tais como U-

2 a U-5, U-7 a U-48 e U-52 a U-61).

É conhecida na técnica uma ampla variedade de métodos sintéticos para permitir a preparação de anéis e sistemas de anéis heterocíclicos aromáticos e não aromáticos; para análises completas, vide o conjunto de oito volumes de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky e C. W. Rees, editores-chefes, Pergamon Press, Oxford, Reino Unido, 1984 e o conjunto de doze volumes de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees e E. F. V. Scriven, editores-chefes, Pergamon Press, Oxford, Reino Unido, 1996.

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 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 forma de mistura de estereoisômeros, estereoisômeros individuais ou como forma opticamente ativa.

Os técnicos no assunto apreciarão que nem todos os heterociclos que contêm nitrogênio podem formar *N*-óxidos, pois o nitrogênio requer um par 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 pelos 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 *t*-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 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 das 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 contiver uma porção ácida tal como um 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). Consequentemente, a presente invenção compreende compostos selecionados a partir da Fórmula 1, seus *N*-óxidos e sais apropriados para uso agrícola.

As realizações da presente invenção conforme descrito na
 5 Descrição Resumida da Invenção incluem (em que a Fórmula 1 utilizada nas Realizações a seguir inclui seus *N*-óxidos e sais):

Realização 1. Composto da Fórmula 1, em que R^1 é H, halogênio, CN, alquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , haloalcóxi C_1-C_3 , cicloalquila C_3-C_4 , trialquilsilila C_3-C_6 ou halotrialquilsilila C_3-C_6 .

10 Realização 1a. Composto da Realização 1, em que R^1 é halogênio, CN, alquila C_1-C_2 , alcóxi C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

Realização 1b. Composto da Realização 1a, em que R^1 é halogênio, CN, alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 .

15 Realização 1c. Composto da Realização 1b, em que R^1 é F, Cl, Br, CN, metila ou haloalquila C_1 .

Realização 1d. Composto da Realização 1c, em que R^1 é Cl ou metila.

20 Realização 2. Composto da Fórmula 1, em que R^2 é H, halogênio, CN, alquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_3 ou haloalquila C_1-C_3 .

Realização 2a. Composto da Realização 2, em que R^2 é H, halogênio, CN, metila ou trifluorometila.

Realização 2b. Composto da Realização 2a, em que R^2 é H ou halogênio.

25 Realização 2c. Composto da Realização 2b, em que R^2 é H, F ou Cl.

Realização 2d. Composto da Realização 2c, em que R^2 é H.

Realização 3. Composto da Fórmula 1, em que R^3 é H, alquila C_1-

C₂, haloalquila C₁-C₂, alquilcarbonila C₂-C₃ ou haloalquilcarbonila C₂-C₃.

Realização 3a. Composto da Realização 3, em que R³ é H, alquila C₁-C₂ ou haloalquila C₁-C₂.

Realização 3b. Composto da Realização 3a, em que R³ é H.

5 Realização 4. Composto da Fórmula 1, em que R⁴ é alcóxi C₁-C₂, haloalcóxi C₁-C₂, cicloalcóxi C₃-C₄, alquilamino C₁-C₂, haloalquilamino C₁-C₂, dialquilamino C₂-C₄, halodialquilamino C₂-C₄ ou cicloalquilamino C₃-C₄.

Realização 4a. Composto da Realização 4, em que R⁴ é alcóxi C₁-C₂, haloalcóxi C₁-C₂, alquilamino C₁-C₂ ou dialquilamino C₂-C₄.

10 Realização 4b. Composto da Realização 4a, em que R⁴ é alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂.

Realização 4c. Composto da Realização 4b, em que R⁴ é metóxi.

Realização 5. Composto da Fórmula 1, em que W é O.

Realização 6. Composto da Fórmula 1, em que W é S.

15 Realização 7. Composto da Fórmula 1, em que Q é CR^{6a}R^{6b}, O, NR⁷ ou C=N-O-R⁷.

Realização 7a. Composto da Fórmula 1, em que Q é CR^{6a}R^{6b} ou NR⁷.

Realização 7b. Composto da Fórmula 1, em que Q é O ou NR⁷.

20 Realização 7c. Composto da Fórmula 1, em que Q é CR^{6a}R^{6b}.

Realização 7d. Composto da Fórmula 1, em que Q é NR⁷.

Realização 7e. Composto da Fórmula 1, em que Q é C=N-O-R⁷.

Realização 7f. Composto da Fórmula 1, em que R^{6a} e R^{6b} são independentemente H, halogênio, CN, alquila C₁-C₃ ou haloalquila C₁-C₃.

25 Realização 7g. Composto da Realização 7f, em que R^{6a} e R^{6b} são independentemente H, F, CN ou metila.

Realização 7h. Composto da Realização 7g, em que R^{6a} e R^{6b} são H.

Realização 8. Composto da Fórmula 1, em que R^7 é H, alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou haloalquilcarbonila C_2-C_3 .

Realização 9. Composto da Realização 8, em que R^7 é H, metila, haloalquila C_1-C_3 , acetila ou haloacetila.

5 Realização 10. Composto da Realização 9, em que R^7 é H.

Realização 11. Composto da Fórmula 1, em que Y é $-C(R^5)=N-O-(CR^{8a}R^{8b})_p-X-(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}$.

Realização 11a. Composto da Fórmula 1, em que p é 0.

Realização 12. Composto da Fórmula 1, em que Y é um anel
 10 fenila substituído com um substituinte selecionado a partir de haloalcóxi C_1-C_5 , trialquilsilila C_3-C_{15} , halotrialquilsilila C_3-C_{15} , trialquilsililalquila C_4-C_{20} , trialquilsililalcóxi C_4-C_{20} e trialquilsililalcoxialquila C_5-C_{25} e opcionalmente substituído com até quatro substituintes adicionais selecionados independentemente a partir de halogênio, CN, alquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_3 ,
 15 haloalcóxi C_1-C_3 , trialquilsilila C_3-C_{15} , halotrialquilsilila C_3-C_{15} , trialquilsililalquila C_4-C_{20} , trialquilsililalcóxi C_4-C_{20} e trialquilsililalcoxialquila C_5-C_{25} .

Realização 13. Composto da Realização 12, em que Y é um anel fenila substituído com um substituinte selecionado a partir de haloalcóxi C_1-C_3 , trialquilsilila C_3-C_9 , halotrialquilsilila C_3-C_9 , trialquilsililalquila C_4-C_{12} e
 20 trialquilsililalcóxi C_4-C_{12} , opcionalmente substituído com até quatro substituintes adicionais selecionados independentemente a partir de halogênio, CN, alquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_3 e haloalcóxi C_1-C_3 .

Realização 14. Composto da Realização 13, em que Y é um anel fenila substituído com um substituinte adicional selecionado a partir de
 25 haloalcóxi C_1-C_3 ou trialquilsilila C_3-C_6 , opcionalmente substituído com até quatro substituintes adicionais selecionados independentemente a partir de halogênio e alquila C_1-C_3 .

Realização 15. Composto de acordo com a Realização 14, em

que Y é um anel fenila substituído com um substituinte adicional selecionado a partir de haloalcóxi C₁-C₃ e trialquilsilila C₃-C₆.

Realização 16. Composto de acordo com a Fórmula 1, em que Y é Z.

5 Realização 16a. Composto de acordo com a Realização 16, em que Z é Z-1, Z-2, Z-3, Z-4, Z-6, Z-7, Z-8, Z-9, Z-11, Z-12, Z-18 ou Z-24.

Realização 16b. Composto de acordo com a Realização 16a, em que cada R¹⁴ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, haloalquila C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ ou G^A, cada qual opcionalmente substituído
 10 com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio, ciano, hidróxi, amino, nitro, -CH(=O), -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, C(R¹⁵)=N-O-R¹⁶, C(R¹⁵)=N-R¹⁶, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, haloalquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₈, haloalquilcarbonila C₂-C₈, cicloalquilcarbonila C₄-C₁₀,
 15 alcóxicarbonila C₂-C₈, cicloalcóxicarbonila C₄-C₁₀, alquilaminocarbonila C₂-C₈, dialquilaminocarbonila C₃-C₁₀, cicloalquilaminocarbonila C₄-C₁₀, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈ e trialquilsilila C₃-C₁₀.

Realização 16c. Composto de acordo com a Realização 16b, em que cada G^A é independentemente fenila, benzila ou um anel heteroaromático
 20 com cinco ou seis membros, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio, -CH(=O), -C(R¹⁵)=N-O-R¹⁶, C(R¹⁵)=N-R¹⁶, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, haloalquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₈, haloalquilcarbonila C₂-C₈, cicloalquilcarbonila C₄-C₁₀, alcóxicarbonila C₂-C₈, cicloalcóxicarbonila
 25 C₄-C₁₀, alquilaminocarbonila C₂-C₈, dialquilaminocarbonila C₃-C₁₀, cicloalquilaminocarbonila C₄-C₁₀, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈ e trialquilsilila C₃-C₁₀.

Realização 16d. Composto de acordo com a Realização 16c, em

que cada G^A é independentemente fenila ou 1,2,4-tiadiazol, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio, alquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , haloalquila C_1-C_6 , alquilcarbonila C_2-C_8 , haloalquilcarbonila C_2-C_8 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , cicloalcóxi C_3-C_8 e trialquilsilila C_3-C_{10} .

Realização 16e. Composto da Realização 16a, em que Q é $CR^{6a}R^{6b}$.

Realização 17. Composto da Fórmula 1, em que R^5 é alquila C_1-C_3 ou haloalquila C_1-C_3 .

Realização 17a. Composto da Realização 17, em que R^5 é alquila C_1-C_3 .

Realização 17b. Composto da Realização 17a, em que R^5 é metila.

Realização 18. Composto da Realização 17, em que R^5 é haloalquila C_1-C_3 .

Realização 19. Composto da Fórmula 1, em que p e q são independentemente um número inteiro de 0 a 3.

Realização 20. Composto da Fórmula 1, em que cada R^{8a} e R^{9a} é independentemente H, OH, CN, halogênio, alquila C_1-C_5 , haloalquila C_1-C_5 ou alcóxi C_1-C_5 .

Realização 21. Composto da Realização 20, em que cada R^{8a} e R^{9a} é independentemente H, halogênio, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 ou alcóxi C_1-C_3 .

Realização 22. Composto da Fórmula 1, em que cada R^{10a} , R^{10b} e R^{10c} é independentemente alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , alcoialquila C_2-C_8 , haloalcoialquila C_2-C_8 , cicloalquila C_3-C_6 , alquilocicloalquilalquila C_5-C_{10} ou J.

Realização 22a. Composto da Fórmula 1, em que J é independentemente um anel fenila, um anel heteroaromático com cinco ou seis

membros ou um anel carbocíclico ou heterocíclico não aromático com três a seis membros, cada qual opcionalmente incluindo membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), C(=NR¹¹), NR¹¹, SiR^{12a}R^{12b} e S(=O)_u(=NR¹¹)_z; cada anel opcionalmente substituído com até

5 cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R¹³.

Realização 23. Composto da Realização 22, em que cada R^{10a}, R^{10b} e R^{10c} é independentemente alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alcoialquila C₂-C₈, haloalcoialquila C₂-C₈, cicloalquila C₃-C₆ ou alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀.

10 Realização 24. Composto da Fórmula 1, em que X é uma união direta, O ou C(=O); ou um anel fenila; ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros ou um anel carbocíclico ou heterocíclico não aromático com três a seis membros, em que cada qual inclui opcionalmente membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), C(=NR¹¹), NR¹¹,

15 SiR^{12a}R^{12b} ou S(=O)_u(=NR¹¹)_z; em que cada anel é opcionalmente substituído com até três substituintes selecionados independentemente a partir de R¹³.

Realização 24a. Composto da Fórmula 1, em que X é uma união direta.

Realização 25. Composto da Fórmula 1, em que cada R¹¹ é

20 independentemente H, CN, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₁₀, alquilcarbonila C₂-C₆ ou haloalquilcarbonila C₂-C₆.

Realização 26. Composto da Fórmula 1, em que cada R^{12a} e R^{12b} é independentemente alquila C₁-C₅ ou haloalquila C₁-C₅.

Realização 27. Composto da Fórmula 1, em que cada R¹³ é

25 independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇, haloalquila C₁-C₆, ciano, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆ ou dialquilaminocarbonila C₃-C₆.

Realização 28. Composto da Realização 27, em que cada R^{13} é independentemente halogênio, alquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , ciano, alcóxi C_1-C_6 ou haloalcóxi C_1-C_6 .

Realização 29. Composto da Fórmula 1, em que V é NR^3 .

5 Realização 30. Composto da Fórmula 1, em que V é uma união direta e Q $C(=N)-O-R^7$ ou $C(=O)$.

Realização 31. Composto da Fórmula 1, em que:

- V é diferente de uma união direta;
- R^3 e R^4 são diferentes de cicloalquila C_3-C_6 ;
- 10 - R^5 é diferente de halocicloalquila C_3-C_6 ;
- Q é diferente de $C=N-O-R^7$;
- Y é diferente de Z ; e
- R^{14} é diferente de halocicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 e halocicloalcóxi C_3-C_8 .

15 Realização 32. Composto da Fórmula 1, em que:

- V é diferente de uma união direta;
- R^5 é diferente de halocicloalquila C_3-C_6 ; e
- R^{14} é diferente de halocicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 e halocicloalcóxi C_3-C_8 .

20 As realizações da presente invenção, incluindo as Realizações 1 a 32 acima, bem como quaisquer outras realizações descritas no presente, podem ser combinadas de qualquer forma e as descrições de variáveis nas realizações referem-se não apenas aos compostos da Fórmula 1, mas também aos compostos iniciais e compostos intermediários úteis para preparação dos

25 compostos da Fórmula 1. Além disso, as realizações da presente invenção, incluindo as Realizações 1 a 32 acima, bem como quaisquer outras realizações descritas no presente e qualquer das suas combinações referem-se às composições e métodos de acordo com a presente invenção.

As combinações das Realizações 1 a 32 são ilustradas por:

Realização A. Composto da Fórmula 1, em que:

- R^1 é halogênio, CN, alquila C_1-C_2 , alcóxi C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;
- 5 - R^2 é H, halogênio, CN, metila ou trifluorometila;
- V é NR^3 ;
- R^3 é H, alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou haloalquilcarbonila C_2-C_3 ;
- R^4 é alcóxi C_1-C_2 , haloalcóxi C_1-C_2 , alquilamino C_1-C_2 ou
- 10 dialquilamino C_2-C_4 ;
- W é O;
- Q é $CR^{6a}R^{6b}$, $C=N-O-R^7$, O ou NR^7 ;
- R^5 é alquila C_1-C_3 ou haloalquila C_1-C_3 ; e
- Y é $-C(R^5)=N-O-(CR^{8a}R^{8b})_p-X-(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}$.
- 15 Realização A1. Composto da Realização A, em que:
- R^1 é F, Cl, Br, CN, metila ou haloalquila C_1 ;
- R^2 é H, F ou Cl;
- R^3 é H, alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 ;
- R^4 é alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;
- 20 - Q é $CR^{6a}R^{6b}$ ou NR^7 ;
- R^5 é alquila C_1-C_3 ;
- p é 0; e
- X é uma união direta.

Realização A2. Composto da Realização A1, em que:

- 25 - R^1 é Cl ou metila;
- R^2 é H;
- R^3 é H;
- R^4 é metóxi;

- Q é CR^{6a}R^{6b}; e
- R⁵ é metila.

Realização B. Composto da Fórmula 1, em que:

- R¹ é halogênio, CN, alquila C₁-C₂, alcóxi C₁-C₂, haloalquila
5 C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂;
- R² é H, halogênio, CN, metila ou trifluorometila;
- V é NR³;
- R³ é H, alquila C₁-C₂, haloalquila C₁-C₂, alquilcarbonila C₂-
C₃ ou haloalquilcarbonila C₂-C₃;
10 - R⁴ é alcóxi C₁-C₂, haloalcóxi C₁-C₂, alquilamino C₁-C₂ ou
dialquilamino C₂-C₄;
- W é O;
- Q é O ou NR⁷; e
- Y é um anel fenila substituído com um substituinte
15 selecionado a partir de haloalcóxi C₁-C₅, trialquilsilila C₃-C₁₅, halotrialquilsilila
C₃-C₁₅, trialquilsilila C₄-C₂₀, trialquilsililalcóxi C₄-C₂₀ e trialquilsililalcóxialquila C₅-
C₂₅ e opcionalmente substituído com até quatro substituintes adicionais
selecionados independentemente a partir de halogênio, CN, alquila C₁-C₃,
alcóxi C₁-C₃, haloalcóxi C₁-C₃, trialquilsilila C₃-C₁₅, halotrialquilsilila C₃-C₁₅,
20 trialquilsililalquila C₄-C₂₀, trialquilsililalcóxi C₄-C₂₀ e trialquilsililalcóxialquila C₅-
C₂₅.

Realização B1. Composto da Realização B, em que:

- 25
- R^1 é halogênio, CN, alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 ;
 - R^2 é H ou halogênio;
 - R^3 é H, alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 ;
 - R^4 é alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;
 - Q é NR^7 ;
 - R^5 é alquila C_1-C_3 ; e

- Y é um anel fenila substituído com um substituinte adicional selecionado a partir de haloalcóxi C₁-C₃, trialquilsilila C₃-C₉, halotrialquilsilila C₃-C₉, trialquilsilila C₄-C₁₂ e trialquilsililalcóxi C₄-C₁₂, opcionalmente substituído com até quatro substituintes adicionais selecionados independentemente a partir de halogênio, CN, alquila C₁-C₃, alcóxi C₁-C₃ e haloalcóxi C₁-C₃.

Realização B2. Composto da Realização B1, em que:

- R¹ é Cl ou metila;
 - R² é H;
 - R³ é H;
 - R⁴ é metóxi;
 - R⁵ é metila; e
 - Y é um anel fenila com um substituinte selecionado a partir de haloalcóxi C₁-C₃ e trialquilsilila C₃-C₆.

Realização C. Composto da Fórmula 1, em que:

- R¹ é halogênio, CN, alquila C₁-C₂, alcóxi C₁-C₂, haloalquila C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂;
 - R² é H, halogênio, CN, metila ou trifluorometila;
 - R³ é H, alquila C₁-C₂, haloalquila C₁-C₂, alquilcarbonila C₂-C₃ ou haloalquilcarbonila C₂-C₃;
 - R⁴ é alcóxi C₁-C₂, haloalcóxi C₁-C₂, alquilamino C₁-C₂ ou dialquilamino C₂-C₄;
 - W é O;
 - Q é CR^{6a}R^{6b}, O, C=N-O-R⁷ ou NR⁷; e
 - Y é Z.

Realização C1. Composto da Realização C, em que:

- R¹ é halogênio, CN, alquila C₁-C₂ ou haloalquila C₁-C₂;
 - R² é H ou halogênio;
 - R³ é H, alquila C₁-C₂ ou haloalquila C₁-C₂;

- R^4 é alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;
- R^5 é alquila C_1-C_3 ; e
- Y é Z-1, Z-2, Z-3, Z-4, Z-6, Z-7, Z-8, Z-9, Z-11, Z-12, Z-18 ou Z-24.

5 Realização C2. Composto da Realização C1, em que cada R^{14} é independentemente alquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , haloalquila C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 ou G^A , cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio, ciano, hidróxi, amino, nitro, $-CH(=O)$, $-C(=O)OH$, $-C(=O)NH_2$,
 10 $C(R^{15})=N-O-R^{16}$, $C(R^{15})=N-R^{16}$, alquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , alquinila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , alquilcarbonila C_2-C_8 , haloalquilcarbonila C_2-C_8 , cicloalquilcarbonila C_4-C_{10} , alcóxicarbonila C_2-C_8 , cicloalcóxicarbonila C_4-C_{10} , alquilaminocarbonila C_2-C_8 , dialquilaminocarbonila C_3-C_{10} , cicloalquilaminocarbonila C_4-C_{10} , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , cicloalcóxi C_3-C_8 e trialquilsilila C_3-C_{10} .

Realização C3. Composto da Realização C2, em que cada G^A é independentemente fenila, benzila ou anel heteroaromático com cinco ou seis membros, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio, -
 20 $CH(=O)$, $-C(R^{15})=N-O-R^{16}$, $C(R^{15})=N-R^{16}$, alquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_8 , haloalquila C_1-C_6 , alquilcarbonila C_2-C_8 , haloalquilcarbonila C_2-C_8 , cicloalquilcarbonila C_4-C_{10} , alcóxicarbonila C_2-C_8 , cicloalcóxicarbonila C_4-C_{10} , alquilaminocarbonila C_2-C_8 , dialquilaminocarbonila C_3-C_{10} , cicloalquilaminocarbonila C_4-C_{10} , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , cicloalcóxi C_3-C_8 e trialquilsilila C_3-C_{10} .

Realização C4. Composto da Realização C3, em que cada G^A é independentemente fenila ou 1,2,4-tiadiazol, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a

partir do grupo que consiste de halogênio, ciano, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, haloalquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₈, haloalquilcarbonila C₂-C₈, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈ e trialquilsilila C₃-C₁₀.

Realização C5. Composto da Realização C, em que Q é CR^{6a}R^{6b}.

5 Realização C6. Composto da Realização C, em que V é NR³.

Realização C. Composto da Realização C, em que:

- V é NR³; e
- Q é C=N-O-R⁷.

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

- N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)etóxi]imino]etil]fenil]metil]carbamato de metila;
- N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)propóxi]imino]etil]fenil]metil]carbamato de metila;
- 15 - 2-[4-cloro-3'-(trifluorometóxi)[1,1'-bifenil]-3-il]hidrazinocarboxilato de metila;
- N-[[2-cloro-5-[1-[[[(trimetilsilil)metóxi]imino]etil]fenil]metil]carbamato de metila;
- N-[[2-cloro-5-[1-[[[(etildimetilsilil)metóxi]imino]etil]fenil]metil]carbamato de metila;
- 20 - N-[[2-cloro-5-[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila;
- N-[[2-cloro-5-[1-(4-metoxifenil)-1H-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila;
- 25 - N-[[5-[1-(4-acetilfenil)-1H-pirazol-3-il]-2-clorofenil]metil]carbamato de metila;
- N-[[2-cloro-5-[1-[3-(trimetilsilil)propil]-1H-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila; e

- *N*-[[2-cloro-5-[1-(4-metilfenil)metil]-1*H*-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila.

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) 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). 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.

Um ou mais dos métodos e variações a seguir conforme descrito nos Esquemas 1 a 21 podem ser utilizados para preparar os compostos da

Fórmula 1. As definições de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^{6a} , R^{6b} , R^{8a} , R^{8b} , R^{9a} , R^{9b} , R^{10a} , R^{10b} , R^{10c} , R^{14} , G^A , W , Q , X , Y , p e q nos compostos das Fórmulas 1 a 30 abaixo são conforme definido acima na Descrição Resumida da Invenção, a menos que indicado em contrário. Os compostos das Fórmulas 1a a 1m são

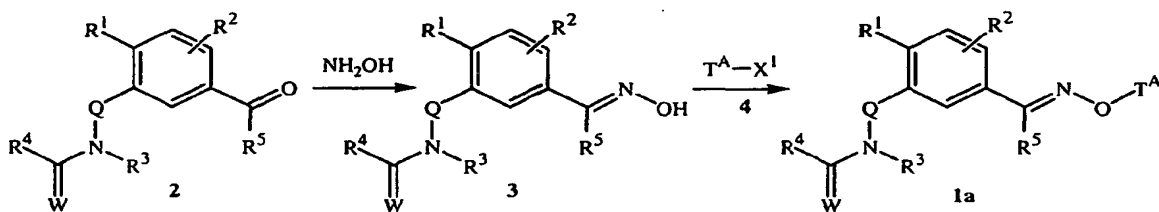
5 vários subconjuntos da Fórmula 1 e todos os substituintes para as Fórmulas 1a a 1m são conforme definido acima para a Fórmula 1, a menos que indicado em contrário. As Fórmulas 2a, 2b e 2c são subconjuntos da Fórmula 2, a Fórmula 6a é um subconjunto da Fórmula 6, a Fórmula 8a é um subconjunto da Fórmula 8 e a Fórmula 10a é um subconjunto da Fórmula 10.

Conforme exibido no Esquema 1, certos compostos da Fórmula 1a (Fórmula 1 em que V é NR^3 e Y é $-C(R^5)=N-O-(CR^{8a}R^{8b})_p-X-(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}$) podem ser preparados por meio da reação, em primeiro lugar, de um composto da Fórmula 2 com hidroxilamina sob temperaturas que variam de cerca de 50 a cerca de 100 °C em um solvente alcohólico inferior tal como metanol ou etanol, que pode opcionalmente conter água. A oxima resultante da

15 Fórmula 3 pode ser alquilada em seguida com um terminal haleto de alquila da Fórmula 4, em que T^A é $-(CR^{8a}R^{8b})_p-X-(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}$ e X^1 é um grupo residual tal como haleto (ou seja, Cl, Br, I) em um solvente aprótico polar tal como *N,N*-dimetilformamida na presença de uma base inorgânica tal como

20 carbonato de potássio ou hidreto de sódio sob temperaturas que variam de cerca de 50 a cerca de 120 °C. O método do Esquema 1 é ilustrado no Exemplo 2.

ESQUEMA 1



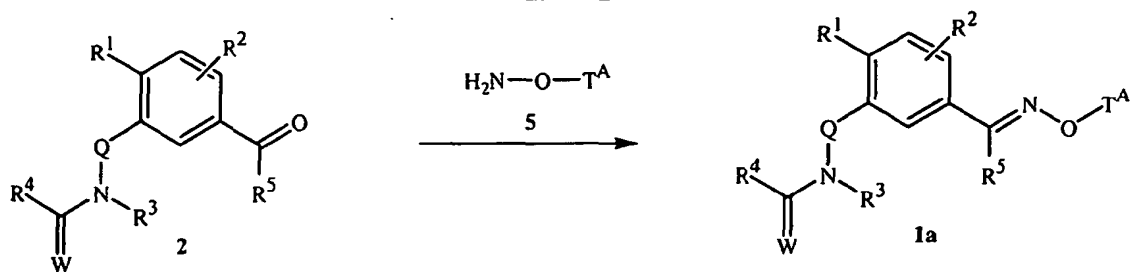
X^1 é Cl, Br ou I

em que V é NR^3 e T^A é $-(\text{CR}^{8a}\text{R}^{8b})_p\text{-SiR}^{10a}\text{R}^{10b}\text{R}^{10c}$

Alternativamente, os compostos da Fórmula 1a podem ser preparados reagindo-se um derivado de hidroxilamina da Fórmula 5 ou um de seus sais com um composto da Fórmula 2 em um solvente alcohólico inferior sob temperaturas que variam de cerca de 50 a cerca de 100 °C conforme exibido no Esquema 2. Para uma referência que ilustra este tipo de reação, vide, por exemplo, de Lijser et al, *J. Organic Chem.* 2004, 69, 3057-3067. O método do Esquema 2 também é ilustrado no Exemplo 1.

Para uma referência geral da síntese de compostos da Fórmula 5, vide Kikugawa et al, *Organic Preparations and Procedures International*, 1994, 26 (1), 111-113.

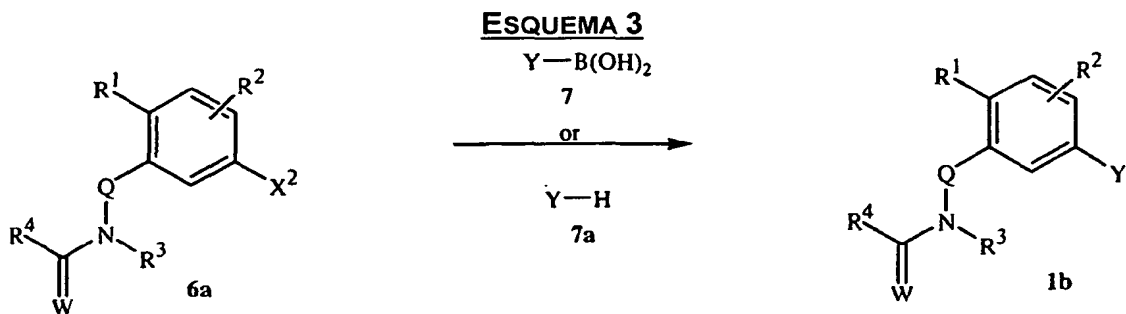
ESQUEMA 2



em que V é NR^3 e T^A é $-(\text{CR}^{8a}\text{R}^{8b})_p\text{-SiR}^{10a}\text{R}^{10b}\text{R}^{10c}$

Os compostos da Fórmula 1b (Fórmula 1 em que V é NR^3) em que Y é um anel fenila substituído ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros podem ser preparados por meio da reação de Suzuki bem conhecida por meio de acoplamento cruzado catalisado por Pd de um iodeto ou brometo aromático da Fórmula 6a (Fórmula 6, exibido no Esquema 5, em que X é Br ou I) com um fenila substituído ou ácido borônico heteroaromático da Fórmula 7 conforme exibido no Esquema 3. Para condições de reação de Suzuki típicas, vide, por exemplo, Suzuki et al, *Chemical Review*, 1995, 95, 2457-2483. Uma ampla variedade de catalisadores é útil para este tipo de transformação; é particularmente útil como catalisador

tetraquis(trifenilfosfina)paládio (0). Solventes tais como tetra-hidrofuran, acetonitrila, dietil éter e dioxano são apropriados. Os ácidos borônicos da Fórmula 7 são disponíveis comercialmente ou podem ser preparados por meio de métodos conhecidos. Outros procedimentos de acoplamento oferecem uma série de alternativas para introdução de um grupo fenila substituído sobre a Fórmula 1, incluindo métodos de acoplamento publicados por Heck, Stille e Kumada. Vide também, por exemplo, Zificsak et al, *Tetrahedron*, 2004, 60, 8891-9016. Os compostos da Fórmula 1b em que Y é um anel heteromático N-ligado podem ser preparados por meio de uma reação de acoplamento cruzado por paládio utilizando compostos da Fórmula 7a. Para referências importantes, vide, por exemplo, Buchwald et al, *Accounts of Chemical Research*, 1998, 31 (12), 805-818 e Hartwig, *Angew. Chem. Int. Ed.*, 1998, 37, 2046-2067.

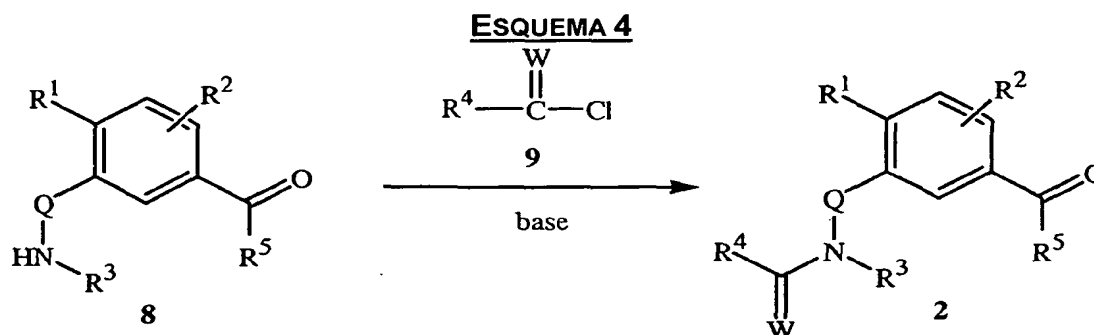


em que X² é Br ou I

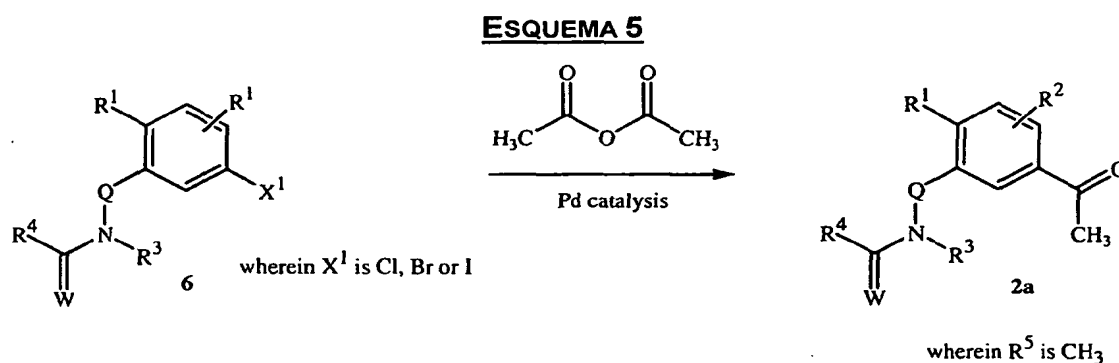
em que Y é um anel fenila substituído ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros

Conforme exibido no Esquema 4, compostos da Fórmula 2 podem ser preparados por meio da reação de uma amina substituída da Fórmula 8 com um cloreto ácido da Fórmula 9 na presença de uma base tal como trietilamina ou piridina. A reação pode ser conduzida sem solvente diferente dos compostos das Fórmulas 6a, 9 e a base ou em um solvente aprótico tal como diclorometano, clorofórmio, dietil éter ou tetra-hidrofuran sob temperaturas que variam de cerca de 0 a cerca de 50 °C. Para uma referência

relacionada, vide a Patente Europeia Publicada nº EP 1586552. Para uma síntese geral de compostos da Fórmula 9, vide *Advanced Organic Synthesis*, quarta edição, Wiley & Sons 1992, 437, e referências ali mencionadas. Para síntese de um composto da Fórmula 2 em que Q é NR⁷ e R⁷ é H, vide a Patente Internacional Publicada nº WO 2004/037770 e também a Etapa B do Exemplo 1.

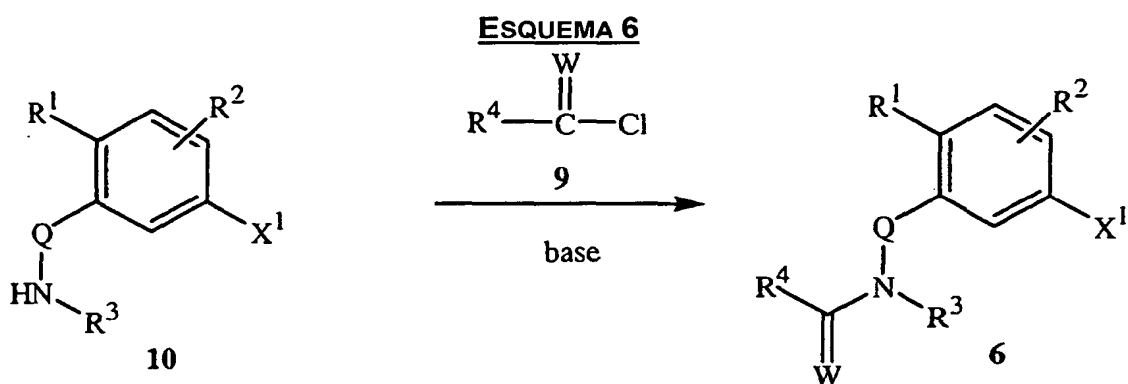


Além disso, os compostos da Fórmula 2a (Fórmula 2 em que R⁵ é CH₃) podem ser preparados a partir de compostos da Fórmula 6 por meio de reação com anidrido acético na presença de catálise de paládio conforme exibido no Esquema 5. Para uma referência que ilustre o método do Esquema 5, vide, por exemplo, Cacchi et al, *Organic Letters* 2003, 5 (3), 289-291.



Conforme exibido no Esquema 6, os compostos da Fórmula 6 podem ser preparados a partir de amins da Fórmula 10 por meio de um método análogo ao Esquema 4. Além disso, a Patente Norte-Americana nº 6.313.071 descreve o método do Esquema 6 quando Q é CH₂. Adicionalmente,

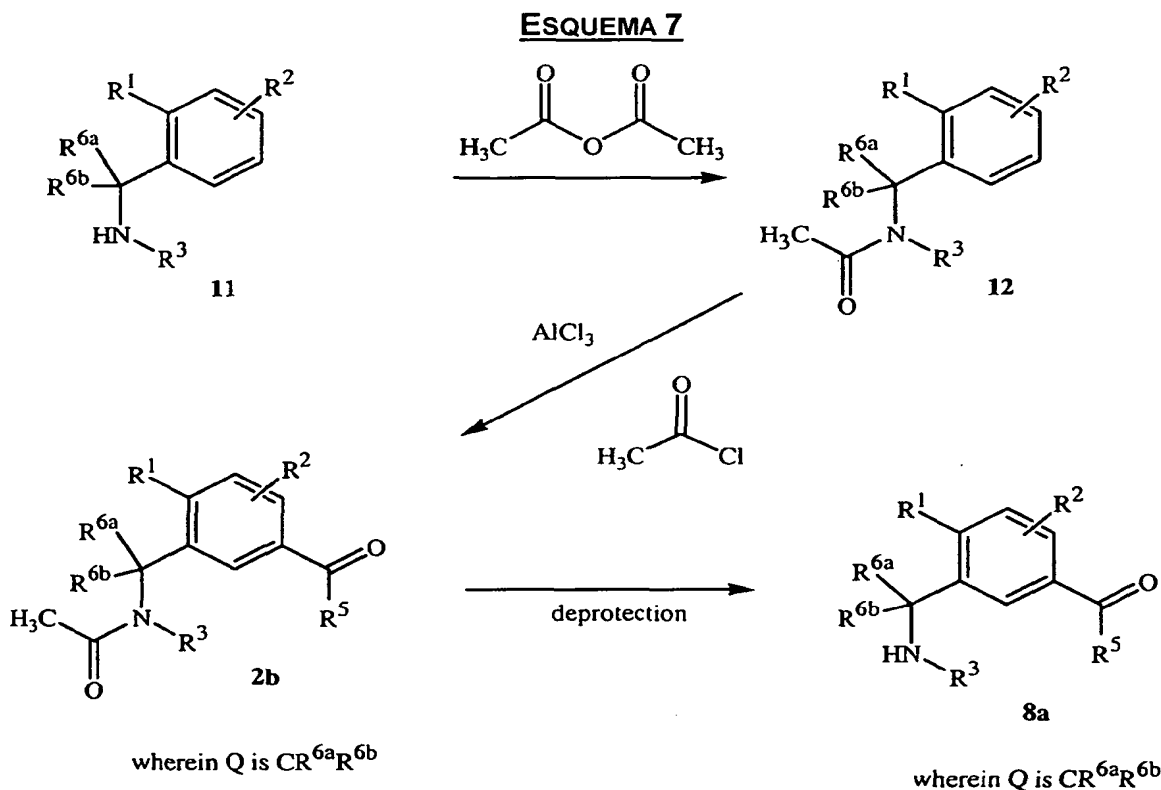
a Patente Norte-Americana nº 6.313.071 descreve um método alternativo de preparação de certos compostos da Fórmula 6 quando Q é CH₂, que envolve a preparação, em primeiro lugar, de um isocianato a partir da amina da Fórmula 10 e, em seguida, reação do isocianato com um composto da Fórmula R⁴H em que R⁴ é alcóxi ou alquilamino para fornecer um composto da Fórmula 6. Para síntese de um composto da Fórmula 6 em que Q é NR⁷ e R⁷ é H, vide a Etapa C do Exemplo 1.



em que X¹ é halogênio

Os compostos da Fórmula 8a (Fórmula 8 em que Q é CR^{6a}R^{6b}) podem ser preparados por meio de um simples procedimento de três etapas a partir de aminas da Fórmula 11 conforme descrito no Esquema 7. As aminas da Fórmula 11 são conhecidas ou podem ser facilmente sintetizadas por meio de métodos gerais conhecidos dos técnicos no assunto. Na primeira etapa, uma amina da Fórmula 11 reage com anidrido acético com ou sem um solvente aprótico tal como diclorometano, clorofórmio, dietil éter ou tetra-hidrofuran sob temperaturas que variam de cerca de 0 a cerca de 100 °C, na presença de uma base tal como trietilamina ou piridina com ou sem um catalisador nucleofílico tal como 4-dimetilaminopiridina para fornecer um composto da Fórmula 12. O composto da Fórmula 12 pode reagir em seguida de acordo com condições de Friedel-Crafts para fornecer um composto da Fórmula 2b (Fórmula 2 em que Q é CR^{6a}R^{6b}) que pode ser desprotegido em seguida para gerar um composto da

Fórmula 8a. Para condições de reação típicas, vide a Patente Europeia Publicada nº EP 1586552.



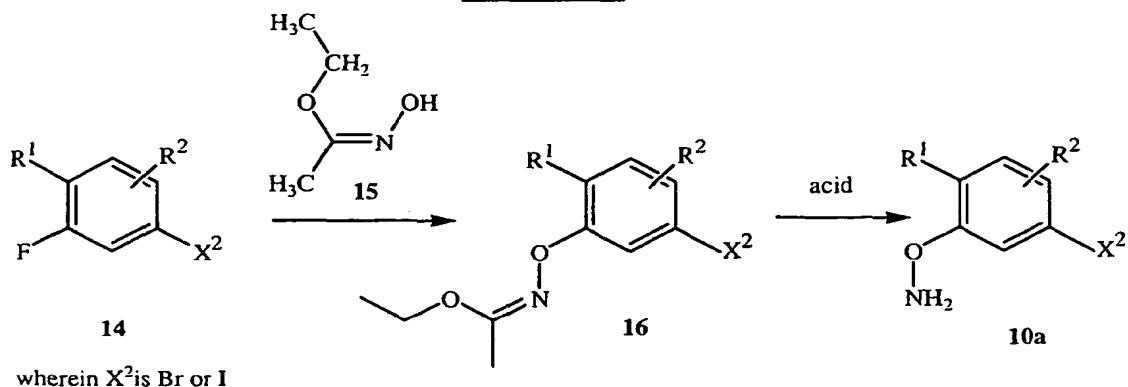
5 Os compostos da Fórmula 10 são conhecidos ou podem ser facilmente sintetizados por meio de métodos gerais conhecidos dos técnicos no assunto. Os compostos da Fórmula 10a (Fórmula 10 em que Q é O e R³ é H), podem ser preparados, por exemplo, a partir de derivados de fluorobenzeno simples da Fórmula 14 conforme exibido no Esquema 8. A reação de um

10 composto da Fórmula 14 com um aceto-hidroxiato da Fórmula 15 é tipicamente conduzida em um solvente aprótico polar tal como *N,N*-dimetilformamida na presença de uma base apropriada tal como *tert*-butóxido de potássio ou hidreto de sódio sob temperaturas que variam de cerca de -10 a 120 °C. O composto da Fórmula 16 resultante pode ser desprotegido em

15 seguida utilizando um ácido forte tal como ácido perclórico sob temperaturas que variam de cerca de -10 a cerca de 40 °C para gerar um composto da

Fórmula 10a (para uma referência relevante, vide, por exemplo, Kikugawa et al, *Organic Preparations and Procedures Internacional* 1997, 29 (5), 594-600).

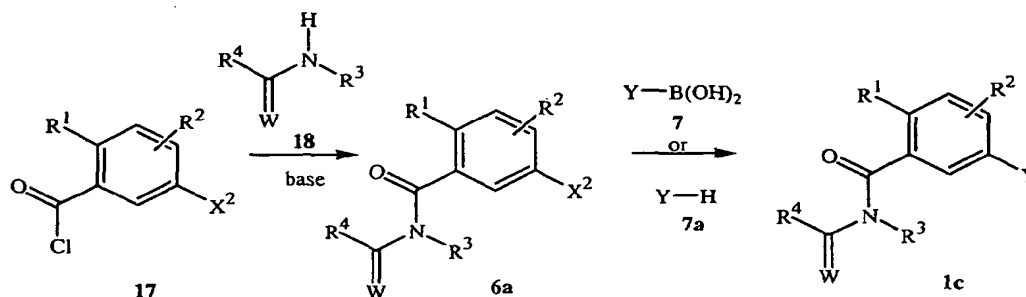
ESQUEMA 8



- 5 Os compostos da Fórmula 1c (Fórmula 1 em que V é NR^3 e Q é $C(=O)$) em que Y é um anel fenila substituído ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros podem ser preparados de acordo com o método do Esquema 9. Na primeira etapa do método do Esquema 9, um composto da Fórmula 18 reage com uma base apropriada tal como hidreto de sódio ou *tert*-
- 10 butóxido de potássio em um solvente tal como tetra-hidrofuran ou *N,N*-dimetilformamida e reage em seguida com um composto da Fórmula 17, que é disponível comercialmente ou facilmente preparado a partir do ácido carboxílico correspondente por meio de procedimentos conhecidos, sob temperaturas que variam de cerca de -10 a cerca de 40 °C para gerar um composto da Fórmula
- 15 6a. Os compostos da Fórmula 1c podem ser preparados em seguida por meio de procedimentos de acoplamento de reação Suzuki utilizando um fenila substituído ou ácido borônico heteroaromático da Fórmula 7 por meio de acoplamento cruzado catalisado por Pd do composto brometo ou iodeto aromático da Fórmula 6a (para condições de reação, vide, por exemplo, Suzuki et al, *Chemical Review*, 1995, 95, 2457-2483). Compostos da Fórmula 1c em
- 20 que Y é um anel heteroaromático ligado por *N* podem ser preparados por meio de uma reação de acoplamento cruzado de paládio utilizando compostos da

Fórmula 7a. Para referências importantes, vide, por exemplo, Buchwald et al, *Accounts of Chemical Research*, 1998, 31 (12), 805-818, e Hartwig, *Angew. Chem. Int. Ed.*, 1998, 37, 2046-2067. Para uma síntese geral de compostos das Fórmulas 17 e 18, vide, por exemplo, *Advanced Organic Synthesis*, quarta edição, Wiley & Sons 1992, 417-418 e 437.

ESQUEMA 9



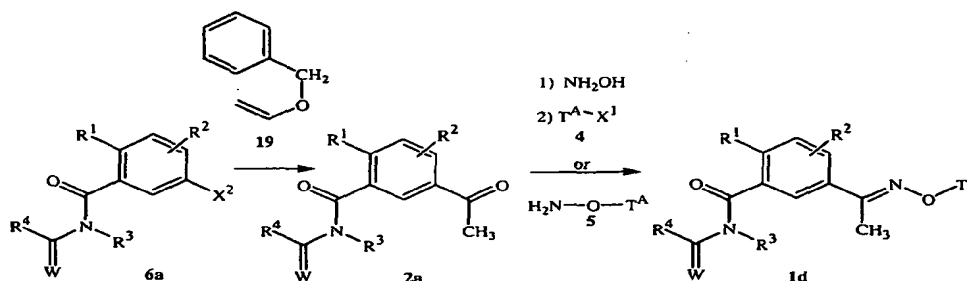
em que X^2 é I ou Br

em que Y é um anel fenila substituído ou um anel heteroaromático

com cinco ou seis membros

Os compostos da Fórmula 1d (Fórmula 1 em que Y é $-C(R^5)=N-O-$ ($CR^{8a}R^{8b}$)_p-X-($CR^{9a}R^{9b}$)_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c} e R⁵ é CH₃) podem ser preparados conforme exibido no Esquema 10. O método envolve em primeiro lugar a reação de um composto da Fórmula 6a com um vinil éter da Fórmula 19 na presença de catálise de paládio de acordo com os procedimentos gerais relatados na literatura (vide, por exemplo, Xiao et al, *J. Organic Chem.* 2006, 71, 7467-7470) para gerar um composto da Fórmula 2a. O composto da Fórmula 2a pode ser convertido em seguida em um composto da Fórmula 1d de acordo com o método do Esquema 1 ou 2.

ESQUEMA 10

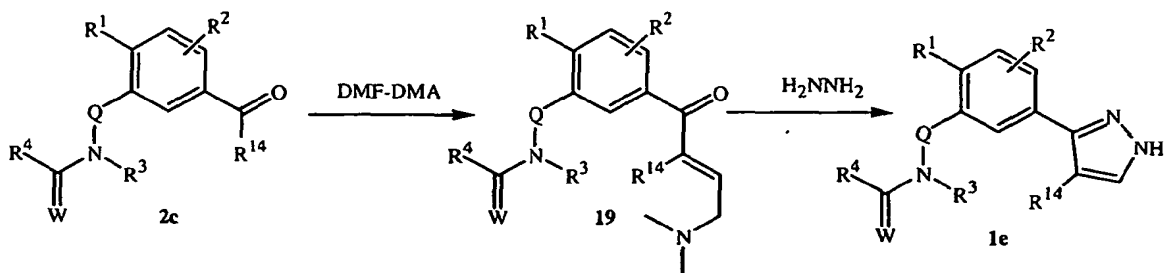


em que X^2 é Br ou I

em que T^A é $-(CR^{8a}R^{8b})_p-X(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}$

Conforme exibido no Esquema 11, certos compostos da Fórmula 1e (Fórmula 1 em que V é NR^3 e Y é Z-2), em que R^{14} é H, alquila ou haloalquila podem ser preparados por meio da reação, em primeiro lugar, de um composto da Fórmula 2c com *N,N*-dimetilformamida dimetil acetal (DMF-DMA) sob temperaturas que variam de cerca de 40 a cerca de 100 °C em um solvente alcanol inferior tal como metanol ou etanol, que pode compreender opcionalmente água, para fornecer um composto intermediário da Fórmula 19. Em uma etapa subsequente, o composto da Fórmula 19 reage com hidrazina para fornecer um composto da Fórmula 1e. Os técnicos no assunto reconhecerão que existem outros métodos de realização de transformações deste tipo, tais como o método descrito por Barrett et al, *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* 2005, 15, 3540-3546. O método do Esquema 11 é ilustrado nas Etapas A e B do Exemplo 4.

ESQUEMA 11

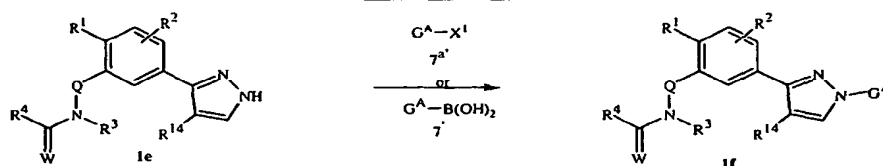


em que R^{14} é H, alquila ou haloalquila

Conforme exibido no Esquema 12, certos compostos da Fórmula 1f (Fórmula 1 em que V é NR^3 e Y é Z-2) em que R^{14} é H, alquila ou haloalquila e G^A é um anel fenila opcionalmente substituído, anel benzila ou um heteroaromático com cinco ou seis membros podem ser preparados a partir de um composto da Fórmula 1e por meio de reação com um composto da Fórmula 7^{a'}. A reação é opcionalmente conduzida na presença de um catalisador, que compreende

tipicamente paládio ou cobre. Para referências importantes, vide Buchwald et al, *Accounts of Chemical Research* 1998, 31 (12), 805-818. Alternativamente, os compostos da Fórmula 1f podem ser preparados por meio de reação de um composto da Fórmula 1e com um ácido borônico da Fórmula 7' na presença de um sal de cobre apropriado para fornecer compostos da Fórmula 1f. Para referências importantes, vide Chan et al, *Boronic Acids*, 205-240, D. G. Hall, Ed. Wiley-VCH. O Exemplo 5 ilustra o método do Esquema 12 para a preparação de um composto da Fórmula 1f a partir da Fórmula 1e utilizando um ácido borônico da Fórmula 7'. Além disso, o Exemplo 5, Exemplo 6 e a Etapa B do Exemplo 8 ilustram o método do Esquema 12 utilizando um composto da Fórmula 7^a.

ESQUEMA 12

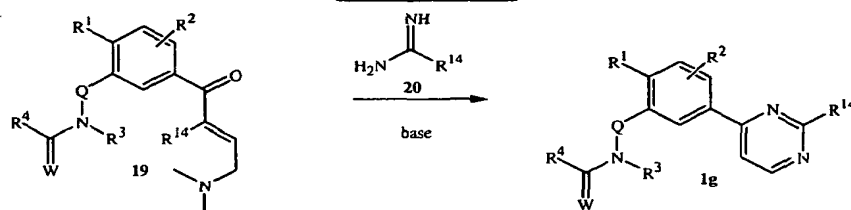


em que G^A é um anel heteroaromático com cinco ou seis membros

em que R^{14} é H, alquila ou haloalquila

Certos compostos da Fórmula 1g (Fórmula 1 em que V é NR^3 e Y é Z-18) podem ser preparados por meio da reação de um composto da Fórmula 19 com uma amidina da Fórmula 20 na presença de uma base alcóxido apropriada tal como *tert*-butóxido de potássio ou base de hidreto alcali tal como hidreto de sódio sob uma temperatura que varia de cerca de 50 a cerca de 100 °C em um solvente alanol inferior (tal como metanol ou etanol) para fornecer um composto da Fórmula 1g.

ESQUEMA 13



Os compostos da Fórmula 1h (Fórmula 1 em que V é NR^3 e Y é Z-11, Z-12 ou Z-13) em que R^{14} é H podem ser preparados em síntese de três etapas a partir de um composto da Fórmula 6a conforme ilustrado no Esquema 14.

Na etapa 1 do Esquema 14, alquinas trimetilsilil-substituídas da Fórmula 20 são obtidas por meio de contato de um composto da Fórmula 6a com etiniltrimetilsilano na presença de um catalisador de paládio apropriado (tal como tetraquis(trifenilfosfino)paládio ou diclorobis(trifenilfosfino)paládio) e na presença de um catalisador de cobre apropriado (tal como iodeto de cobre (I)).

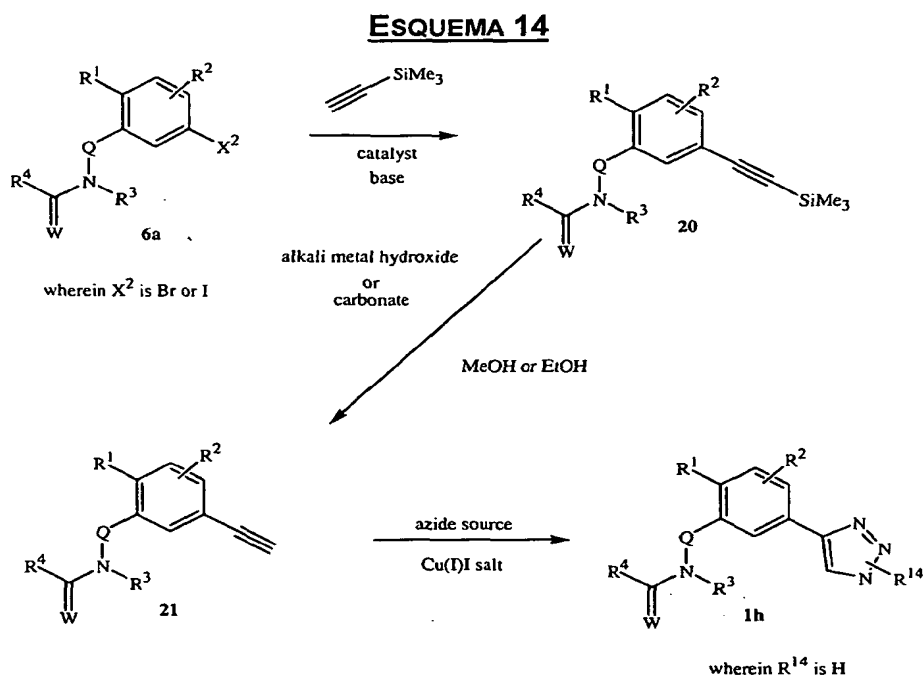
Neste método, a razão molar entre etiniltrimetilsilano e o composto da Fórmula 6a é tipicamente de cerca de 1,1 a cerca de 5 e as razões molares entre o catalisador de paládio e o catalisador de cobre e o composto da Fórmula 6a são de cerca de 0,005 a cerca de 0,1 cada um. A reação é preferencialmente conduzida na presença de uma base amina apropriada, tal como uma base amina que compreende trietilamina, *N,N*-di-isopropiletilamina, dietilamina ou piperidina. A reação é preferencialmente conduzida na presença de um solvente. Em alguns casos, entretanto, a reação pode ser conduzida sem solvente além do composto da Fórmula 6a, etiniltrimetilsilano e a base amina. Um procedimento preferido envolve, entretanto, o uso de um solvente apropriado, que inclui, por exemplo, tetra-hidrofuran, tolueno ou *N,N*-dimetilformida. É adicionalmente preferida como solvente uma mistura do solvente apropriado com a base amina. Quando o solvente compreender a base amina ou uma combinação da base amina e do solvente apropriado, a base amina encontra-se tipicamente em grande excesso estequiométrico com relação ao composto da Fórmula 6a. Para um exemplo que ilustra o método do Esquema 14 de preparação de um composto da Fórmula 20, vide a Etapa C do Exemplo 9.

Na etapa 2 do Esquema 14, a remoção do grupo trimetilsilano

para gerar uma alquina da Fórmula 21 é atingida por meio de tratamento de um composto da Fórmula 20 com um carbonato ou hidróxido de metal álcali tal como hidróxido de potássio, hidróxido de sódio ou carbonato de potássio em metanol ou etanol. Tipicamente, a razão molar entre a base e o composto da Fórmula 20 é de cerca de 0,001 a cerca de 5. A reação é preferencialmente conduzida em um solvente orgânico apropriado. Tipicamente, o método é conduzido mais satisfatoriamente sob uma temperatura que varia de cerca de 0 °C à temperatura de refluxo do solvente e, de maior preferência, de cerca de 25 a 30 °C. Alternativamente, podem ser utilizadas outras condições de dissilação conhecidas na técnica, tais como tratamento com fluoreto de tetrabutilamônio em solventes tais como tetra-hidrofuran e clorofórmio (que compreende opcionalmente água). Para um exemplo que ilustra o método do Esquema 14 de preparação de um composto da Fórmula 21, vide a Etapa D do Exemplo 9.

Na etapa 3 do Esquema 14, os compostos da Fórmula 1h são preparados por meio da reação de alquinas da Fórmula 21 com uma fonte apropriada de íons azida e na presença de pelo menos um sal de cobre (I). As fontes de azida apropriadas incluem, por exemplo, azida de sódio e trimetilsilil azida. A razão molar entre a fonte de azida com relação ao composto da Fórmula 21 é tipicamente de cerca de 1 a cerca de 3. No método do presente, sais de cobre (I) apropriados compreendem um ou mais compostos selecionados a partir do grupo que consiste de iodeto de cobre (I), brometo de cobre (I) e cloreto de cobre (I). Alternativamente, pode-se utilizar um sal de cobre (II) em combinação com um agente redutor suave, tal como sulfato de cobre (II) com ascorbato de sódio. A razão molar entre o sal de cobre (I) e o composto da Fórmula 21 é tipicamente de cerca de 0,05 a cerca de 0,2. A reação é tipicamente conduzida em um solvente tal como *N,N*-dimetilformamida, tetra-hidrofuran, metanol, *terc*-butanol, sulfóxido de dimetila (que compreende opcionalmente água), sob temperaturas de cerca de 25 a

100 °C. O uso de solventes com ebulição mais baixa pode necessitar, em alguns casos, de pressão elevada para facilitar a condução da reação sob temperaturas acima do ponto de ebulição normal do solvente. Para referências importantes que descrevem o método da etapa 3 do Esquema 14, vide Jin et al, *European J. Organic Chem.* 2004, 3789-3791; Anderson et al, *Synlett* 2005, 2941-2947; e Weinreb et al, *Tetrahedron Letters* 2006, 47, 3035-3038. Para um exemplo que ilustra o método do Esquema 14 de preparação de um composto da Fórmula 1h, vide a Etapa E do Exemplo 9.



10

Conforme ilustrado no Esquema 15, os compostos da Fórmula 1h são úteis como intermediários de preparação de compostos da Fórmula 1i (Fórmula 1 em que V é NR^3 e Y é Z-11, Z-12 ou Z-13) em que R^{14} é diferente de H. Compostos da Fórmula 1i em que R^{14} é um grupo *N*-alquila opcionalmente substituído podem ser obtidos, por exemplo, por meio do tratamento de um composto da Fórmula 1h com um agente alquilante, tipicamente em uma quantidade que varia de cerca de 1 a cerca de 10 equivalentes molares com relação ao composto da Fórmula 1h. A reação é

15

preferencialmente conduzida na presença de uma base tal como carbonato de potássio, hidreto de sódio ou *tert*-butóxido de potássio, tipicamente em uma quantidade que varia de cerca de 1 a 10 equivalentes molares. Os resultados ideais são normalmente obtidos quando a reação é conduzida em um solvente polar tal como *N,N*-dimetilformamida, tetra-hidrofuran, acetona, 2-butanona ou sulfóxido de dimetila, sob temperaturas que variam de °C a 150 °C (dependendo do solvente). Tipicamente, estas condições de reação fornecem uma mistura de isômeros de triazol *N*-alquilado da Fórmula 1i, que podem ser purificados por meio de cromatografia. Para procedimentos representativos, vide Caliendo et al, *European Journal of Pharmaceutical Sciences*, 2002, 16, 15-28; Seto et al, *Bioorganic & Medicinal Chemistry* 2005, 13, 363-386; e Fray et al, *J. Medicinal Chemistry* 2001, 44, 1951-1962. Além disso, o Exemplo 11 ilustra o método do Esquema 15 de preparação de um composto da Fórmula 1h em que R¹⁴ é 4-metilbenzila.

Os compostos da Fórmula 1h podem também ser *N*-arilados para fornecer certos compostos da Fórmula 1i em que R¹⁴ é um anel *N*-fenila opcionalmente substituído. Isso pode ser conseguido por meio de reação de um composto da Fórmula 1h com um iodeto, brometo ou cloreto de fenila na presença de acetilacetato de ferro (III) (Fe(acac)₃), óxido de cobre e carbonato de cézio em *N,N*-dimetilformamida sob temperaturas que variam de cerca de 25 a cerca de 150 °C conforme descrito em Taillefer et al, *Angew. Chem. Int. Ed.* 2007, 46, 934-936. Tipicamente, são obtidas misturas de regioisômeros da Fórmula 1i a partir destas reações. A purificação dos regioisômeros é atingida por meio de cromatografia. Para procedimentos representativos, vide Beauchard et al, *Tetrahedron* 2006, 62, 1895-1903. Além disso, o Exemplo 10 ilustra o método do Esquema 15 quando R¹⁴ é 4-clorofenila.

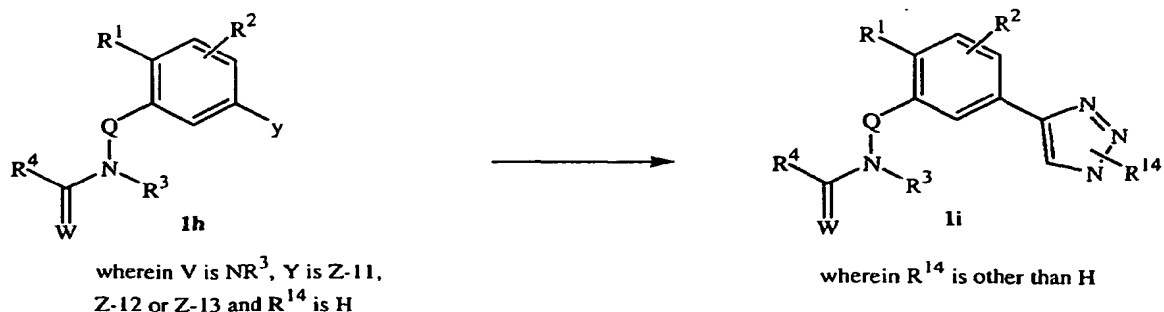
Certos compostos da Fórmula 1i em que R¹⁴ é ciano podem ser

preparados por meio da reação de um composto da Fórmula 1h com brometo de cianogênio na presença de uma base tal como hidreto de sódio em solventes tais como tetra-hidrofuran ou *N,N*-dimetilformamida. Para procedimentos representativos, vide Nakajima et al, *J. Organic Chem.* 1978, 43 (13), 2693-2696.

Certos compostos da Fórmula 1i em que R^{14} é Cl podem ser preparados por meio da reação de um composto da Fórmula 1h com hipoclorito de sódio em ácido acético utilizando procedimentos análogos aos descritos por Canada et al, *Heterocycles* 1985, 23 (9), 2225-2228.

A formação de compostos da Fórmula 1i em que R^{14} é OH pode ser atingida por meio da reação de um composto da Fórmula 1h com um agente oxidante tal como peróxido de hidrogênio ou ácido *m*-clorobenzoico (MCPBA) utilizando procedimentos análogos aos descritos por Uhlmann et al, *J. Organic Chem.*, 1997, 62, 9177-9181 e Begtrup et al, *Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1* (3) 1995, 243-247, respectivamente. Além disso, procedimentos representativos que ilustram métodos de preparação de certos compostos da Fórmula 1i em que R^{14} é um grupo carbonila opcionalmente substituído são descritos em *Chemistry of Heterocyclic Compounds* 1984, 20, 1392-1393. Procedimentos representativos de formação de compostos da Fórmula 1i em que R^{14} é um grupo alquenila são descritos em Taillefer et al, *Chemistry – An European Journal* 2006, 12 (20), 5301-5313.

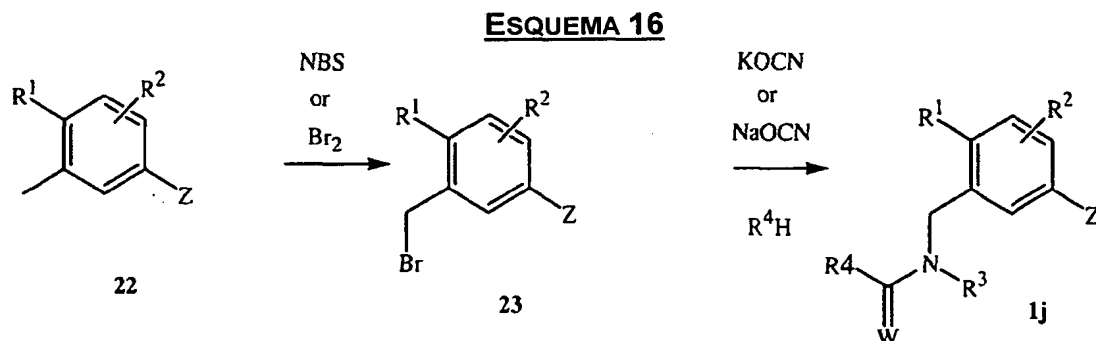
ESQUEMA 15



Conforme exibido no Esquema 16, certos compostos da Fórmula 1j (Fórmula 1 em que Q é CH₂ e V é NR³) em que Z é Z-1 ou Z-7 substituído com R¹⁴ e R¹⁴ é diferente de H podem ser preparados por meio da bromatação de um composto da Fórmula 22 utilizando um agente de bromatação tal como *N*-bromossuccinimida (NBS) ou bromo. Os métodos de bromatação deste tipo são bem documentados na literatura química. Para referências importantes, vide, por exemplo, Song et al, *Synthetic Communications* 2007, 37 (19), 3311-3317; Andrus et al, *Organic Letters* 2007, 9 (23), 4865-4868; *Organic & Biomolecular Chemistry* 2007, 5 (16), 2555-2559; Piazzzi et al, *Journal of Medicinal Chemistry* 2007, 50 (17), 4250-4254; e Zhao et al, *Journal of Agricultural and Food Chemistry* 2007, 55 (14), 5697-5700. Além disso, a Patente Norte-Americana nº 6.313.071 fornece um exemplo relevante para o método de bromatação do Esquema 16. Adicionalmente, a Etapa A do Exemplo 15 ilustra o método de bromatação do Esquema 16.

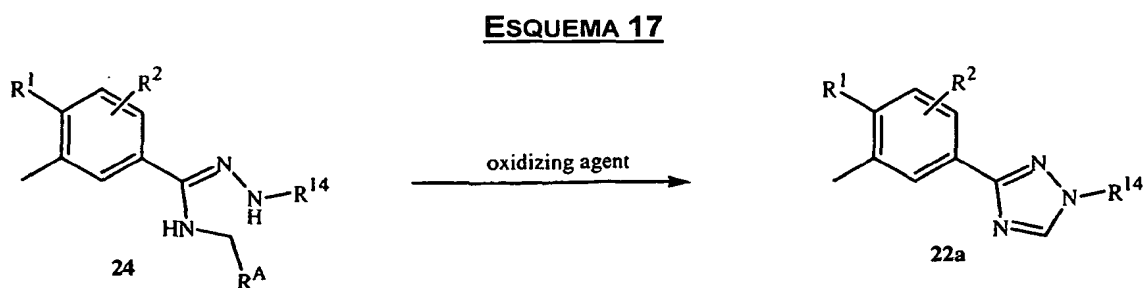
Na segunda etapa, o tratamento do brometo de benzila da Fórmula 23 com cianato de potássio ou cianato de sódio e um composto da Fórmula R⁴H em que R⁴ é um grupo alcóxi ou alquilamino fornece compostos da Fórmula 1j. A reação é tipicamente conduzida em um solvente tal como *N,N*-dimetilformamida sob temperaturas que variam de cerca da temperatura ambiente a 100 °C de acordo com o procedimento descrito na Patente Norte-Americana nº 6.313.071, bem como a Etapa B do Exemplo 15 ilustra o método do Esquema 16.

Em uma etapa subsequente, compostos da Fórmula 1j em que W é O são convertidos nas tioamidas correspondentes 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).



em que R^4 é alcóxi ou alquilamino e Z é Z-1 ou Z-7

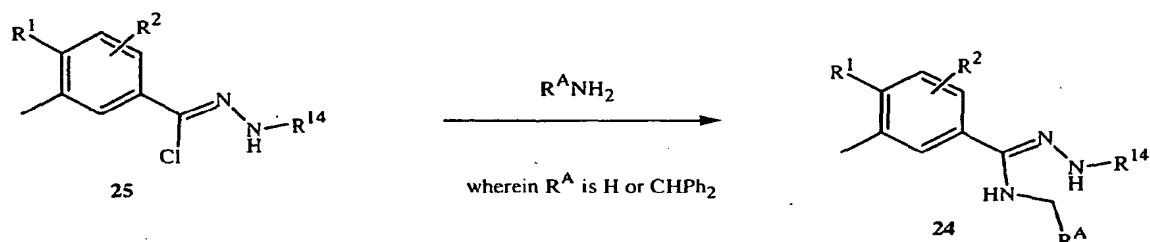
Compostos da Fórmula 22 em que Z é Z-1 são disponíveis comercialmente ou podem ser preparados por meio de métodos conhecidos. Conforme ilustrado no Esquema 17, podem ser preparados compostos da Fórmula 22a (Fórmula 22 em que Z é Z-7) por meio do tratamento de um composto da Fórmula 24 com um agente oxidante tal como peróxido de hidrogênio ou carbonato de prata conforme os procedimentos ensinados por Paulvannan et al, *Tetrahedron* 2000, 56 (41), 8071-8076 e Buzykin et al, *Synthesis* 1993 (1) 59-61.



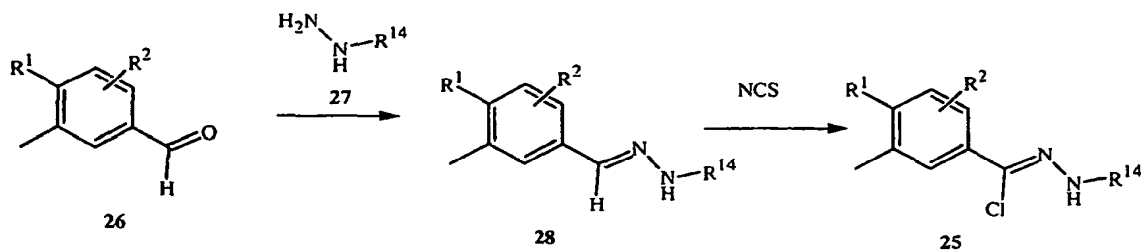
em que R^A é H ou CHPh_2

em que R^{14} é diferente de H

Conforme exibido no Esquema 18, pode-se preparar um composto da Fórmula 24 por meio de reação de um composto da Fórmula 25 com metilamina ou 2,2-difeniletilamina de acordo com o procedimento fornecido em Paulvannan et al, *Tetrahedron* 2000, 56 (41), 8071-8076 e Buzykin et al, *Synthesis* 1993 (1), 59-61.

ESQUEMA 18

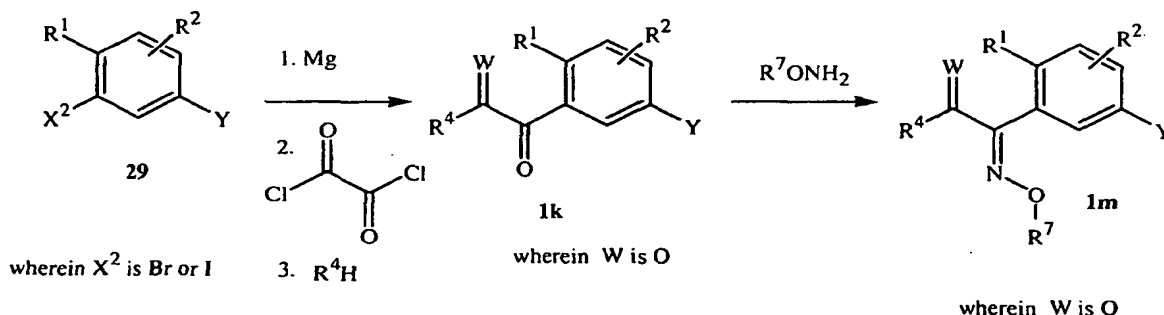
No método do Esquema 19, um composto da Fórmula 25 é preparado por meio da reação em primeiro lugar de um aldeído da Fórmula 26 com uma hidrazina da Fórmula 27 para fornecer o composto intermediário da Fórmula 28. Para referência importante que ensina este método, vide *Tetrahedron* 2000, 56 (41), 8071-8076; Lebedev et al, *J. Organic Chemistry* 2005, 70 (2), 596-602 e Halley et al, *Synthetic Communications* 1997, 27 (7), 1199-1207. Em uma etapa subsequente, o composto da Fórmula 28 é clorado utilizando um agente clorante tal como *N*-clorossuccinimida (NCS). Para referências relevantes para este tipo de cloração, vide Paulvannan et al, *Tetrahedron* 2000, 56 (41), 8071-8076; Patel et al, *Tetrahedron* 1996, 52 (2), 661-668 e Chen et al, *Chemistry Letters* 1998 (2), 285-288. Os compostos da Fórmula 26 podem ser preparados por meio de métodos bem documentados na técnica química e muitos são disponíveis comercialmente.

ESQUEMA 19

Conforme exibido no Esquema 20, certos compostos da Fórmula 1k (Fórmula 1 em que Q é $\text{C}(=\text{O})$ e V é uma união direta), em que W é O podem ser preparados de acordo com o método descrito na Patente Internacional Publicada nº WO 99/28305 e por Walker, *Chimia* 2003, 57 (11),

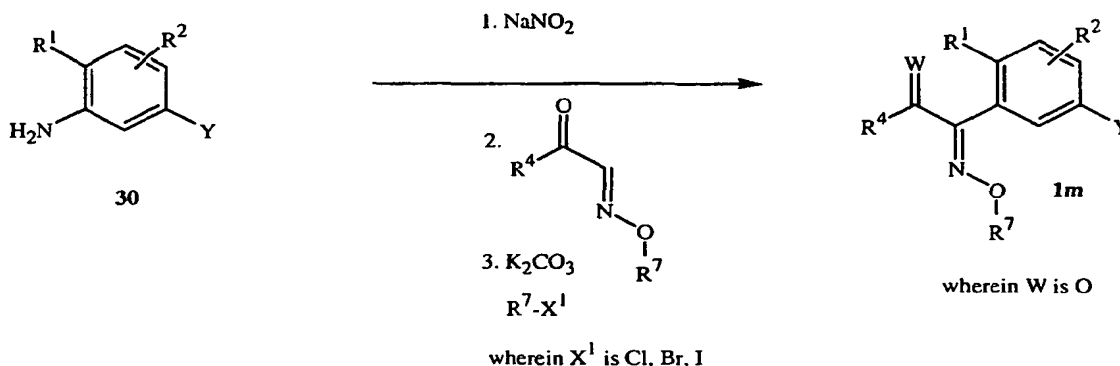
675-679. As condições de reação do método do Esquema 20 de preparação de um composto da Fórmula 1k são também ilustradas na Etapa D do Exemplo 12. Os compostos da Fórmula 1k são intermediários úteis de preparação de certos compostos da Fórmula 1m (Fórmula 1 em que Q é C(=N)-OR⁷ e V é uma união direta) em que W é O. Para referências importantes com relação a este tipo de reação, vide, por exemplo, a Patente Internacional Publicada nº WO 99/28305 e por Walker, *Chimia* 2003, 57 (11), 675-679. Além disso, o método do Esquema 20 de preparação de um composto da Fórmula 1m é ilustrado no Exemplo 13.

10

ESQUEMA 20

Alternativamente, um composto da Fórmula 1m pode também ser preparado conforme exibido no Esquema 21. O método do Esquema 21 é descrito na Patente Internacional Publicada nº WO 99/28305 e por Walker, *Chimia* 2003, 57 (11), 675-679.

15

ESQUEMA 21

Os técnicos no assunto reconhecerão que certos compostos da

Fórmula 1m em que R^4 é um grupo alcóxi podem ser convertidos no composto alquilamino correspondente por meio de tratamento da Fórmula 1m com uma amina da Fórmula R^4NH_2 . Para este tipo de transformação, um ou mais equivalentes da amina (ou seja, R^4NH_2) podem ser utilizados com relação à Fórmula 1m. Alternativamente, pode-se utilizar um equivalente da amina e um extrator ácido (tal como trietilamina). A reação pode ser conduzida com ou sem solvente, incluindo o uso da amina como o solvente, sob temperaturas que variam de cerca da temperatura ambiente ao ponto de ebulição normal do solvente. Os técnicos no assunto compreendem que, quando a amina for utilizada como solvente, ela estará em um grande excesso estequiométrico com relação ao composto da Fórmula 1m (o Exemplo 14 ilustra este método).

Além disso, os técnicos no assunto reconhecerão que os compostos da Fórmula 1m em que W é O podem ser convertidos nas tioamidas correspondentes em que W é S utilizando uma série de reagentes típicos padrão tais como pentassulfeto de fósforo ou 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditiazol-2,4-difosfetano-2,4-dissulfeto (reagente de Lawesson).

Reconhece-se que alguns reagentes e condições de reação descritos acima para a preparação de compostos da Fórmula 1 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, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M., *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 da Fórmula

1. Os técnicos no assunto também reconhecerão que pode ser necessário realizar uma combinação das etapas ilustradas nos esquemas acima em uma ordem diferente da indicada pela sequência específica apresentada para preparar os compostos da Fórmula 1.

5 Os técnicos no assunto também reconhecerão que os compostos da Fórmula 1 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.

10 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
15 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
20 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, "dd" indica par de duplas e "br s" indica isolado amplo.

EXEMPLO 1

25 Preparação de *N*-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)etóxi]imino]etil]fenil]-metil]carbamato de metila:

Uma solução de *N*-[(5-metil-2-clorofenil)metil]acetamida de metila (0,15 g, 0,62 mmol) (preparada de acordo com o método fornecido na Patente

Europeia Publicada nº EP 1586552) e cloridrato de 3-trimetilsililetil-hidroxilamina (0,21 g, 1,2 mmol) em etanol (20 ml) foi aquecida sob refluxo por uma noite. O etanol foi removido em seguida sob pressão reduzida e o óleo residual foi purificado por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão (gradiente de 0 a 100% de acetato de etila em hexanos como eluente) para gerar o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de óleo transparente (0,20 g).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 7,66 (br s, 1H), 7,51 (m, 1H), 7,34 (d, 1H), 5,21 (br s, 1H), 4,46 (d, 2H), 4,28 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,09 (m, 2H), 0,06 (s, 9H).

EXEMPLO 2

Preparação de *N*-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)propóxi]imino]etil]fenil]metil]carbamato de metila

A uma solução de *N*-[(5-acetil-2-clorofenil)metil]acetamida de metila (0,5 g, 2,1 mmol) (preparada de acordo com o método fornecido na Patente Europeia Publicada nº EP 1586552) em etanol (10 ml), adicionou-se uma solução aquosa de hidroxilamina (50% em peso) (0,82 g, 12,4 mmol). A mistura de reação foi aquecida sob refluxo por uma noite e concentrada em seguida para fornecer *N*-[[2-cloro-5-[1-(hidróxi-imino)etil]fenil]metil]carbamato de metila na forma de sólido branco, que foi utilizado sem purificação. A *N,N*-dimetilformamida (5,0 ml), adicionou-se *N*-[[2-cloro-5-[1-(hidróxi-imino)etil]fenil]metil]carbamato de metila (0,28 g, 1,1 mmol), 3-(cloropropil)trimetilsilano (0,33 g, 2,2 mmol) e carbonato de potássio (0,45 g, 3,3 mmol). Esta mistura de reação foi aquecida em seguida a 100 °C por uma noite e concentrada em seguida sob pressão reduzida. O óleo resultante foi purificado por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão (gradiente de 0 a 100% de acetato de etila em hexanos como eluente) para gerar o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de

óleo transparente (0,22 g).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 7,66 (br s, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,35 (m, 1H), 5,18 (m, 1H), 4,46 (d, 2H), 4,14 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,12 (s, 3H), 1,71 (m, 2H), 0,54 (m, 2H), 0,01 (m, 9H).

5

EXEMPLO 3

Preparação de 2-[4-cloro-3'-(trifluorometóxi)[1,1'-bifenil]-3-il]hidrazino carboxilato de metila

Etapa A: preparação de cloridrato de 5-bromo-2-clorofenil-hidrazina

10

Uma suspensão de 5-bromo-2-cloroanilina (23 g, 0,11 mol) em ácido clorídrico concentrado (150 ml) e água (90 ml) foi resfriada em um banho de gelo e sal. Uma solução de nitrito de sódio (8 g, 0,11 mol) em água (50 ml) foi adicionada em gotas à mistura de reação enquanto a temperatura era mantida abaixo de 4 °C. Após agitação por trinta minutos, a suspensão foi transferida por meio de cânula a uma solução de di-hidrato de SnCl_2 em ácido clorídrico concentrado (170 ml) e resfriada a 5 °C. A solução espessa resultante foi agitada por duas horas a 5 °C e o sólido foi isolado por meio de filtragem. O sólido foi seco em ar e adicionalmente seco por meio da adição de clorobutano (500 ml) e refluxo utilizando um condensador Dean-Stark. Após resfriamento, o sólido foi isolado por meio de filtragem para gerar o composto título na forma de sólido esbranquiçado (35,3 g).

15

20

NMR ^1H (CD_3COCD_3) δ 10,25 (br s, 1H), 8,32 (br s, 2H), 7,38 (d, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,16 (dd, 1H).

Etapa B: preparação de 2-(5-bromo-2-clorofenil)hidrazino carboxilato de metila

25

A uma mistura de metil éster de ácido 2-(5-bromo-2-clorofenil)hidrazino carboxílico (ou seja, o produto da Etapa A) (2,1 g, 8 mmol) e cloroformato de metila (1 ml, 13 mmol) em tetra-hidrofuran a 0 °C, adicionou-

se *N,N*-di-isopropiletilamina (4 ml, 24 mmol). A mistura de reação foi mantida em lento aquecimento à temperatura ambiente e agitada por três dias. Adicionou-se acetato de etila e água. As camadas foram separadas e a camada aquosa foi extraída com acetato de etila. As camadas orgânicas combinadas foram lavadas com água e uma solução de cloreto de sódio aquoso saturado e secas. O solvente foi removido sob pressão reduzida para gerar o composto título na forma de sólido amarelo claro (1,4 g).

NMR ^1H (CDCl_3): δ 7,13 (d, 1H), 7,08 (d, 1H), 7,16 (dd, 1H), 6,60 (br s, 1H), 6,23 (br s, 1H), 3,29 (s, 3H).

Etapa C: preparação de 2-[4-cloro-3'-(trifluorometóxi)[1,1'-bifenil]-3-il]hidrazino carboxilato de metila

Uma mistura de 2-(5-bromo-2-clorofenil)hidrazino carboxilato de metila (ou seja, o produto da Etapa B) (1,27 g, 4,5 mmol), ácido [3-(trifluorometóxi)fenil]borônico (1,85 g, 9 mmol), carbonato de cério (2,9 g, 9 mmol), tris(dibenzilidenoacetona)dipaládio (0,18 g, 0,2 mmol) e trifenilfosfina (1,2 g, 4,5 mmol) em tolueno (60 ml) e metanol (60 ml) foi aquecida sob refluxo por 24 horas. Após resfriamento, a mistura de reação foi absorvida em dietil éter e lavada com água. Após secagem sobre sulfato de sódio, o solvente foi removido sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia de flash utilizando acetato de etila a 25% em hexanos como eluente para gerar um material sólido (1,3 g), que foi uma mistura de material de partida e o composto título.

O material sólido foi dissolvido em tolueno (50 ml) e metanol (50 ml) e, em seguida, adicionou-se ácido [3-(trifluorometóxi)fenil]borônico (0,82 g, 4 mmol), carbonato de cério (2,6 g, 8 mmol), tris(dibenzilidenoacetona)dipaládio (0,18 g, 0,2 mmol) e trifenilfosfina (0,52 g, 2 mmol). A mistura de reação foi aquecida sob refluxo por três dias. Após resfriamento, a mistura de reação foi absorvida em dietil éter e lavada com

água. Após secagem sobre sulfato de sódio, o solvente foi removido sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia de flash (gradiente de 75 a 100% de diclorometano em 1-clorobutano como eluente) para gerar um sólido oleoso (0,67 g). O sólido oleoso foi triturado com hexanos para gerar o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido branco (0,475 g) que se funde a 98-100 °C.

NMR ^1H (CDCl_3): δ 7,45 (m, 2H), 7,35 (m, 2H), 7,20 (m, 1H), 7,11 (d, 1H), 7,02 (dd, 1H), 6,55 (br s, 1H), 6,32 (br s, 1H), 3,78 (s, 3H).

EXEMPLO 4

Preparação de *N*-[[2-cloro-5-(1*H*-pirazol-3-il)fenil]metil]carbamato de metila

Etapa A: preparação de *N*-[[2-cloro-5-[3-(dimetilamino)-1-oxo-2-propen-1-il]fenil]metil]carbamato de metila

Uma solução de *N*-[(5-acetil-2-clorofenil)metil]acetamida de metila (3,5 g, 14,5 mmol) (preparada por meio do método fornecido na Patente Europeia Publicada nº EP 1586552) em *N,N*-dimetilformamida dimetil acetal (5,36 g, 43,5 mmol) foi adicionada a tolueno (35 ml). A mistura de reação foi aquecida sob refluxo por uma noite e concentrada em seguida sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi dissolvido em acetato de etila e lavado com água (4x). A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio, filtrada e concentrada para fornecer o produto bruto na forma de óleo (4,14 g), que foi utilizado sem purificação adicional.

Etapa B: preparação de *N*-[[2-cloro-5-(1*H*-pirazol-3-il)fenil]metil]carbamato de metila

A uma solução de *N*-[[2-cloro-5-[3-(dimetilamino)-1-oxo-2-propen-1-il]fenil]metil]carbamato de metila (ou seja, o produto da Etapa A) (4,14 g, 13,9 mmol) em metanol (80 ml), adicionou-se hidrato de hidrazina (0,771 g, 15,4 mmol). A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por dois dias. A

mistura de reação foi filtrada e o sólido recolhido foi seco sob pressão reduzida para fornecer o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido (3,26 g).

NMR ^1H (DMSO- d_6) δ 12,95 (br s, 1H), 7,80 (d, 2H), 7,70 (m, 1H),
 5 7,44 (d, 1H), 6,69 (m, 1H), 4,30 (d, 2H), 3,58 (s, 3H).

EXEMPLO 5

Preparação de *N*-[[2-cloro-5-[1-(4-clorofenil)-1*H*-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila:

A uma mistura de *N*-[[2-cloro-5-(1*H*-pirazol-3-il)fenil]metil]carbamato de metila (ou seja, o produto da Etapa B, Exemplo 4)
 10 (0,2 g, 0,75 mmol), *trans*-*N,N'*-dimetilciclo-hexano-1,2-diamina (0,043 g, 0,3 mmol), iodeto de cobre (I) (0,03 g, 0,15 mmol) e carbonato de potássio (-325 mesh) (0,622 g, 4,5 mmol) em dioxano (4 ml), adicionou-se 1-cloro-4-iodobenzeno (0,27 g, 1,13 mmol). A mistura de reação foi aquecida sob refluxo
 15 por uma noite e concentrada em seguida sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi purificado por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão (gradiente de 0 a 100% de acetato de etila em hexanos como eluente) para fornecer o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido (0,156 g) que se funde a 151-153 °C.

20 NMR ^1H (CDCl₃) δ 7,92 (m, 2H), 7,77 (m, 1H), 7,71 (m, 2H), 7,43 (m, 3H), 6,76 (d, 1H), 5,21 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).

EXEMPLO 6

Preparação de *N*-[[2-cloro-5-[1-[[3-(trifluorometóxi)fenil]metil]-1*H*-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila

25 Uma mistura de *N*-[[2-cloro-5-(1*H*-pirazol-3-il)fenil]metil]carbamato de metila (ou seja, o produto da Etapa B, Exemplo 4) (0,2 g, 0,75 mmol), 1-(bromometil)-3-(trifluorometóxi)benzeno (0,765 g, 3,0 mmol) e carbonato de potássio (-325 mesh, 0,829 g, 6,0 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (4 ml) foi

aquecida a 100 °C por uma noite e concentrada em seguida sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi purificado por meio de cromatografia de líquidos de média pressão (gradiente de 0 a 100% de acetato em hexanos como eluente) para fornecer o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido (0,178 g).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 7,92 (m, 2H), 7,81 (s, 1H), 7,67 (m, 1H), 7,39 (m, 3H), 7,15 (t, 2H), 7,08 (s, 1H), 6,59 (d, 1H), 5,36 (s, 2H), 5,20 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,69 (s, 3H).

EXEMPLO 7

Preparação de *N*-[[2-cloro-5-[2-(4-metilfenil)-4-pirimidinil]fenil]metil]carbamato de metila

A uma mistura de *N*-[[2-cloro-5-[3-(dimetilamino)-1-oxo-2-propen-1-il]fenil]metil]carbamato de metila (ou seja, o produto da Etapa A, Exemplo 4) (0,43 g, 1,44 mmol), cloridrato de 4-metilbenzamidina (0,74 g, 4,33 mmol) e hidreto de sódio (0,14 g, 5,8 mmol) a 0 °C, adicionou-se lentamente metanol (5 ml). A mistura de reação foi aquecida sob refluxo por uma noite. Uma solução de cloreto de amônio saturado foi adicionada à mistura de reação e a mistura foi concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi dissolvido em acetato de etila, lavado com carbonato de sódio aquoso saturado, seco sobre sulfato de magnésio, filtrado e concentrado sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi purificado por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão (gradiente de 0 a 100% de acetato de etila em hexanos como eluente) para fornecer o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido (0,160 g).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 7,92 (m, 2H), 8,81 (d, 1H), 8,44 (d, 2H), 8,21 (br s, 1H), 7,15 (t, 2H), 7,08 (s, 1H), 6,59 (d, 1H), 5,36 (s, 2H), 5,20 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,69 (s, 3H).

EXEMPLO 8

Preparação de *N*-[[2-cloro-5-[1-[3-(1-metiletil)-1,2,4-tiadiazol-5-il]-1*H*-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila

Etapa A: preparação de 5-cloro-3-(1-metiletil)-1,2,4-tiadiazol

5 A uma mistura de propanimido cloridrato de 2-metila (5,0 g, 40,8 mmol), cloreto de triclorometanossulfenila (7,14 g, 38,4 mmol) em cloreto de metileno (200 ml) a 0 °C, adicionou-se em gotas uma solução aquosa de hidróxido de sódio (50%, 9,9 ml) ao longo de vinte minutos. A mistura de reação foi agitada por duas horas a 0 °C e, em seguida, foi mantida em
10 aquecimento à temperatura ambiente e agitada por três horas adicionais. Adicionou-se gelo à mistura de reação, a mistura foi separada e a camada aquosa foi extraída com cloreto de metileno (3 x 25 ml). Os extratos orgânicos combinados foram secos sobre sulfato de magnésio, filtrados e concentrados sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi purificado por meio de
15 cromatografia de líquidos sob pressão média (gradiente de 0 a 100% de acetato de etila em hexanos como eluente) para fornecer o composto título na forma de óleo (3,8 g).

Etapa B: preparação de *N*-[[2-cloro-5-[1-[3-(1-metiletil)-1,2,4-tiadiazol-5-il]-1*H*-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila

20 Uma mistura de *N*-[[2-cloro-5-(1*H*-pirazol-3-il)fenil]metil]carbamato de metila (ou seja, o produto da Etapa B, Exemplo 4) (0,02 g, 0,075 mmol), 5-cloro-3-(1-metiletil)-1,2,4-tiadiazol (ou seja, o produto da Etapa A) (0,61 g, 3,75 mmol) e carbonato de potássio (0,25 g, 1,5 mmol) em *N*-metil-2-pirrolidinona (2,5 ml) foi aquecida em um aparelho de micro-ondas Biotage Creator XM a
25 165 °C por quinze minutos. A mistura de reação foi despejada em água (60 ml) e a mistura aquosa foi extraída com acetato de etila (2 x 50 ml). Os extratos orgânicos combinados foram lavados com água, secos sobre sulfato de magnésio, filtrados e concentrados sob pressão reduzida. O resíduo resultante

foi purificado por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão (gradiente de 0 a 100% de acetato de etila em hexanos como eluente) para fornecer o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido (0,5 g).

5 NMR ^1H (DMSO- d_6) δ 8,22 (d, 1H), 7,79 (s, 2H), 7,63 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,74 (d, 1H), 5,42 (br s, 2H), 4,42 (d, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,18 (m, 1H), 1,37 (d, 6H). **EXEMPLO 9**

Preparação de *N*-[[2-cloro-5-(1*H*-1,2,3-triazol-5-il)fenil]metil]carbamato de metila

10 Etapa A: preparação de 2-(bromometil)-1-cloro-4-iodobenzeno

A uma mistura de 2-cloro-5-iodotolueno (4,07 g, 16,12 mmol), *N*-bromossuccinimida (3,16 g, 17,73 mmol) em diclorometano (258 ml) e água (258 ml), adicionou-se azodi-isobutironitrila (0,132 g, 0,81 mmol). A mistura de reação foi irradiada com uma lâmpada solar de halogênio (150 Watts) por duas
15 horas e resfriada em seguida à temperatura ambiente. A mistura de reação de duas fases foi separada e a camada aquosa foi extraída com diclorometano (50 ml). As camadas orgânicas combinadas foram lavadas com água (2 x 150 ml), secas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas sob pressão reduzida para fornecer o composto título na forma de óleo laranja (5,20 g).

20 NMR ^1H (CDCl $_3$) δ 7,76 (d, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,11 (d, 1H), 4,49 (s, 2H).

Etapa B: preparação de [(2-cloro-5-iodofenil)metil]carbamato de metila

A uma mistura de carbonato de potássio (4,30 g, 53,3 mmol) em
25 *N,N*-dimetilformamida (47 ml) e metanol (5 ml) a 50 °C, adicionou-se uma solução de 2-(bromometil)-1-cloro-4-iodobenzeno (ou seja, o produto da Etapa A) (5,20 g, 15,7 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (10 ml). A mistura de reação foi aquecida a 110 °C por uma hora e resfriada em seguida à temperatura

ambiente. A mistura de reação foi repartida entre dietil éter (200 ml) e água (200 ml), a camada orgânica foi separada, lavada com água (3 x 50 ml), seca sobre sulfato de magnésio, filtrada e concentrada sob pressão reduzida para fornecer o composto título na forma de óleo amarelo (4,32 g).

5 NMR ^1H (CDCl_3): δ 7,58 (d aparente, 1H), 7,79 (s, 2H), 7,10-7,03 (m, 2H), 5,18 (br s, 1H), 4,40 (d, 2H), 3,71 (s, 3H).

Etapa C: preparação de *N*-[[2-cloro-5-[2-(trimetilsilil)etinil]fenil]metil]carbamato de metila

Uma mistura de [(2-cloro-5-iodofenil)metil]carbamato de metila (ou
10 seja, o produto da Etapa B) (3,0 g, 9,2 mmol), etiniltrimetilsilano (1,94 ml, 13,8 mmol), dicloreto de bis(trifenilfosfino)paládio (II) (0,032 g, 0,05 mmol), iodeto de cobre (I) (0,018 g, 0,09 mmol), trifenilfosfina (0,024 g, 0,09 mmol) em tetra-
hidrofuran (18 ml) e trietilamina (18 ml) foi agitada à temperatura ambiente por trinta minutos. A mistura de reação foi concentrada sobre sílica gel (7 g) e
15 purificada em seguida por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão (gradiente de 0 a 25% de acetato de etila em hexanos como eluente) para fornecer o composto título na forma de óleo (1,37 g).

NMR ^1H (CDCl_3): δ 7,47 (d, 1H), 7,33-7,22 (m, 2H), 5,16 (br s, 1H), 4,41 (d, 2H), 3,69 (s, 3H), 0,24 (s, 9H).

20 Etapa D: preparação de *N*-[(2-cloro-5-etinilfenil)metil]carbamato de metila

A uma solução de *N*-[[2-cloro-5-[2-(trimetilsilil)etinil]fenil]metil]carbamato de metila (ou seja, o produto da Etapa C) (1,37 g, 4,6 mmol) em metanol (28 ml), adicionou-se hidróxido de potássio (2,3
25 ml, 1M em metanol). A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por dezoito horas e concentrada em seguida. O resíduo resultante foi repartido entre acetato de etila e água, a camada orgânica foi separada, lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio, filtrada e concentrada sob pressão

reduzida para fornecer o composto título na forma de óleo marrom (0,90 g).

NMR ^1H (CDCl_3): δ 7,52 (br s, 1H), 7,38-7,30 (m, 2H), 5,15 (br s, 1H), 4,42 (br d, 2H), 3,70 (s, 3H), 3,11 (s, 1H).

5 Etapa E: preparação de *N*-[[2-cloro-5-(1*H*-1,2,3-triazol-5-il)fenil]metil]carbamato de metila

A uma solução de *N*-[(2-cloro-5-etinilfenil)metil]carbamato de metila (ou seja, o produto da Etapa D) (0,43 g, 1,92 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (3,9 ml) e metanol (0,4 ml), adicionou-se trimetilsilil azida (0,38 ml, 2,89 mmol) e iodeto de cobre (I) (0,019 g, 0,1 mmol). A mistura de
10 reação foi aquecida em um aparelho de micro-ondas CEM Discover a 100 °C por oito horas e mantida em resfriamento em seguida à temperatura ambiente. A mistura de reação foi repartida entre acetato de etila e cloreto de sódio aquoso, as camadas foram separadas e a camada aquosa foi extraída com acetato de etila (2x). As camadas orgânicas combinadas foram lavadas com
15 água (3x), secas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas sob pressão reduzida para fornecer o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido marrom (0,30 g).

NMR ^1H (CDCl_3): δ 7,94 (s, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,70 (d, 1H), 7,42 (d, 1H), 5,28 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 3,71 (s, 3H).

20

EXEMPLO 10

Preparação de *N*-[[2-cloro-5-[2-(4-clorofenil)-2*H*-1,2,3-triazol-4-il]fenil]metil]carbamato de metila e *N*-[[2-cloro-5-[1-(4-clorofenil)-1*H*-1,2,3-triazol-4-il]fenil]metil]carbamato de metila

Uma mistura de *N*-[[2-cloro-5-(1*H*-1,2,3-triazol-5-il)fenil]metil]carbamato de metila (ou seja, o produto da Etapa E, Exemplo 9)
25 (0,53 g, 2,0 mmol), 1-cloro-4-iodobenzeno (0,57 g, 2,4 mmol), acetilacetato de ferro (III) (0,21 g, 0,6 mmol), óxido de cobre (II) (0,016 g, 0,2 mmol) e carbonato de cério (1,29 g, 4,0 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (4 ml) foi

aquecida a 110 °C por quatorze horas e concentrada em seguida sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi suspenso em etanol e concentrado em seguida sobre sílica gel (2 g). A mistura de sílica gel foi purificada por meio de cromatografia de coluna de flash utilizando um tubo Supelco (divisão da Sigma-Aldrich Co., 595 North Harrison Road, Bellefonte PA 16823, Estados Unidos) previamente embalado com 10 g de sílica gel (diâmetro de partícula de 50 µm, tamanho de poros de 70 Å) e 3:1 hexanos-acetato de etila como eluente para fornecer *N*-[[2-cloro-5-[2-(4-clorofenil)-2*H*-1,2,3-triazol-4-il]fenil]metil]carbamato de metila, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido bege (0,105 g).

NMR ¹H (CDCl₃) δ 8,08 (d, 2H), 8,04 (s, 1H), 7,96 (br s, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,48-7,44 (m, 3H), 5,25 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,71 (s, 3H).

Também foi obtido *N*-[[2-cloro-5-[1-(4-clorofenil)-1*H*-1,2,3-triazol-4-il]fenil]metil]carbamato de metila, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de óleo marrom (0,10 g).

NMR ¹H (CDCl₃) δ 8,20 (s, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,74 (d, 2H), 7,53 (d, 2H), 5,24 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).

EXEMPLO 11

Preparação de *N*-[[2-cloro-5-[2-[(4-metilfenil)metil-2*H*-1,2,3-triazol-4-il]fenil]metil]carbamato de metila e *N*-[[2-cloro-5-[1-[(4-metilfenil)metil-2*H*-1,2,3-triazol-4-il]fenil]metil]carbamato de metila

Uma mistura de *N*-[[2-cloro-5-(1*H*-1,2,3-triazol-5-il)fenil]metil]carbamato de metila (ou seja, o produto da Etapa E, Exemplo 9) (0,24 g, 0,9 mmol), brometo de 4-metilbenzila (0,17 g, 1,1 mmol) e carbonato de potássio (0,25 g, 1,8 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (4,5 ml) foi aquecida a 100 °C por 24 horas. A mistura de reação foi mantida em resfriamento e repartida em seguida entre dietil éter (50 ml) e água (30 ml). A camada orgânica foi separada, lavada com água (3x), seca sobre sulfato de magnésio,

filtrada e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi dissolvido em acetato de etila e etanol (mistura 2:1), concentrado sobre sílica gel e purificado em seguida por meio de cromatografia de coluna de flash utilizando 5 g de sílica gel (gradiente de 0 a 50% de acetato de etila em hexanos como eluente) para fornecer *N*-[[2-cloro-5-[2-[(4-metilfenil)metil-2*H*-1,2,3-triazol-4-il]fenil]metil]carbamato de metila, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de óleo incolor (0,11 g).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 7,82 (s, 1H), 7,79 (br s, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,24 (d, 2H), 7,13 (d, 2H), 5,56 (s, 2H), 5,23 (br s, 1H), 4,48 (d, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,32 (s, 3H).

Também foi obtido *N*-[[2-cloro-5-[1-[(4-metilfenil)metil-2*H*-1,2,3-triazol-4-il]fenil]metil]carbamato de metila, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de óleo incolor (0,10 g).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 7,77 (s, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,65 (s, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,21 (s, 4H), 5,52 (s, 2H), 5,21 (br s, 3H), 4,41 (d, 2H), 3,67 (2, 3H), 2,36 (s, 3H).

EXEMPLO 12

Preparação de 2-metil- α -oxo-5-[1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-3-il]benzenoacetato de metila

Etapa A: preparação de 1-(3-bromo-4-metil)-3-(dimetilamino)-2-propen-1-ona

Uma solução de 3'-bromo-4'-metilacetofenona (15 g, 70,4 mmol) em *N,N*-dimetilformamida dimetil acetal (130 ml, 985 mmol) foi aquecida sob refluxo por uma noite. A mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente e concentrada sob pressão reduzida. O óleo resultante (20,2 g) foi cristalizado a partir de hexanos para obter o composto título na forma de sólido amarelo (15,97 g).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 8,0 (s, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,2 (d,

1H), 5,6 (d, 1H), 3,1 (br s, 3H), 2,9 (br s, 3H).

Etapa B: preparação de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1*H*-pirazol:

A uma solução de 1-(3-bromo-4-metil)-3-(dimetilamino)-2-propen-1-ona (ou seja, o produto da Etapa A) (15,97 g, 59,57 mmol) em etanol (150 ml), adicionou-se mono-hidrato de hidrazina (14,4 ml, 299 mmol). A mistura de reação foi aquecida sob refluxo por duas horas, resfriada à temperatura ambiente e concentrada sob pressão reduzida. O sólido resultante foi diluído com hexanos e filtrado para fornecer o composto título na forma de sólido branco (13,95 g).

NMR ¹H (CDCl₃) δ 7,9 (s, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,6 (d, 1H), 7,2 (d, 1H), 6,5 (d, 1H), 2,41 (s, 3H).

Etapa C: preparação de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol

A uma solução agitada de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1*H*-pirazol (ou seja, o produto da Etapa B) (5,0 g, 21,09 mmol) em *p*-dioxano (19 ml) sob atmosfera de nitrogênio, adicionou-se 3-iodobenzotrifluoreto (5,75 g, 21,11 mmol), iodeto de cobre (I) (0,05 g, 0,262 mmol), *trans*-1,2-diaminociclo-hexano (253,5 µl, 2,10 mmol) e carbonato de potássio (6,1 g, 44,14 mmol). A mistura de reação foi aquecida a 100 °C por uma noite, resfriada à temperatura ambiente e diluída com água e acetato de etila. A mistura resultante foi separada e a camada aquosa foi extraída com acetato de etila (3x). As camadas orgânicas combinadas foram lavadas com ácido clorídrico (1N), cloreto de sódio aquoso saturado, secas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas sob pressão reduzida para fornecer um sólido (9 g). Hexanos foram adicionados ao sólido e a mistura foi filtrada para obter o composto título na forma de sólido (6,4 g).

NMR ¹H (CDCl₃) δ 8,08 (s, 1H), 8,0 (s, 2H), 7,99 (s, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,6-7,5 (m, 2H), 7,3 (d, 1H), 6,7 (d, 1H), 2,4 (s, 3H).

Etapa D: preparação de 2-metil- α -oxo-5-[1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-3-il]benzenoacetato de metila

A uma mistura de aparas de magnésio (0,17 g, 6,98 mmol) e 1,2-dibromoetano (duas gotas) em tetra-hidrofuran (0,5 ml) sob atmosfera de nitrogênio, adicionou-se em gotas uma solução de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol (ou seja, o produto da Etapa C) (2,0 g, 5,25 mmol) em tetra-hidrofuran (3,5 ml). Após a adição de cerca de 2% do volume total da solução de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol, a adição foi suspensa e agregou-se iodo (quantidade catalítica) à mistura de reação. A solução de 3-(3-bromo-4-metilfenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol restante foi adicionada em seguida à mistura de reação por uma hora mediante aquecimento sob refluxo. O aquecimento prosseguiu por 45 minutos adicionais e, em seguida, a mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente. A mistura de reação foi adicionada por meio de um funil de adição a uma solução de cloreto de oxalila (0,508 ml, 5,82 mmol) em tetra-hidrofuran (6 ml) a -65 °C. A agitação prosseguiu por duas horas a -65 °C e, em seguida, adicionou-se metanol (1,17 ml) à mistura de reação e a mistura foi mantida em aquecimento à temperatura ambiente e agitada por duas horas. A mistura de reação foi diluída com cloreto de amônio aquoso saturado (4 ml) e água (8 ml) e extraída em seguida com acetato de etila (2x). As camadas orgânicas combinadas foram lavadas com cloreto de sódio aquoso saturado, secas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas sob pressão reduzida para gerar um óleo. O óleo foi purificado por meio de cromatografia de líquidos de média pressão (gradiente de 0 a 20% de acetato de etila em hexanos como eluente) para fornecer um óleo (0,31 g). O óleo foi cristalizado a partir de hexanos e dietil éter para fornecer o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na

forma de sólido (200 mg).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 8,2 (s, 1H), 8,1-8,0 (m, 3H), 7,9 (d, 1H), 7,6-7,5 (m, 2H), 7,4 (d, 1H), 6,8 (d, 1H), 4,0 (s, 3H), 2,6 (s, 3H).

EXEMPLO 13

5 Preparação de metil α -(metóxi-imino)-2-metil-5-[1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-3-il]benzenoacetamida

Uma mistura de 2-metil- α -oxo-5-[1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-3-il]benzenoacetato de metila (ou seja, o produto da Etapa D, Exemplo 12) (0,184 g, 0,475 mmol) e cloridrato de *O*-metil-hidroxilamina
 10 (0,048 g, 0,57 mmol) em metanol (2 ml) sob atmosfera de nitrogênio foi aquecida até refluxo por uma noite. A mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente, diluída com água e diclorometano, as camadas foram separadas e a camada aquosa foi extraída com diclorometano. As camadas orgânicas combinadas foram lavadas com cloreto de sódio
 15 aquoso saturado, secas sobre sulfato de magnésio, filtradas e concentradas sob pressão reduzida para gerar um sólido (0,21 g). O sólido foi purificado por meio de cromatografia de coluna de flash utilizando um tubo Bond Elute® (fabricado pela Varian) previamente embalado com 5 g de sílica gel (diâmetro de partícula de 50 μm , tamanho de poro de 70 Å) e
 20 gradiente de 0 a 20% de acetato de etila em hexanos como eluente para fornecer um sólido (180 mg). Hexanos e dietil éter foram adicionados ao sólido e a mistura foi filtrada para fornecer o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de um sólido branco (120 mg).

25 NMR ^1H (CDCl_3) δ 8,0 (s, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,6-7,5 (m, 2H), 7,3 (d, 1H), 6,7 (d, 1H), 4,07 (s, 3H), 3,89 (s, 3H), 2,23 (s, 3H).

EXEMPLO 14

Preparação de α -(metóxi-imino)-*N*,2-metil-5-[1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-3-il]benzenoacetamida

A uma solução de metil α -(metóxi-imino)-2-metil-5-[1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-3-il]benzenoacetamida (ou seja, o produto do Exemplo 13) (0,062 g, 0,149 mmol) em tetra-hidrofuran (2 ml) sob atmosfera de nitrogênio, adicionou-se metilamina (33% em peso em etanol). A mistura de reação foi agitada por uma noite à temperatura ambiente e, em seguida, concentrada sob pressão reduzida para deixar um sólido. Hexanos e dietil éter foram adicionados ao sólido e a mistura foi filtrada para obter o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido branco (56 mg).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 8,0 (s, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,9 (d, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,6-7,5 (m, 2H), 7,3 (d, 1H), 7,3 (d, 1H), 6,7 (d, 1H), 3,89 (s, 3H), 2,9 (d, 3H), 2,2 (s, 3H).

15

EXEMPLO 15

Preparação de *N*-[[2-cloro-5-[3-(4-clorofenil)-1*H*-pirazol-1-il]fenil]metil]carbamato de metila

EtapA A: 1-(3-metil-4-clorofenil)-3-(3-clorofenil)-1*H*-pirazol

Uma mistura de 3-(3-clorofenil)-1*H*-pirazol (5,3 g, 29,8 mmol) (preparada de acordo com o método fornecido na Patente Europeia Publicada nº EP 538156), salicilaldoxima (0,58 g, 4,25 mmol), 5-bromo-2-clorotolueno (2,8 g, 21,3 mmol), óxido de cobre (0,15 g, 1,06 mmol) e carbonato de cério (11,8 g, 36,2 mmol) em 20 ml de *N,N*-dimetilformamida foi aquecida a 140 °C por uma noite e mantida em resfriamento à temperatura ambiente em seguida. A suspensão resultante foi filtrada e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi purificado por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão (gradiente de 2 a 10% de acetato de etila em hexanos como eluente) para

25

gerar o composto título na forma de sólido branco (1,4 g).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 7,92-7,30 (m, 8H), 6,78 (s, 1H), 2,46 (s, 3H).

5 Etapa B: preparação de 1-(3-bromometil-4-clorofenil)-3-(3-clorofenil)-1*H*-pirazol

Uma mistura de 1-(3-metil-4-clorofenil)-3-(3-clorofenil)-1*H*-pirazol (ou seja, o produto da Etapa A) (1,7 g, 5,61 mmol), *N*-bromossuccinimida (1,1 g, 6,17 mmol) e peróxido de benzoíla (30 mg, 0,12 mmol) em 100 ml de tetracloreto de carbono foi irradiada com uma
10 lâmpada solar por quatro horas. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo foi purificado por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão (gradiente de 10 a 20% de acetato de etila em hexanos como eluente) para gerar o composto título na forma de sólido branco (0,37 g).

15 NMR ^1H (CDCl_3): δ 7,98-7,30 (m, 8H), 6,79 (s, 1H), 4,65 (s, 2H).

Etapa C: preparação de *N*-[[2-cloro-5-[3-(4-clorofenil)-1*H*-pirazol-1-il]fenil]metil]carbamato de metila

Uma mistura de 1-(3-bromometil-4-clorofenil)-3-(3-clorofenil)-
20 1*H*-pirazol (ou seja, o produto da Etapa B) (0,37 g, 0,97 mmol) e cianato de potássio (0,16 g, 1,94 mmol) em 3 ml de metanol e 6 ml de *N,N*-dimetilformamida foi aquecida a 100 °C por quatro horas. Após resfriamento, o solvente foi removido sob pressão reduzida e o resíduo foi purificado por meio de cromatografia de líquidos sob média pressão
25 (gradiente de 20 a 40% de acetato de etila em hexanos como eluente) para gerar o composto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido marrom (0,24 g) que se funde a 127-130 °C.

NMR ^1H (CDCl_3): δ 7,98-7,30 (m, 8H), 6,78 (s, 1H), 5,25 (m,

1H), 4,53 (d, 2H), 3,72 (s, 3H).

Por meio dos procedimentos descritos no presente, junto com métodos conhecidos na técnica, podem ser preparados os compostos das Tabelas 1 a 10 a seguir. São utilizadas as abreviações abaixo nas Tabelas que se seguem: *i* indica iso, *c* indica ciclo, *n* indica normal, *s* indica secundário, *t* indica terciário, Ac indica acetila, Me indica metila, Et indica etila, Pr indica propila, OMe indica metóxi, CN indica ciano e Ph indica fenila. Os substituintes sobre benzila são ligados ao anel fenila do benzila e os números de localização dos substituintes referem-se à posição fenila unida ao componente metileno de benzila. Nas Tabelas 1 a 3, a extremidade esquerda das porções relacionadas para V^1 é unida a O e a extremidade direita é unida a Si nas estruturas moleculares ilustradas. Nas Tabelas 1 a 3, V^a a V^h possuem os significados a seguir, conforme definido abaixo na Ilustração 4.

ILUSTRAÇÃO 4

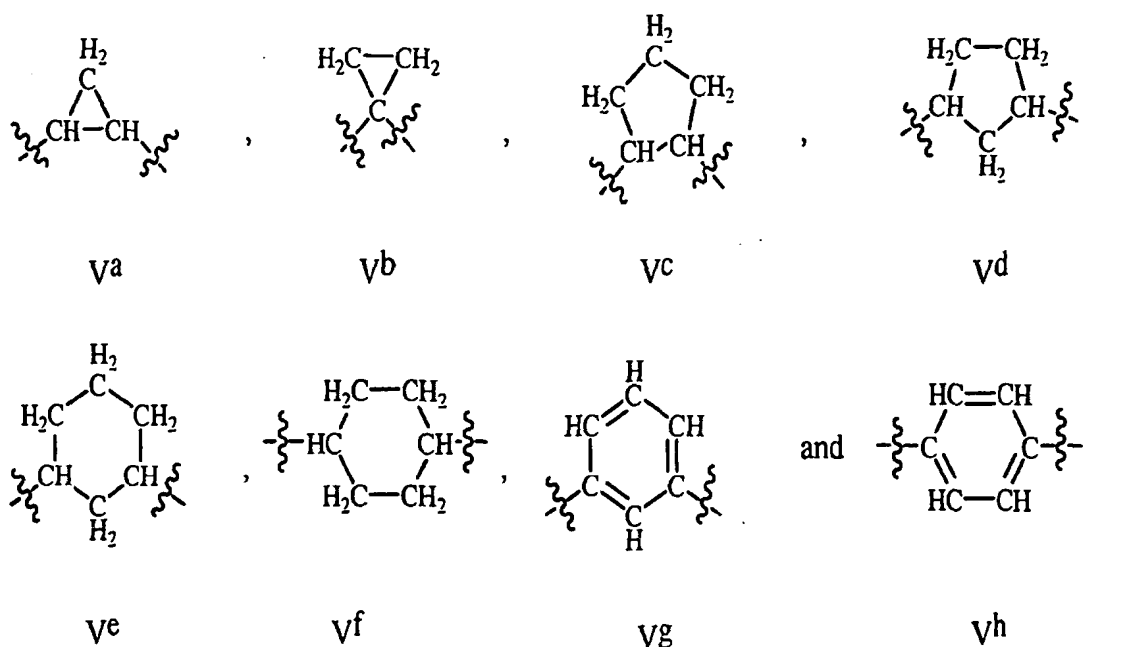
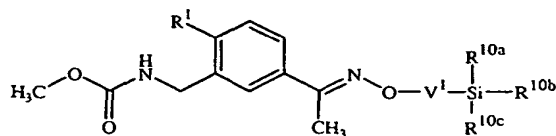


TABELA 1



R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me
R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Me	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Me	F	-CH(CN)-	Me	Me	Me
Cl	v^a	Me	Me	Me	F	v^a	Me	Me	Me
Cl	v^b	Me	Me	Me	F	v^b	Me	Me	Me
Cl	v^c	Me	Me	Me	F	v^c	Me	Me	Me
Cl	v^d	Me	Me	Me	F	v^d	Me	Me	Me
Cl	v^e	Me	Me	Me	F	v^e	Me	Me	Me
Cl	v^f	Me	Me	Me	F	v^f	Me	Me	Me
Cl	v^g	Me	Me	Me	F	v^g	Me	Me	Me
Cl	v^h	Me	Me	Me	F	v^h	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me

<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Et	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Et	F	-CH(CN)-	Me	Me	Et
Cl	v ^a	Me	Me	Et	F	v ^a	Me	Me	Et
Cl	v ^b	Me	Me	Et	F	v ^b	Me	Me	Et
Cl	v ^c	Me	Me	Et	F	v ^c	Me	Me	Et

<u>R^l</u>	<u>V^l</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R^l</u>	<u>V^l</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	V ^d	Me	Me	Et	F	V ^d	Me	Me	Et
Cl	V ^e	Me	Me	Et	F	V ^e	Me	Me	Et
Cl	V ^f	Me	Me	Et	F	V ^f	Me	Me	Et
Cl	V ^g	Me	Me	Et	F	V ^g	Me	Me	Et
Cl	V ^h	Me	Me	Et	F	V ^h	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(OMe)-	Me	Et	Et	F	-CH(OMe)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et	F	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et

R^I	V^I	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^I	V^I	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et
Cl	-CH(CN)-	Me	Et	Et	F	-CH(CN)-	Me	Et	Et
Cl	v^a	Me	Et	Et	F	v^a	Me	Et	Et
Cl	v^b	Me	Et	Et	F	v^b	Me	Et	Et
Cl	v^c	Me	Et	Et	F	v^c	Me	Et	Et
Cl	v^d	Me	Et	Et	F	v^d	Me	Et	Et
Cl	v^e	Me	Et	Et	F	v^e	Me	Et	Et
Cl	v^f	Me	Et	Et	F	v^f	Me	Et	Et
Cl	v^g	Me	Et	Et	F	v^g	Me	Et	Et
Cl	v^h	Me	Et	Et	F	v^h	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(OMe)-	Et	Et	Et	F	-CH(OMe)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et

R ¹	V ¹	R ^{10a}	R ^{10b}	R ^{10c}	R ¹	V ¹	R ^{10a}	R ^{10b}	R ^{10c}
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et	F	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et
Cl	-CH(CN)-	Et	Et	Et	F	-CH(CN)-	Et	Et	Et
Cl	v ^a	Et	Et	Et	F	v ^a	Et	Et	Et
Cl	v ^b	Et	Et	Et	F	v ^b	Et	Et	Et
Cl	v ^c	Et	Et	Et	F	v ^c	Et	Et	Et
Cl	v ^d	Et	Et	Et	F	v ^d	Et	Et	Et
Cl	v ^e	Et	Et	Et	F	v ^e	Et	Et	Et
Cl	v ^f	Et	Et	Et	F	v ^f	Et	Et	Et
Cl	v ^g	Et	Et	Et	F	v ^g	Et	Et	Et
Cl	v ^h	Et	Et	Et	F	v ^h	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CN)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^a	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^a	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^b	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^b	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^c	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^c	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^d	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^d	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^e	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^e	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^f	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^f	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^g	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^g	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^h	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^h	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr

<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CN)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^a	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^a	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^b	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^b	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^c	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^c	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^d	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^d	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^e	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^e	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^f	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^f	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^g	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^g	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^h	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^h	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	Ph

R^I	V^I	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^I	V^I	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	Ph
Cl	v^a	Me	Me	Ph	F	v^a	Me	Me	Ph
Cl	v^b	Me	Me	Ph	F	v^b	Me	Me	Ph
Cl	v^c	Me	Me	Ph	F	v^c	Me	Me	Ph
Cl	v^d	Me	Me	Ph	F	v^d	Me	Me	Ph
Cl	v^e	Me	Me	Ph	F	v^e	Me	Me	Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	v ^f	Me	Me	Ph	F	v ^f	Me	Me	Ph
Cl	v ^g	Me	Me	Ph	F	v ^g	Me	Me	Ph
Cl	v ^h	Me	Me	Ph	F	v ^h	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^a	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^b	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^b	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^c	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^c	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^d	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^e	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^e	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^f	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^g	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^g	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^h	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^a	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^b	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^c	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^d	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^e	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^f	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^g	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^h	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^a	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^b	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^c	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^d	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^e	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^f	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^g	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^h	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Me	c-Pr
Cl	V^a	Me	Me	c-Pr	F	V^a	Me	Me	c-Pr
Cl	V^b	Me	Me	c-Pr	F	V^b	Me	Me	c-Pr
Cl	V^c	Me	Me	c-Pr	F	V^c	Me	Me	c-Pr
Cl	V^d	Me	Me	c-Pr	F	V^d	Me	Me	c-Pr
Cl	V^e	Me	Me	c-Pr	F	V^e	Me	Me	c-Pr
Cl	V^f	Me	Me	c-Pr	F	V^f	Me	Me	c-Pr
Cl	V^g	Me	Me	c-Pr	F	V^g	Me	Me	c-Pr
Cl	V^h	Me	Me	c-Pr	F	V^h	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Me	c-Pr	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	Me	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Et

<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et
Me	-CH(CN)-	Me	Me	Me	Me	-CH(CN)-	Me	Me	Et
Me	v ^a	Me	Me	Me	Me	v ^a	Me	Me	Et
Me	v ^b	Me	Me	Me	Me	v ^b	Me	Me	Et
Me	v ^c	Me	Me	Me	Me	v ^c	Me	Me	Et
Me	v ^d	Me	Me	Me	Me	v ^d	Me	Me	Et
Me	v ^e	Me	Me	Me	Me	v ^e	Me	Me	Et
Me	v ^f	Me	Me	Me	Me	v ^f	Me	Me	Et
Me	v ^g	Me	Me	Me	Me	v ^g	Me	Me	Et

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Me	V^h	Me	Me	Me	Me	V^h	Me	Me	Et
Me	$-CH_2OC(=O)CH_2-$	Me	Me	Me	Me	$-CH_2OC(=O)CH_2-$	Me	Me	Et
Me	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	Me	Me	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	Et
Me	$-CH_2C(=O)-$	Me	Me	Me	Me	$-CH_2C(=O)-$	Me	Me	Et
Me	$-CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH_2CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH_2CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2OCH_2CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2OCH_2CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH_2OCH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH_2OCH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2C(=O)CH_2CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2C(=O)CH_2CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH_2C(=O)CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2C(=S)CH_2CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2C(=S)CH_2CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH_2C(=S)CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH_2C(=S)CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2C(=S)CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2C(=S)CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH(Me)-$	Me	Et	Et	Me	$-CH(Me)-$	Et	Et	Et
Me	$-CH(OMe)-$	Me	Et	Et	Me	$-CH(OMe)-$	Et	Et	Et
Me	$-CH(Me)CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH(Me)CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH(Me)-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH(Me)-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH(OMe)-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH(OMe)-$	Et	Et	Et
Me	$-CH(Me)CH_2CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH(Me)CH_2CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH(Me)CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH(Me)CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH_2CH(Me)-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH_2CH(Me)-$	Et	Et	Et
Me	$-CH(Et)-$	Me	Et	Et	Me	$-CH(Et)-$	Et	Et	Et
Me	$-CH(Et)CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH(Et)CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH(Et)-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH(Et)-$	Et	Et	Et
Me	$-CH(Et)CH_2CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH(Et)CH_2CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH(Et)CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH(Et)CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CH_2CH(Et)-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CH_2CH(Et)-$	Et	Et	Et
Me	$-CH(OCF_3)-$	Me	Et	Et	Me	$-CH(OCF_3)-$	Et	Et	Et
Me	$-CH(CF_3)-$	Me	Et	Et	Me	$-CH(CF_3)-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CF_2CH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CF_2CH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CHFCH_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CHFCH_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CF_2-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CF_2-$	Et	Et	Et
Me	$-CH_2CHF-$	Me	Et	Et	Me	$-CH_2CHF-$	Et	Et	Et
Me	$-CH(CN)-$	Me	Et	Et	Me	$-CH(CN)-$	Et	Et	Et

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	V ^a	Me	Et	Et	Me	V ^a	Et	Et	Et
Me	V ^b	Me	Et	Et	Me	V ^b	Et	Et	Et
Me	V ^c	Me	Et	Et	Me	V ^c	Et	Et	Et
Me	V ^d	Me	Et	Et	Me	V ^d	Et	Et	Et
Me	V ^e	Me	Et	Et	Me	V ^e	Et	Et	Et
Me	V ^f	Me	Et	Et	Me	V ^f	Et	Et	Et
Me	V ^g	Me	Et	Et	Me	V ^g	Et	Et	Et
Me	V ^h	Me	Et	Et	Me	V ^h	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr

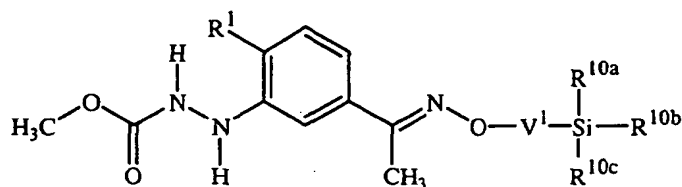
<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(CN)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(CN)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	v ^a	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	v ^a	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	v ^b	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	v ^b	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	v ^c	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	v ^c	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	v ^d	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	v ^d	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	v ^e	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	v ^e	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	v ^f	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	v ^f	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	v ^g	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	v ^g	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	v ^h	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	v ^h	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Me)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Et)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(CN)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^a	Me	Me	Ph	Me	V ^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^b	Me	Me	Ph	Me	V ^b	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^c	Me	Me	Ph	Me	V ^c	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^d	Me	Me	Ph	Me	V ^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^e	Me	Me	Ph	Me	V ^e	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^f	Me	Me	Ph	Me	V ^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^g	Me	Me	Ph	Me	V ^g	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	V ^h	Me	Me	Ph	Me	V ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^a	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^b	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^c	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^d	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^e	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^f	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^g	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^h	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Me	c-Pr

TABELA 2



R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Me	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Me	F	-CH(CN)-	Me	Me	Me
Cl	v ^a	Me	Me	Me	F	v ^a	Me	Me	Me
Cl	v ^b	Me	Me	Me	F	v ^b	Me	Me	Me
Cl	v ^c	Me	Me	Me	F	v ^c	Me	Me	Me
Cl	v ^d	Me	Me	Me	F	v ^d	Me	Me	Me
Cl	v ^e	Me	Me	Me	F	v ^e	Me	Me	Me
Cl	v ^f	Me	Me	Me	F	v ^f	Me	Me	Me
Cl	v ^g	Me	Me	Me	F	v ^g	Me	Me	Me
Cl	v ^h	Me	Me	Me	F	v ^h	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Et	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Et	F	-CH(CN)-	Me	Me	Et
Cl	v ^a	Me	Me	Et	F	v ^a	Me	Me	Et
Cl	v ^b	Me	Me	Et	F	v ^b	Me	Me	Et
Cl	v ^c	Me	Me	Et	F	v ^c	Me	Me	Et
Cl	v ^d	Me	Me	Et	F	v ^d	Me	Me	Et
Cl	v ^e	Me	Me	Et	F	v ^e	Me	Me	Et
Cl	v ^f	Me	Me	Et	F	v ^f	Me	Me	Et
Cl	v ^g	Me	Me	Et	F	v ^g	Me	Me	Et
Cl	v ^h	Me	Me	Et	F	v ^h	Me	Me	Et

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Et	F	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Me	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Me	Et
Cl	$-\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Et	Et
Cl	V^a	Me	Et	Et	F	V^a	Me	Et	Et

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	V^b	Me	Et	Et	F	V^b	Me	Et	Et
Cl	V^c	Me	Et	Et	F	V^c	Me	Et	Et
Cl	V^d	Me	Et	Et	F	V^d	Me	Et	Et
Cl	V^e	Me	Et	Et	F	V^e	Me	Et	Et
Cl	V^f	Me	Et	Et	F	V^f	Me	Et	Et
Cl	V^g	Me	Et	Et	F	V^g	Me	Et	Et
Cl	V^h	Me	Et	Et	F	V^h	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Et	Et	Et
Cl	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Et	Et	Et	F	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Et	Et	Et

R^I	V^I	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^I	V^I	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et	F	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et
Cl	-CH(CN)-	Et	Et	Et	F	-CH(CN)-	Et	Et	Et
Cl	v^a	Et	Et	Et	F	v^a	Et	Et	Et
Cl	v^b	Et	Et	Et	F	v^b	Et	Et	Et
Cl	v^c	Et	Et	Et	F	v^c	Et	Et	Et
Cl	v^d	Et	Et	Et	F	v^d	Et	Et	Et
Cl	v^e	Et	Et	Et	F	v^e	Et	Et	Et
Cl	v^f	Et	Et	Et	F	v^f	Et	Et	Et
Cl	v^g	Et	Et	Et	F	v^g	Et	Et	Et
Cl	v^h	Et	Et	Et	F	v^h	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CN)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^a	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^a	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^b	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^b	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^c	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^c	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^d	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^d	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^e	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^e	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^f	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^f	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^g	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^g	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^h	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	v ^h	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr

<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CN)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^a	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^a	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^b	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^b	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^c	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^c	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^d	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^d	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^e	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^e	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^f	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^f	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^g	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^g	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^h	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^h	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	Ph
Cl	v ^a	Me	Me	Ph	F	v ^a	Me	Me	Ph
Cl	v ^b	Me	Me	Ph	F	v ^b	Me	Me	Ph
Cl	v ^c	Me	Me	Ph	F	v ^c	Me	Me	Ph
Cl	v ^d	Me	Me	Ph	F	v ^d	Me	Me	Ph
Cl	v ^e	Me	Me	Ph	F	v ^e	Me	Me	Ph
Cl	v ^f	Me	Me	Ph	F	v ^f	Me	Me	Ph
Cl	v ^g	Me	Me	Ph	F	v ^g	Me	Me	Ph
Cl	v ^h	Me	Me	Ph	F	v ^h	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^a	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^b	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^b	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^c	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^c	Me	Me	4-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	v ^d	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^e	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^e	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^f	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^g	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^g	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v ^h	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^a	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^b	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^c	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^d	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^e	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^f	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^g	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	v ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	F	v ^h	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v ^a	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v ^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v ^b	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v ^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v ^c	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v ^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v ^d	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v ^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v ^e	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v ^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v ^f	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v ^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v ^g	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v ^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v ^h	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v ^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr
Cl	v ^a	Me	Me	c-Pr	F	v ^a	Me	Me	c-Pr
Cl	v ^b	Me	Me	c-Pr	F	v ^b	Me	Me	c-Pr
Cl	v ^c	Me	Me	c-Pr	F	v ^c	Me	Me	c-Pr
Cl	v ^d	Me	Me	c-Pr	F	v ^d	Me	Me	c-Pr
Cl	v ^e	Me	Me	c-Pr	F	v ^e	Me	Me	c-Pr
Cl	v ^f	Me	Me	c-Pr	F	v ^f	Me	Me	c-Pr
Cl	v ^g	Me	Me	c-Pr	F	v ^g	Me	Me	c-Pr
Cl	v ^h	Me	Me	c-Pr	F	v ^h	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et
Me	-CH(CN)-	Me	Me	Me	Me	-CH(CN)-	Me	Me	Et
Me	v ^a	Me	Me	Me	Me	v ^a	Me	Me	Et
Me	v ^b	Me	Me	Me	Me	v ^b	Me	Me	Et
Me	v ^c	Me	Me	Me	Me	v ^c	Me	Me	Et
Me	v ^d	Me	Me	Me	Me	v ^d	Me	Me	Et
Me	v ^e	Me	Me	Me	Me	v ^e	Me	Me	Et
Me	v ^f	Me	Me	Me	Me	v ^f	Me	Me	Et
Me	v ^g	Me	Me	Me	Me	v ^g	Me	Me	Et
Me	v ^h	Me	Me	Me	Me	v ^h	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ -	Et	Et	Et

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH(OMe)-	Me	Et	Et	Me	-CH(OMe)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et	Me	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et	Me	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et
Me	-CH(CN)-	Me	Et	Et	Me	-CH(CN)-	Et	Et	Et
Me	V ^a	Me	Et	Et	Me	V ^a	Et	Et	Et
Me	V ^b	Me	Et	Et	Me	V ^b	Et	Et	Et
Me	V ^c	Me	Et	Et	Me	V ^c	Et	Et	Et
Me	V ^d	Me	Et	Et	Me	V ^d	Et	Et	Et
Me	V ^e	Me	Et	Et	Me	V ^e	Et	Et	Et

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Me	V^f	Me	Et	Et	Me	V^f	Et	Et	Et
Me	V^g	Me	Et	Et	Me	V^g	Et	Et	Et
Me	V^h	Me	Et	Et	Me	V^h	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr

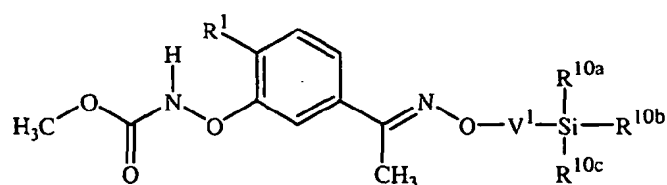
<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(CN)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(CN)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V ^a	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V ^a	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V ^b	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V ^b	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V ^c	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V ^c	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V ^d	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V ^d	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V ^e	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V ^e	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V ^f	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V ^f	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V ^g	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V ^g	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V ^h	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V ^h	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Me)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Et)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph

<u>R^I</u>	<u>V^I</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R^I</u>	<u>V^I</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(CN)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^a	Me	Me	Ph	Me	v ^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^b	Me	Me	Ph	Me	v ^b	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^c	Me	Me	Ph	Me	v ^c	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^d	Me	Me	Ph	Me	v ^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^e	Me	Me	Ph	Me	v ^e	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^f	Me	Me	Ph	Me	v ^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^g	Me	Me	Ph	Me	v ^g	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^h	Me	Me	Ph	Me	v ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	v ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	v ^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^a	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^b	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^c	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^d	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^e	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^f	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^g	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^h	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Me	c-Pr

TABELA 3



R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	Me
Cl	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Me	F	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	Me

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Me	F	-CH(CN)-	Me	Me	Me
Cl	v ^a	Me	Me	Me	F	v ^a	Me	Me	Me
Cl	v ^b	Me	Me	Me	F	v ^b	Me	Me	Me
Cl	v ^c	Me	Me	Me	F	v ^c	Me	Me	Me
Cl	v ^d	Me	Me	Me	F	v ^d	Me	Me	Me
Cl	v ^e	Me	Me	Me	F	v ^e	Me	Me	Me
Cl	v ^f	Me	Me	Me	F	v ^f	Me	Me	Me
Cl	v ^g	Me	Me	Me	F	v ^g	Me	Me	Me
Cl	v ^h	Me	Me	Me	F	v ^h	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et

<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>v¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Et	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Et	F	-CH(CN)-	Me	Me	Et
Cl	v ^a	Me	Me	Et	F	v ^a	Me	Me	Et
Cl	v ^b	Me	Me	Et	F	v ^b	Me	Me	Et
Cl	v ^c	Me	Me	Et	F	v ^c	Me	Me	Et
Cl	v ^d	Me	Me	Et	F	v ^d	Me	Me	Et
Cl	v ^e	Me	Me	Et	F	v ^e	Me	Me	Et
Cl	v ^f	Me	Me	Et	F	v ^f	Me	Me	Et
Cl	v ^g	Me	Me	Et	F	v ^g	Me	Me	Et
Cl	v ^h	Me	Me	Et	F	v ^h	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et
Cl	-CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(OMe)-	Me	Et	Et	F	-CH(OMe)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et	F	-CH(CF ₃)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ CHF-	Me	Et	Et
Cl	-CH(CN)-	Me	Et	Et	F	-CH(CN)-	Me	Et	Et
Cl	v ^a	Me	Et	Et	F	v ^a	Me	Et	Et
Cl	v ^b	Me	Et	Et	F	v ^b	Me	Et	Et
Cl	v ^c	Me	Et	Et	F	v ^c	Me	Et	Et
Cl	v ^d	Me	Et	Et	F	v ^d	Me	Et	Et
Cl	v ^e	Me	Et	Et	F	v ^e	Me	Et	Et
Cl	v ^f	Me	Et	Et	F	v ^f	Me	Et	Et

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	Vg	Me	Et	Et	F	Vg	Me	Et	Et
Cl	Vh	Me	Et	Et	F	Vh	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et
Cl	-CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(OMe)-	Et	Et	Et	F	-CH(OMe)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et	F	-CH(OCF ₃)-	Et	Et	Et
Cl	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et	F	-CH(CF ₃)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CF ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ CHF-	Et	Et	Et

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH(CN)-	Et	Et	Et	F	-CH(CN)-	Et	Et	Et
Cl	V ^a	Et	Et	Et	F	V ^a	Et	Et	Et
Cl	V ^b	Et	Et	Et	F	V ^b	Et	Et	Et
Cl	V ^c	Et	Et	Et	F	V ^c	Et	Et	Et
Cl	V ^d	Et	Et	Et	F	V ^d	Et	Et	Et
Cl	V ^e	Et	Et	Et	F	V ^e	Et	Et	Et
Cl	V ^f	Et	Et	Et	F	V ^f	Et	Et	Et
Cl	V ^g	Et	Et	Et	F	V ^g	Et	Et	Et
Cl	V ^h	Et	Et	Et	F	V ^h	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et	F	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CN)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	V^a	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	V^a	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	V^b	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	V^b	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	V^c	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	V^c	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	V^d	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	V^d	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	V^e	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	V^e	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	V^f	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	V^f	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	V^g	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	V^g	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	V^h	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	V^h	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH(CN)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^a	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^a	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^b	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^b	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^c	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^c	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^d	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^d	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^e	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^e	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^f	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^f	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^g	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^g	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	v ^h	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	v ^h	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	Ph
Cl	V ^a	Me	Me	Ph	F	V ^a	Me	Me	Ph
Cl	V ^b	Me	Me	Ph	F	V ^b	Me	Me	Ph
Cl	V ^c	Me	Me	Ph	F	V ^c	Me	Me	Ph
Cl	V ^d	Me	Me	Ph	F	V ^d	Me	Me	Ph
Cl	V ^e	Me	Me	Ph	F	V ^e	Me	Me	Ph
Cl	V ^f	Me	Me	Ph	F	V ^f	Me	Me	Ph
Cl	V ^g	Me	Me	Ph	F	V ^g	Me	Me	Ph
Cl	V ^h	Me	Me	Ph	F	V ^h	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph

R^I	V^I	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^I	V^I	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v^a	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v^b	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v^b	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v^c	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v^c	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v^d	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v^e	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v^e	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v^f	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v^g	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v^g	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	v^h	Me	Me	4-Cl-Ph	F	v^h	Me	Me	4-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Cl	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	F	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph

R^1	v^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	v^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^a	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^b	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^c	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^d	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^e	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^f	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^g	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	v^h	Me	Me	2-Cl-Ph	F	v^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Cl	-CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH(Me)-	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH(Me)-	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH(OMe)-	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH(OMe)-	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>c</i> -Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>c</i> -Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>c</i> -Pr

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Cl	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr
Cl	V^a	Me	Me	c-Pr	F	V^a	Me	Me	c-Pr
Cl	V^b	Me	Me	c-Pr	F	V^b	Me	Me	c-Pr
Cl	V^c	Me	Me	c-Pr	F	V^c	Me	Me	c-Pr
Cl	V^d	Me	Me	c-Pr	F	V^d	Me	Me	c-Pr
Cl	V^e	Me	Me	c-Pr	F	V^e	Me	Me	c-Pr
Cl	V^f	Me	Me	c-Pr	F	V^f	Me	Me	c-Pr
Cl	V^g	Me	Me	c-Pr	F	V^g	Me	Me	c-Pr
Cl	V^h	Me	Me	c-Pr	F	V^h	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Cl	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr	F	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)-	Me	Me	Et

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	Et
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Me	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Me	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Et
Me	-CH(CN)-	Me	Me	Me	Me	-CH(CN)-	Me	Me	Et
Me	v^a	Me	Me	Me	Me	v^a	Me	Me	Et
Me	v^b	Me	Me	Me	Me	v^b	Me	Me	Et
Me	v^c	Me	Me	Me	Me	v^c	Me	Me	Et
Me	v^d	Me	Me	Me	Me	v^d	Me	Me	Et
Me	v^e	Me	Me	Me	Me	v^e	Me	Me	Et
Me	v^f	Me	Me	Me	Me	v^f	Me	Me	Et
Me	v^g	Me	Me	Me	Me	v^g	Me	Me	Et
Me	v^h	Me	Me	Me	Me	v^h	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Me	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Et
Me	-CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Et	Et	Et

R^I	V^I	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^I	V^I	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{S})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}(\text{Me})-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}(\text{OMe})-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Et})-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}(\text{OCF}_3)-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}(\text{CF}_3)-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CHFCH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CF}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{CHF}-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}(\text{CN})-$	Et	Et	Et
Me	v^a	Me	Et	Et	Me	v^a	Et	Et	Et
Me	v^b	Me	Et	Et	Me	v^b	Et	Et	Et
Me	v^c	Me	Et	Et	Me	v^c	Et	Et	Et
Me	v^d	Me	Et	Et	Me	v^d	Et	Et	Et
Me	v^e	Me	Et	Et	Me	v^e	Et	Et	Et
Me	v^f	Me	Et	Et	Me	v^f	Et	Et	Et
Me	v^g	Me	Et	Et	Me	v^g	Et	Et	Et
Me	v^h	Me	Et	Et	Me	v^h	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et
Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Et	Et	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Et	Et	Et

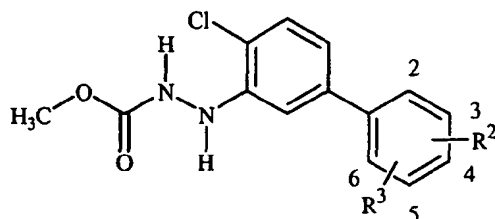
<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Et	Et	Me	-CH ₂ C(=O)-	Et	Et	Et
Me	-CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	-CH(CN)-	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	-CH(CN)-	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V ^a	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V ^a	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V ^b	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V ^b	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V ^c	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V ^c	Me	Et	<i>i</i> -Pr

R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}	R^1	V^1	R^{10a}	R^{10b}	R^{10c}
Me	V^d	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V^d	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V^e	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V^e	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V^f	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V^f	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V^g	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V^g	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	V^h	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	V^h	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-CH_2OC(=O)CH_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-CH_2OC(=O)CH_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-CH_2C(=O)-$	Me	Me	<i>i</i> -Pr	Me	$-CH_2C(=O)-$	Me	Et	<i>i</i> -Pr
Me	$-CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH_2CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH_2CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH_2CH_2CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2OCH_2CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2OCH_2CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH_2OCH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH_2OCH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2C(=O)CH_2CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2C(=O)CH_2CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2C(=S)CH_2CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2C(=S)CH_2CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH_2C(=S)CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH_2C(=S)CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2C(=O)CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2C(=S)CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2C(=S)CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH(Me)-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH(Me)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH(OMe)-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH(OMe)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH(Me)CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH(Me)CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH(Me)-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH(Me)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH(OMe)-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH(OMe)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH(Me)CH_2CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH(Me)CH_2CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH(Me)CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH(Me)CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH_2CH(Me)-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH_2CH(Me)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH(Et)-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH(Et)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH(Et)CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH(Et)CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH(Et)-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH(Et)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH(Et)CH_2CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH(Et)CH_2CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH(Et)CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH(Et)CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CH_2CH(Et)-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CH_2CH(Et)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH(OCF_3)-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH(OCF_3)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH(CF_3)-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH(CF_3)-$	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	$-CH_2CF_2CH_2-$	Me	Me	Ph	Me	$-CH_2CF_2CH_2-$	Me	Me	4-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH(CN)-	Me	Me	Ph	Me	-CH(CN)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^a	Me	Me	Ph	Me	v ^a	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^b	Me	Me	Ph	Me	v ^b	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^c	Me	Me	Ph	Me	v ^c	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^d	Me	Me	Ph	Me	v ^d	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^e	Me	Me	Ph	Me	v ^e	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^f	Me	Me	Ph	Me	v ^f	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^g	Me	Me	Ph	Me	v ^g	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	v ^h	Me	Me	Ph	Me	v ^h	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	Ph	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	4-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(OMe)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Me)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph

<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>	<u>R¹</u>	<u>V¹</u>	<u>R^{10a}</u>	<u>R^{10b}</u>	<u>R^{10c}</u>
Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH(CN)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH(CN)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^a	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^a	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^b	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^b	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^c	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^c	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^d	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^d	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^e	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^e	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^f	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^f	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^g	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^g	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	V ^h	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	V ^h	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ OC(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	3-Cl-Ph	Me	-CH ₂ C(=O)-	Me	Me	2-Cl-Ph
Me	-CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(Et)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH(Et)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Et)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(OCF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(CF ₃)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CHFCH ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CF ₂ -	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH ₂ CHF-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=O)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	-CH(CN)-	Me	Me	c-Pr
Me	-CH ₂ C(=S)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^a	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Me)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^b	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(OMe)-	Me	Me	c-Pr	Me	V ^c	Me	Me	c-Pr
Me	-CH(Me)CH ₂ -	Me	Me	c-Pr	Me	V ^d	Me	Me	c-Pr

$\underline{R^1}$	$\underline{V^1}$	$\underline{R^{10a}}$	$\underline{R^{10b}}$	$\underline{R^{10c}}$	$\underline{R^1}$	$\underline{V^1}$	$\underline{R^{10a}}$	$\underline{R^{10b}}$	$\underline{R^{10c}}$
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^e	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OMe})-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^f	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^g	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	V^h	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Et})-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr
Me	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2-$	Me	Me	c-Pr	Me	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$	Me	Me	c-Pr

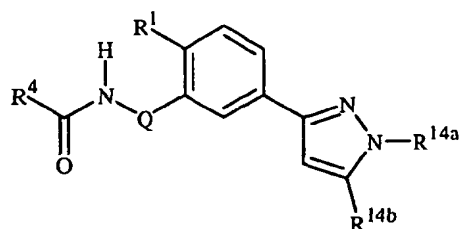
TABELA 4

$\underline{R^2}$	$\underline{R^3}$	$\underline{R^2}$	$\underline{R^3}$	$\underline{R^2}$	$\underline{R^3}$	$\underline{R^2}$	$\underline{R^3}$
2-OCF ₃	H	3-OCF ₃	2-Me	2-CH ₂ SiMe ₃	3-F	4-SiMe ₃	5-CN
3-OCF ₃	H	3-OCF ₃	4-Me	2-CH ₂ SiMe ₃	4-F	4-SiMe ₃	6-CN
4-OCF ₃	H	3-OCF ₃	5-Me	2-CH ₂ SiMe ₃	5-F	2-CH ₂ SiMe ₃	3-CN
2-OCF ₂ H	H	3-OCF ₃	6-Me	2-CH ₂ SiMe ₃	6-F	2-CH ₂ SiMe ₃	4-CN
3-OCF ₂ H	H	4-OCF ₃	2-Me	3-CH ₂ SiMe ₃	2-F	2-CH ₂ SiMe ₃	5-CN
4-OCF ₂ H	H	4-OCF ₃	3-Me	3-CH ₂ SiMe ₃	4-F	2-CH ₂ SiMe ₃	6-CN
2-OCFH ₂	H	4-OCF ₃	5-Me	3-CH ₂ SiMe ₃	5-F	3-CH ₂ SiMe ₃	2-CN
3-OCFH ₂	H	4-OCF ₃	6-Me	3-CH ₂ SiMe ₃	6-F	3-CH ₂ SiMe ₃	4-CN
4-OCFH ₂	H	2-OCF ₂ H	3-Me	4-CH ₂ SiMe ₃	2-F	3-CH ₂ SiMe ₃	5-CN
2-OCF ₃	3-F	2-OCF ₂ H	4-Me	4-CH ₂ SiMe ₃	3-F	3-CH ₂ SiMe ₃	6-CN
2-OCF ₃	4-F	2-OCF ₂ H	5-Me	4-CH ₂ SiMe ₃	5-F	4-CH ₂ SiMe ₃	2-CN
2-OCF ₃	5-F	2-OCF ₂ H	6-Me	4-CH ₂ SiMe ₃	6-F	4-CH ₂ SiMe ₃	3-CN
2-OCF ₃	6-F	3-OCF ₂ H	2-Me	2-SiMe ₃	3-Cl	4-CH ₂ SiMe ₃	5-CN
3-OCF ₃	2-F	3-OCF ₂ H	4-Me	2-SiMe ₃	4-Cl	4-CH ₂ SiMe ₃	6-CN
3-OCF ₃	4-F	3-OCF ₂ H	5-Me	2-SiMe ₃	5-Cl	2-SiMe ₂ Et	H
3-OCF ₃	5-F	3-OCF ₂ H	6-Me	2-SiMe ₃	6-Cl	3-SiMe ₂ Et	H
3-OCF ₃	6-F	4-OCFH ₂	2-Me	3-SiMe ₃	2-Cl	4-SiMe ₂ Et	H
4-OCF ₃	2-F	4-OCFH ₂	3-Me	3-SiMe ₃	4-Cl	2-SiMe ₂ Et	3-F
4-OCF ₃	3-F	4-OCFH ₂	5-Me	3-SiMe ₃	5-Cl	2-SiMe ₂ Et	4-F

R^2	R^3	R^2	R^3	R^2	R^3	R^2	R^3
4-OCF ₃	5-F	4-OCFH ₂	6-Me	3-SiMe ₃	6-Cl	2-SiMe ₂ Et	5-F
4-OCF ₃	6-F	3-OCFH ₂	2-Me	4-SiMe ₃	2-Cl	2-SiMe ₂ Et	6-F
2-OCF ₂ H	3-F	3-OCFH ₂	4-Me	4-SiMe ₃	3-Cl	3-SiMe ₂ Et	2-F
2-OCF ₂ H	4-F	3-OCFH ₂	5-Me	4-SiMe ₃	5-Cl	3-SiMe ₂ Et	4-F
2-OCF ₂ H	5-F	3-OCFH ₂	6-Me	4-SiMe ₃	6-Cl	3-SiMe ₂ Et	5-F
2-OCF ₂ H	6-F	2-OCF ₃	3-CN	2-CH ₂ SiMe ₃	3-Cl	3-SiMe ₂ Et	6-F
3-OCF ₂ H	2-F	2-OCF ₃	4-CN	2-CH ₂ SiMe ₃	4-Cl	4-SiMe ₂ Et	2-F
3-OCF ₂ H	4-F	2-OCF ₃	5-CN	2-CH ₂ SiMe ₃	5-Cl	4-SiMe ₂ Et	3-F
3-OCF ₂ H	5-F	2-OCF ₃	6-CN	2-CH ₂ SiMe ₃	6-Cl	4-SiMe ₂ Et	5-F
3-OCF ₂ H	6-F	3-OCF ₃	2-CN	3-CH ₂ SiMe ₃	2-Cl	4-SiMe ₂ Et	6-F
4-OCFH ₂	2-F	3-OCF ₃	4-CN	3-CH ₂ SiMe ₃	4-Cl	2-SiMe ₂ Et	3-Cl
4-OCFH ₂	3-F	3-OCF ₃	5-CN	3-CH ₂ SiMe ₃	5-Cl	2-SiMe ₂ Et	4-Cl
4-OCFH ₂	5-F	3-OCF ₃	6-CN	3-CH ₂ SiMe ₃	6-Cl	2-SiMe ₂ Et	5-Cl
4-OCFH ₂	6-F	4-OCF ₃	2-CN	4-CH ₂ SiMe ₃	2-Cl	2-SiMe ₂ Et	6-Cl
3-OCFH ₂	2-F	4-OCF ₃	3-CN	4-CH ₂ SiMe ₃	3-Cl	3-SiMe ₂ Et	2-Cl
3-OCFH ₂	4-F	4-OCF ₃	5-CN	4-CH ₂ SiMe ₃	5-Cl	3-SiMe ₂ Et	4-Cl
3-OCFH ₂	5-F	4-OCF ₃	6-CN	4-CH ₂ SiMe ₃	6-Cl	3-SiMe ₂ Et	5-Cl
3-OCFH ₂	6-F	2-OCF ₂ H	3-CN	2-SiMe ₃	3-Me	3-SiMe ₂ Et	6-Cl
2-OCF ₃	3-Cl	2-OCF ₂ H	4-CN	2-SiMe ₃	4-Me	4-SiMe ₂ Et	2-Cl
2-OCF ₃	4-Cl	2-OCF ₂ H	5-CN	2-SiMe ₃	5-Me	4-SiMe ₂ Et	3-Cl
2-OCF ₃	5-Cl	2-OCF ₂ H	6-CN	2-SiMe ₃	6-Me	4-SiMe ₂ Et	5-Cl
2-OCF ₃	6-Cl	3-OCF ₂ H	2-CN	3-SiMe ₃	2-Me	4-SiMe ₂ Et	6-Cl
3-OCF ₃	2-Cl	3-OCF ₂ H	4-CN	3-SiMe ₃	4-Me	2-SiMe ₂ Et	3-Me
3-OCF ₃	4-Cl	3-OCF ₂ H	5-CN	3-SiMe ₃	5-Me	2-SiMe ₂ Et	4-Me
3-OCF ₃	5-Cl	3-OCF ₂ H	6-CN	3-SiMe ₃	6-Me	2-SiMe ₂ Et	5-Me
3-OCF ₃	6-Cl	4-OCFH ₂	2-CN	4-SiMe ₃	2-Me	2-SiMe ₂ Et	6-Me
4-OCF ₃	2-Cl	4-OCFH ₂	3-CN	4-SiMe ₃	3-Me	3-SiMe ₂ Et	2-Me
4-OCF ₃	3-Cl	4-OCFH ₂	5-CN	4-SiMe ₃	5-Me	3-SiMe ₂ Et	4-Me
4-OCF ₃	5-Cl	4-OCFH ₂	6-CN	4-SiMe ₃	6-Me	3-SiMe ₂ Et	5-Me
4-OCF ₃	6-Cl	3-OCFH ₂	2-CN	2-CH ₂ SiMe ₃	3-Me	3-SiMe ₂ Et	6-Me
2-OCF ₂ H	3-Cl	3-OCFH ₂	4-CN	2-CH ₂ SiMe ₃	4-Me	4-SiMe ₂ Et	2-Me
2-OCF ₂ H	4-Cl	3-OCFH ₂	5-CN	2-CH ₂ SiMe ₃	5-Me	4-SiMe ₂ Et	3-Me
2-OCF ₂ H	5-Cl	3-OCFH ₂	6-CN	2-CH ₂ SiMe ₃	6-Me	4-SiMe ₂ Et	5-Me
2-OCF ₂ H	6-Cl	2-SiMe ₃	H	3-CH ₂ SiMe ₃	2-Me	4-SiMe ₂ Et	6-Me
3-OCF ₂ H	2-Cl	3-SiMe ₃	H	3-CH ₂ SiMe ₃	4-Me	2-SiMe ₂ Et	3-CN
3-OCF ₂ H	4-Cl	4-SiMe ₃	H	3-CH ₂ SiMe ₃	5-Me	2-SiMe ₂ Et	4-CN
3-OCF ₂ H	5-Cl	2-CH ₂ SiMe ₃	H	3-CH ₂ SiMe ₃	6-Me	2-SiMe ₂ Et	5-CN

R^2	R^3	R^2	R^3	R^2	R^3	R^2	R^3
3-OCF ₂ H	6-Cl	3-CH ₂ SiMe ₃	H	4-CH ₂ SiMe ₃	2-Me	2-SiMe ₂ Et	6-CN
4-OCFH ₂	2-Cl	4-CH ₂ SiMe ₃	H	4-CH ₂ SiMe ₃	3-Me	3-SiMe ₂ Et	2-CN
4-OCFH ₂	3-Cl	2-SiMe ₃	3-F	4-CH ₂ SiMe ₃	5-Me	3-SiMe ₂ Et	4-CN
4-OCFH ₂	5-Cl	2-SiMe ₃	4-F	4-CH ₂ SiMe ₃	6-Me	3-SiMe ₂ Et	5-CN
4-OCFH ₂	6-Cl	2-SiMe ₃	5-F	2-SiMe ₃	3-CN	3-SiMe ₂ Et	6-CN
3-OCFH ₂	2-Cl	2-SiMe ₃	6-F	2-SiMe ₃	4-CN	4-SiMe ₂ Et	2-CN
3-OCFH ₂	4-Cl	3-SiMe ₃	2-F	2-SiMe ₃	5-CN	4-SiMe ₂ Et	3-CN
3-OCFH ₂	5-Cl	3-SiMe ₃	4-F	2-SiMe ₃	6-CN	4-SiMe ₂ Et	5-CN
3-OCFH ₂	6-Cl	3-SiMe ₃	5-F	3-SiMe ₃	2-CN	4-SiMe ₂ Et	6-CN
2-OCF ₃	3-Me	3-SiMe ₃	6-F	3-SiMe ₃	4-CN	4-SiMe ₃	6-F
2-OCF ₃	4-Me	4-SiMe ₃	2-F	3-SiMe ₃	5-CN	4-SiMe ₃	3-CN
2-OCF ₃	5-Me	4-SiMe ₃	3-F	3-SiMe ₃	6-CN		
2-OCF ₃	6-Me	4-SiMe ₃	5-F	4-SiMe ₃	2-CN		

TABELA 5



R^1	R^4	Q	R^{14a}	R^{14b}	R^1	R^4	Q	R^{14a}	R^{14b}
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-F-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Br-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Me-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Br-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Me-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Br-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Me-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Et-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Et-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Et-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CN-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CN-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CN-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ O-Ph	H

<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ O-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ O-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Ac-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Ac-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Ac-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-MeO-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-EtO-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-MeO-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-EtO-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-MeO-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-EtO-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-NO ₂ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-NO ₂ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-NO ₂ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-I-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-(CO ₂ Me)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-I-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-(CO ₂ Me)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-I-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-(CO ₂ Me)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Me(C=NH)-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Me(C=NMe)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Me(C=NH)-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Me(C=NMe)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Me(C=NH)-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Me(C=NMe)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Me(C=NOMe)-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Me(C=NOEt)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Me(C=NOMe)-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Me(C=NOEt)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Me(C=NOMe)-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Me(C=NOEt)-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-MeNH(C=O)-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-SiMe ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-MeNH(C=O)-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-SiMe ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-MeNH(C=O)-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-SiMe ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2,6-di-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2,6-di-F-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2,5-di-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2,5-di-F-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2,4-di-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2,4-di-F-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3,3-di-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3,3-di-F-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3,4-di-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3,4-di-F-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2,6-di-Me-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2,6-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2,5-di-Me-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2,5-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2,4-di-Me-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2,4-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3,3-di-Me-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3,3-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3,4-di-Me-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3,4-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2,6-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2,6-di-MeO-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2,5-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2,5-di-MeO-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2,4-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2,4-di-MeO-Ph	H

<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	MeO	-CH ₂ -	3,3-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3,3-di-MeO-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3,4-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3,4-di-MeO-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₂ -Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₂ O-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₂ -Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₂ O-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₂ -Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₂ O-Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-3-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-3-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-4-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-4-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-5-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-5-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-6-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-6-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-2-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-2-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-4-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-4-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-5-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-5-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-6-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-6-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-F-3-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-F-3-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-F-2-Cl-Ph	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-F-2-CF ₃ -Ph	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	pyrid-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	pyrid-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	pyrid-4-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2,4,6-triazin-1-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	5-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	5-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	6-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	6-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ -pyrid-4-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Me-pyrid-4-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ -pyrid-4-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Me-pyrid-4-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Me-pyrid-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Me-pyrid-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	5-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	5-Me-pyrid-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	6-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	6-Me-pyrid-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	5-Cl-thien-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	5-F-thien-2-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Cl-thien-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-F-thien-2-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Cl-thien-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-thien-2-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	5-CF ₃ -thien-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	5-OCF ₃ -thien-2-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ -thien-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-OCF ₃ -thien-2-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ -thien-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-OCF ₃ -thien-2-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	5-Cl-thien-3-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	5-F-thien-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Cl-thien-3-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-F-thien-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Cl-thien-3-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-thien-3-yl	H

<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	MeO	-CH ₂ -	5-CF ₃ -thien-3-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	5-OCF ₃ -thien-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ -thien-3-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-OCF ₃ -thien-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ -thien-3-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-OCF ₃ -thien-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	thien-2-yl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	thien-3-yl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-F-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Br-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Me-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Br-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Me-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Br-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Me-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Et-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Et-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Et-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CN-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CN-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CN-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-EtO-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-EtO-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-EtO-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	phenethyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	methyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	ethyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>n</i> -propyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>n</i> -butyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>i</i> -propyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>i</i> -butyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>c</i> -propyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>c</i> -butyl	H

<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>n</i> -pentyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>s</i> -butyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>c</i> -pentyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>n</i> -hexyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>n</i> -heptyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	<i>c</i> -hexyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	1-naphthyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-naphthyl	H
Cl	MeO	N	4-Cl-Ph	H	Cl	MeO	N	4-F-Ph	H
Cl	MeO	N	3-Cl-Ph	H	Cl	MeO	N	3-F-Ph	H
Cl	MeO	N	2-Cl-Ph	H	Cl	MeO	N	2-F-Ph	H
Cl	MeO	N	4-Br-Ph	H	Cl	MeO	N	4-Me-Ph	H
Cl	MeO	N	3-Br-Ph	H	Cl	MeO	N	3-Me-Ph	H
Cl	MeO	N	2-Br-Ph	H	Cl	MeO	N	2-Me-Ph	H
Cl	MeO	N	4-Et-Ph	H	Cl	MeO	N	4- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	N	3-Et-Ph	H	Cl	MeO	N	3- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	N	2-Et-Ph	H	Cl	MeO	N	2- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	N	4-CN-Ph	H	Cl	MeO	N	4- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	N	3-CN-Ph	H	Cl	MeO	N	3- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	N	2-CN-Ph	H	Cl	MeO	N	2- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	N	4-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeO	N	4-CF ₃ O-Ph	H
Cl	MeO	N	3-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeO	N	3-CF ₃ O-Ph	H
Cl	MeO	N	2-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeO	N	2-CF ₃ O-Ph	H
Cl	MeO	N	4-Ac-Ph	H	Cl	MeO	N	2-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	MeO	N	3-Ac-Ph	H	Cl	MeO	N	3-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	MeO	N	2-Ac-Ph	H	Cl	MeO	N	5-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	MeO	N	4-MeO-Ph	H	Cl	MeO	N	4-EtO-Ph	H
Cl	MeO	N	3-MeO-Ph	H	Cl	MeO	N	3-EtO-Ph	H
Cl	MeO	N	2-MeO-Ph	H	Cl	MeO	N	2-EtO-Ph	H
Cl	MeO	N	4- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	MeO	N	4-NO ₂ -Ph	H
Cl	MeO	N	3- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	MeO	N	3-NO ₂ -Ph	H
Cl	MeO	N	2- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	MeO	N	2-NO ₂ -Ph	H
Cl	MeO	N	4-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	N	4-F-benzyl	H
Cl	MeO	N	3-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	N	3-F-benzyl	H
Cl	MeO	N	2-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	N	2-F-benzyl	H
Cl	MeO	N	4-Br-benzyl	H	Cl	MeO	N	4-Me-benzyl	H
Cl	MeO	N	3-Br-benzyl	H	Cl	MeO	N	3-Me-benzyl	H
Cl	MeO	N	2-Br-benzyl	H	Cl	MeO	N	2-Me-benzyl	H
Cl	MeO	N	4-Et-benzyl	H	Cl	MeO	N	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	N	3-Et-benzyl	H	Cl	MeO	N	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	H

<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	MeO	N	2-Et-benzyl	H	Cl	MeO	N	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	N	4-CN-benzyl	H	Cl	MeO	N	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	N	3-CN-benzyl	H	Cl	MeO	N	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	N	2-CN-benzyl	H	Cl	MeO	N	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	N	4-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	N	4-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	N	3-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	N	3-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	N	2-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	N	2-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	N	4-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	N	4-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	N	3-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	N	3-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	N	2-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	N	2-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	N	4-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	N	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	N	3-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	N	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	N	2-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	N	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	N	4-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	N	4-EtO-benzyl	H
Cl	MeO	N	3-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	N	3-EtO-benzyl	H
Cl	MeO	N	2-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	N	2-EtO-benzyl	H
Cl	MeO	N	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeO	N	4-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeO	N	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeO	N	3-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeO	N	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeO	N	2-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeO	O	4-Cl-Ph	H	Cl	MeO	O	4-F-Ph	H
Cl	MeO	O	3-Cl-Ph	H	Cl	MeO	O	3-F-Ph	H
Cl	MeO	O	2-Cl-Ph	H	Cl	MeO	O	2-F-Ph	H
Cl	MeO	O	4-Br-Ph	H	Cl	MeO	O	4-Me-Ph	H
Cl	MeO	O	3-Br-Ph	H	Cl	MeO	O	3-Me-Ph	H
Cl	MeO	O	2-Br-Ph	H	Cl	MeO	O	2-Me-Ph	H
Cl	MeO	O	4-Et-Ph	H	Cl	MeO	O	4- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	O	3-Et-Ph	H	Cl	MeO	O	3- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	O	2-Et-Ph	H	Cl	MeO	O	2- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	O	4-CN-Ph	H	Cl	MeO	O	4- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	O	3-CN-Ph	H	Cl	MeO	O	3- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	O	2-CN-Ph	H	Cl	MeO	O	2- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeO	O	4-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeO	O	4-CF ₃ O-Ph	H
Cl	MeO	O	3-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeO	O	3-CF ₃ O-Ph	H
Cl	MeO	O	2-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeO	O	2-CF ₃ O-Ph	H
Cl	MeO	O	4-Ac-Ph	H	Cl	MeO	O	2-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	MeO	O	3-Ac-Ph	H	Cl	MeO	O	3-(CF ₃ C=O)-Ph	H

<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	MeO	O	2-Ac-Ph	H	Cl	MeO	O	5-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	MeO	O	4-MeO-Ph	H	Cl	MeO	O	4-EtO-Ph	H
Cl	MeO	O	3-MeO-Ph	H	Cl	MeO	O	3-EtO-Ph	H
Cl	MeO	O	2-MeO-Ph	H	Cl	MeO	O	2-EtO-Ph	H
Cl	MeO	O	4-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	O	4-F-benzyl	H
Cl	MeO	O	3-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	O	3-F-benzyl	H
Cl	MeO	O	2-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	O	2-F-benzyl	H
Cl	MeO	O	4-Br-benzyl	H	Cl	MeO	O	4-Me benzyl	H
Cl	MeO	O	3-Br-benzyl	H	Cl	MeO	O	3-Me benzyl	H
Cl	MeO	O	2-Br-benzyl	H	Cl	MeO	O	2-Me-benzyl	H
Cl	MeO	O	4-Et-benzyl	H	Cl	MeO	O	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	O	3-Et-benzyl	H	Cl	MeO	O	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	O	2-Et-benzyl	H	Cl	MeO	O	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	O	4-CN-benzyl	H	Cl	MeO	O	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	O	3-CN-benzyl	H	Cl	MeO	O	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	O	2-CN-benzyl	H	Cl	MeO	O	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	O	4-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	O	4-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	O	3-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	O	3-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	O	2-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	O	2-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	O	4-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	O	4-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	O	3-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	O	3-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	O	2-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	O	2-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	O	4-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	O	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	O	3-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	O	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	O	2-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	O	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	O	4-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	O	4-EtO-benzyl	H
Cl	MeO	O	3-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	O	3-EtO-benzyl	H
Cl	MeO	O	2-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	O	2-EtO-benzyl	H
Cl	MeO	O	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeO	O	4- <i>i</i> -benzyl	H
Cl	MeO	O	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeO	O	3- <i>i</i> -benzyl	H
Cl	MeO	O	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeO	O	2- <i>i</i> -benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-Cl-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4-F-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-Cl-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-F-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-Cl-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-F-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-Br-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4-Me-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-Br-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-Me-Ph	H

<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Me	MeO	-CH ₂ -	2-Br-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-Me-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-Et-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-Et-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-Et-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-CN-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-CN-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-CN-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ -Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ O-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ -Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ O-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ -Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ O-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-Ac-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-Ac-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-Ac-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	5-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-MeO-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4-EtO-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-MeO-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-EtO-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-MeO-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-EtO-Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4-NO ₂ -Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-NO ₂ -Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-NO ₂ -Ph	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-Cl-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4-F-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-Cl-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-F-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-Cl-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-F-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-Br-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4-Me-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-Br-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-Me-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-Br-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-Me-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-Et-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-Et-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-Et-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-CN-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-CN-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-CN-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ -benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ O-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ -benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ O-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ -benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ O-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-CHF ₂ -benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4-CHF ₂ O-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-CHF ₂ -benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-CHF ₂ O-benzyl	H

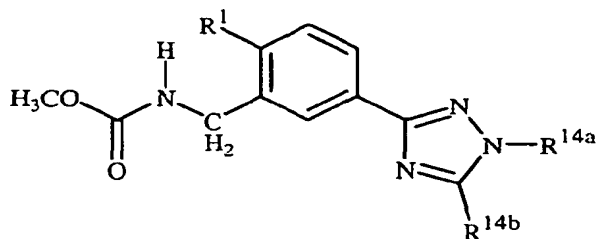
<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Me	MeO	-CH ₂ -	2-CHF ₂ -benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-CHF ₂ O-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-Ac-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-Ac-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-Ac-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4-MeO-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4-EtO-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3-MeO-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-EtO-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2-MeO-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-EtO-benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	4-NO ₂ -benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	3-NO ₂ -benzyl	H
Me	MeO	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Me	MeO	-CH ₂ -	2-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Cl-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-F-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Cl-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Cl-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Br-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Me-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Br-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Me-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Br-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Me-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Et-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -Pr-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Et-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -Pr-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Et-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -Pr-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CN-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	4- <i>c</i> -Pr-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CN-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	3- <i>c</i> -Pr-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CN-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	2- <i>c</i> -Pr-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ -Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ O-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ -Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ O-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ -Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ O-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Ac-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-(CF ₃ C=O)-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Ac-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-(CF ₃ C=O)-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Ac-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	5-(CF ₃ C=O)-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-MeO-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-EtO-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-MeO-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-EtO-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-MeO-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-EtO-Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-NO ₂ -Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-NO ₂ -Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-NO ₂ -Ph	Me
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-F-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-F-benzyl	H

<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Cl-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-F-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Br-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Me-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Br-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Me-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Br-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Me-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Et-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Et-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Et-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CN-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CN-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CN-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-Ac-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	4-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	4-EtO-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	3-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	3-EtO-benzyl	H
Cl	MeO	-CH ₂ -	2-MeO-benzyl	H	Cl	MeO	-CH ₂ -	2-EtO-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-Cl-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-F-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-Cl-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-F-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-Cl-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-F-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-Br-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-Me-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-Br-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-Me-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-Br-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-Me-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-Et-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-Et-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-Et-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-CN-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-CN-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3- <i>c</i> -Pr-Ph	H

<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R⁴</u>	<u>Q</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14t}</u>
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-CN-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-CF ₃ O-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-CF ₃ O-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-CF ₃ -Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-CF ₃ O-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-Ac-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-Ac-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-Ac-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	5-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-MeO-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-EtO-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-MeO-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-EtO-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-MeO-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-EtO-Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-NO ₂ -Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-NO ₂ -Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-NO ₂ -Ph	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-Cl-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-F benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-Cl-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-F-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-Cl-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-F-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-Br-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-Me-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-Br-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-Me-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-Br-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-Me-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-Et-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-Et-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-Et-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-CN-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-CN-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-CN-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-CF ₃ -benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-CHF ₂ O benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-Ac-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-Ac-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-Ac-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-MeO-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-EtO-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-MeO-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-EtO-benzyl	H

R^1	R^4	Q	R^{14a}	R^{14b}	R^1	R^4	Q	R^{14a}	R^{14b}
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-MeO-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-EtO-benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	4-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	3-NO ₂ -benzyl	H
Cl	MeNH	-CH ₂ -	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	MeNH	-CH ₂ -	2-NO ₂ -benzyl	H

TABELA 6



R^1	R^{14a}	R^{14b}	R^1	R^{14a}	R^{14b}
Cl	4-Cl-Ph	H	Cl	4-F-Ph	H
Cl	3-Cl-Ph	H	Cl	3-F-Ph	H
Cl	2-Cl-Ph	H	Cl	2-F-Ph	H
Cl	4-Br-Ph	H	Cl	4-Me-Ph	H
Cl	3-Br-Ph	H	Cl	3-Me-Ph	H
Cl	2-Br-Ph	H	Cl	2-Me-Ph	H
Cl	4-Et-Ph	H	Cl	4- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	3-Et-Ph	H	Cl	3- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	2-Et-Ph	H	Cl	2- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	4-CN-Ph	H	Cl	4- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	3-CN-Ph	H	Cl	3- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	2-CN-Ph	H	Cl	2- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	4-CF ₃ -Ph	H	Cl	4-CF ₃ O-Ph	H
Cl	3-CF ₃ -Ph	H	Cl	3-CF ₃ O-Ph	H
Cl	2-CF ₃ -Ph	H	Cl	2-CF ₃ O-Ph	H
Cl	4-Ac-Ph	H	Cl	2-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	3-Ac-Ph	H	Cl	3-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	2-Ac-Ph	H	Cl	4-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	4-MeO-Ph	H	Cl	4-EtO-Ph	H
Cl	3-MeO-Ph	H	Cl	3-EtO-Ph	H
Cl	2-MeO-Ph	H	Cl	2-EtO-Ph	H
Cl	4- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	4-NO ₂ -Ph	H
Cl	3- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	3-NO ₂ -Ph	H

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	2- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	2-NO ₂ -Ph	H
Cl	4-I-Ph	H	Cl	4-(CO ₂ Me)-Ph	H
Cl	3-I-Ph	H	Cl	3-(CO ₂ Me)-Ph	H
Cl	2-I-Ph	H	Cl	2-(CO ₂ Me)-Ph	H
Cl	4-Me(C=NH)-Ph	H	Cl	4-Me(C=NMe)-Ph	H
Cl	3-Me(C=NH)-Ph	H	Cl	3-Me(C=NMe)-Ph	H
Cl	2-Me(C=NH)-Ph	H	Cl	2-Me(C=NMe)-Ph	H
Cl	4-Me(C=NOMe)-Ph	H	Cl	4-Me(C=NOEt)-Ph	H
Cl	3-Me(C=NOMe)-Ph	H	Cl	3-Me(C=NOEt)-Ph	H
Cl	2-Me(C=NOMe)-Ph	H	Cl	2-Me(C=NOEt)-Ph	H
Cl	4-MeNH(C=O)-Ph	H	Cl	4-SiMe ₃ -Ph	H
Cl	3-MeNH(C=O)-Ph	H	Cl	3-SiMe ₃ -Ph	H
Cl	2-MeNH(C=O)-Ph	H	Cl	2-SiMe ₃ -Ph	H
Cl	2,6-di-Cl-Ph	H	Cl	2,6-di-F-Ph	H
Cl	2,5-di-Cl-Ph	H	Cl	2,5-di-F-Ph	H
Cl	2,4-di-Cl-Ph	H	Cl	2,4-di-F-Ph	H
Cl	3,3-di-Cl-Ph	H	Cl	3,3-di-F-Ph	H
Cl	3,4-di-Cl-Ph	H	Cl	3,4-di-F-Ph	H
Cl	2,6-di-Me-Ph	H	Cl	2,6-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	2,5-di-Me-Ph	H	Cl	2,5-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	2,4-di-Me-Ph	H	Cl	2,4-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	3,3-di-Me-Ph	H	Cl	3,3-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	3,4-di-Me-Ph	H	Cl	3,4-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	2,6-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	2,6-di-MeO-Ph	H
Cl	2,5-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	2,5-di-MeO-Ph	H
Cl	2,4-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	2,4-di-MeO-Ph	H
Cl	3,3-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	3,3-di-MeO-Ph	H
Cl	3,4-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	3,4-di-MeO-Ph	H
Cl	4-CHF ₂ -Ph	H	Cl	4-CHF ₂ O-Ph	H
Cl	3-CHF ₂ -Ph	H	Cl	3-CHF ₂ O-Ph	H
Cl	2-CHF ₂ -Ph	H	Cl	2-CHF ₂ O-Ph	H
Cl	2-F-3-Cl-Ph	H	Cl	2-F-3-CF ₃ -Ph	H
Cl	2-F-4-Cl-Ph	H	Cl	2-F-4-CF ₃ -Ph	H
Cl	2-F-5-Cl-Ph	H	Cl	2-F-5-CF ₃ -Ph	H
Cl	2-F-6-Cl-Ph	H	Cl	2-F-6-CF ₃ -Ph	H
Cl	3-F-2-Cl-Ph	H	Cl	3-F-2-CF ₃ -Ph	H

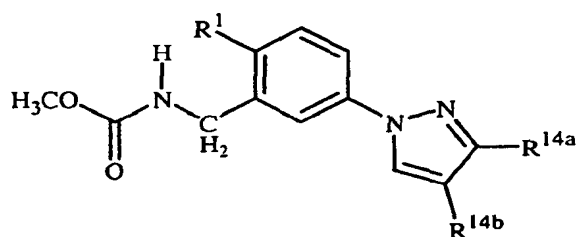
<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	3-F-4-Cl-Ph	H	Cl	3-F-4-CF ₃ -Ph	H
Cl	3-F-5-Cl-Ph	H	Cl	3-F-5-CF ₃ -Ph	H
Cl	3-F-6-Cl-Ph	H	Cl	3-F-6-CF ₃ -Ph	H
Cl	4-F-3-Cl-Ph	H	Cl	4-F-3-CF ₃ -Ph	H
Cl	4-F-2-Cl-Ph	H	Cl	4-F-2-CF ₃ -Ph	H
Cl	pyrid-2-yl	H	Cl	pyrid-3-yl	H
Cl	pyrid-4-yl	H	Cl	triazin-1-yl	H
Cl	3-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	2-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	4-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	4-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	5-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	5-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	6-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	6-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	2-CF ₃ -pyrid-4-yl	H	Cl	2-Me-pyrid-4-yl	H
Cl	3-CF ₃ -pyrid-4-yl	H	Cl	3-Me-pyrid-4-yl	H
Cl	3-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	2-Me-pyrid-3-yl	H
Cl	4-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	4-Me-pyrid-3-yl	H
Cl	5-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	5-Me-pyrid-3-yl	H
Cl	6-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	6-Me-pyrid-3-yl	H
Cl	5-Cl-thien-2-yl	H	Cl	5-F-thien-2-yl	H
Cl	4-Cl-thien-2-yl	H	Cl	4-F-thien-2-yl	H
Cl	3-Cl-thien-2-yl	H	Cl	3-F-thien-2-yl	H
Cl	5-CF ₃ -thien-2-yl	H	Cl	5-OCF ₃ -thien-2-yl	H
Cl	4-CF ₃ -thien-2-yl	H	Cl	4-OCF ₃ -thien-2-yl	H
Cl	3-CF ₃ -thien-2-yl	H	Cl	3-OCF ₃ -thien-2-yl	H
Cl	5-Cl-thien-3-yl	H	Cl	5-F-thien-3-yl	H
Cl	4-Cl-thien-3-yl	H	Cl	4-F-thien-3-yl	H
Cl	2-Cl-thien-3-yl	H	Cl	2-F-thien-3-yl	H
Cl	5-CF ₃ -thien-3-yl	H	Cl	5-OCF ₃ -thien-3-yl	H
Cl	4-CF ₃ -thien-3-yl	H	Cl	4-OCF ₃ -thien-3-yl	H
Cl	2-CF ₃ -thien-3-yl	H	Cl	2-OCF ₃ -thien-3-yl	H
Cl	thien-2-yl	H	Cl	thien-3-yl	H
Cl	4-Cl-benzyl	H	Cl	4-F-benzyl	H
Cl	3-Cl-benzyl	H	Cl	3-F-benzyl	H
Cl	2-Cl-benzyl	H	Cl	2-F-benzyl	H
Cl	4-Br-benzyl	H	Cl	4-Me-benzyl	H
Cl	3-Br-benzyl	H	Cl	3-Me-benzyl	H
Cl	2-Br-benzyl	H	Cl	2-Me-benzyl	H

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	4-Et-benzyl	H	Cl	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	3-Et-benzyl	H	Cl	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	2-Et-benzyl	H	Cl	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	4-CN-benzyl	H	Cl	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	3-CN-benzyl	H	Cl	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	2-CN-benzyl	H	Cl	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	4-CF ₃ -benzyl	H	Cl	4-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	3-CF ₃ -benzyl	H	Cl	3-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	2-CF ₃ -benzyl	H	Cl	2-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	4-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	4-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	3-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	3-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	2-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	2-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	4-Ac-benzyl	H	Cl	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	3-Ac-benzyl	H	Cl	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	2-Ac-benzyl	H	Cl	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	4-MeO-benzyl	H	Cl	4-EtO-benzyl	H
Cl	3-MeO-benzyl	H	Cl	3-EtO-benzyl	H
Cl	2-MeO-benzyl	H	Cl	2-EtO-benzyl	H
Cl	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	4-NO ₂ -benzyl	H
Cl	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	3-NO ₂ -benzyl	H
Cl	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	2-NO ₂ -benzyl	H
Cl	benzyl	H	Cl	phenethyl	H
Cl	methyl	H	Cl	ethyl	H
Cl	<i>n</i> -propyl	H	Cl	<i>n</i> -butyl	H
Cl	<i>i</i> -propyl	H	Cl	<i>i</i> -butyl	H
Cl	<i>c</i> -propyl	H	Cl	<i>c</i> -butyl	H
Cl	<i>n</i> -pentyl	H	Cl	<i>s</i> -butyl	H
Cl	<i>c</i> -pentyl	H	Cl	<i>n</i> -hexyl	H
Cl	<i>n</i> -heptyl	H	Cl	<i>c</i> -hexyl	H
Cl	1-naphthyl	H	Cl	2-naphthyl	H
Me	4-Cl-Ph	H	Me	4-F-Ph	H
Me	3-Cl-Ph	H	Me	3-F-Ph	H
Me	2-Cl-Ph	H	Me	2-F-Ph	H
Me	4-Br-Ph	H	Me	4-Me-Ph	H
Me	3-Br-Ph	H	Me	3-Me-Ph	H
Me	2-Br-Ph	H	Me	2-Me-Ph	H

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Me	4-Et-Ph	H	Me	4- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Me	3-Et-Ph	H	Me	3- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Me	2-Et-Ph	H	Me	2- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Me	4-CN-Ph	H	Me	4- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Me	3-CN-Ph	H	Me	3- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Me	2-CN-Ph	H	Me	2- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Me	4-CF ₃ -Ph	H	Me	4-CF ₃ O-Ph	H
Me	3-CF ₃ -Ph	H	Me	3-CF ₃ O-Ph	H
Me	2-CF ₃ -Ph	H	Me	2-CF ₃ O-Ph	H
Me	4-Ac-Ph	H	Me	2-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Me	3-Ac-Ph	H	Me	3-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Me	2-Ac-Ph	H	Me	4-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Me	4-MeO-Ph	H	Me	4-EtO-Ph	H
Me	3-MeO-Ph	H	Me	3-EtO-Ph	H
Me	2-MeO-Ph	H	Me	2-EtO-Ph	H
Me	4- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Me	4-NO ₂ -Ph	H
Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Me	3-NO ₂ -Ph	H
Me	2- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Me	2-NO ₂ -Ph	H
Me	4-Cl-benzyl	H	Me	4-F-benzyl	H
Me	3-Cl-benzyl	H	Me	3-F-benzyl	H
Me	2-Cl-benzyl	H	Me	2-F-benzyl	H
Me	4-Br-benzyl	H	Me	4-Me-benzyl	H
Me	3-Br-benzyl	H	Me	3-Me-benzyl	H
Me	2-Br-benzyl	H	Me	2-Me-benzyl	H
Me	4-Et-benzyl	H	Me	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Me	3-Et-benzyl	H	Me	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Me	2-Et-benzyl	H	Me	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Me	4-CN-benzyl	H	Me	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Me	3-CN-benzyl	H	Me	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Me	2-CN-benzyl	H	Me	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Me	4-CF ₃ -benzyl	H	Me	4-CF ₃ O-benzyl	H
Me	3-CF ₃ -benzyl	H	Me	3-CF ₃ O-benzyl	H
Me	2-CF ₃ -benzyl	H	Me	2-CF ₃ O-benzyl	H
Me	4-CHF ₂ -benzyl	H	Me	4-CHF ₂ O-benzyl	H
Me	3-CHF ₂ -benzyl	H	Me	3-CHF ₂ O-benzyl	H
Me	2-CHF ₂ -benzyl	H	Me	2-CHF ₂ O-benzyl	H

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Me	4-Ac-benzyl	H	Me	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Me	3-Ac-benzyl	H	Me	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Me	2-Ac-benzyl	H	Me	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Me	4-MeO-benzyl	H	Me	4-EtO-benzyl	H
Me	3-MeO-benzyl	H	Me	3-EtO-benzyl	H
Me	2-MeO-benzyl	H	Me	2-EtO-benzyl	H
Me	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Me	4-NO ₂ -benzyl	H
Me	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Me	3-NO ₂ -benzyl	H
Me	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Me	2-NO ₂ -benzyl	H
Me	4-Cl-Ph	Me	Me	4-F-Ph	Me
Me	3-Cl-Ph	Me	Me	3-F-Ph	Me
Me	2-Cl-Ph	Me	Me	2-F-Ph	Me
Me	4-Br-Ph	Me	Me	4-Me-Ph	Me
Me	3-Br-Ph	Me	Me	3-Me-Ph	Me
Me	2-Br-Ph	Me	Me	2-Me-Ph	Me
Me	4-Et-Ph	Me	Me	4- <i>i</i> -Pr-Ph	Me
Me	3-Et-Ph	Me	Me	3- <i>i</i> -Pr-Ph	Me
Me	2-Et-Ph	Me	Me	2- <i>i</i> -Pr-Ph	Me
Me	4-CN-Ph	Me	Me	4- <i>c</i> -Pr-Ph	Me
Me	3-CN-Ph	Me	Me	3- <i>c</i> -Pr-Ph	Me
Me	2-CN-Ph	Me	Me	2- <i>c</i> -Pr-Ph	Me
Me	4-CF ₃ -Ph	Me	Me	4-CF ₃ O-Ph	Me
Me	3-CF ₃ -Ph	Me	Me	3-CF ₃ O-Ph	Me
Me	2-CF ₃ -Ph	Me	Me	2-CF ₃ O-Ph	Me
Me	4-Ac-Ph	Me	Me	2-(CF ₃ C=O)-Ph	Me
Me	3-Ac-Ph	Me	Me	3-(CF ₃ C=O)-Ph	Me
Me	2-Ac-Ph	Me	Me	4-(CF ₃ C=O)-Ph	Me
Me	4-MeO-Ph	Me	Me	4-EtO-Ph	Me
Me	3-MeO-Ph	Me	Me	3-EtO-Ph	Me
Me	2-MeO-Ph	Me	Me	2-EtO-Ph	Me
Me	4- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	Me	4-NO ₂ -Ph	Me
Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	Me	3-NO ₂ -Ph	Me
Me	2- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	Me	2-NO ₂ -Ph	Me
Me	4-Cl-benzyl	Me	Me	4-F-benzyl	Me
Me	3-Cl-benzyl	Me	Me	3-F-benzyl	Me
Me	2-Cl-benzyl	Me	Me	2-F-benzyl	Me

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Me	4-Br-benzyl	Me	Me	4-Me-benzyl	Me
Me	3-Br-benzyl	Me	Me	3-Me-benzyl	Me
Me	2-Br-benzyl	Me	Me	2-Me-benzyl	Me
Me	4-Et-benzyl	Me	Me	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	Me
Me	3-Et-benzyl	Me	Me	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	Me
Me	2-Et-benzyl	Me	Me	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	Me
Me	4-CN-benzyl	Me	Me	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	Me
Me	3-CN-benzyl	Me	Me	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	Me
Me	2-CN-benzyl	Me	Me	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	Me
Me	4-CF ₃ -benzyl	Me	Me	4-CF ₃ O-benzyl	Me
Me	3-CF ₃ -benzyl	Me	Me	3-CF ₃ O-benzyl	Me
Me	2-CF ₃ -benzyl	Me	Me	2-CF ₃ O-benzyl	Me
Me	4-CHF ₂ -benzyl	Me	Me	4-CHF ₂ O-benzyl	Me
Me	3-CHF ₂ -benzyl	Me	Me	3-CHF ₂ O-benzyl	Me
Me	2-CHF ₂ -benzyl	Me	Me	2-CHF ₂ O-benzyl	Me
Me	4-Ac-benzyl	Me	Me	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	Me
Me	3-Ac-benzyl	Me	Me	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	Me
Me	2-Ac-benzyl	Me	Me	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	Me
Me	4-MeO-benzyl	Me	Me	4-EtO-benzyl	Me
Me	3-MeO-benzyl	Me	Me	3-EtO-benzyl	Me
Me	2-MeO-benzyl	Me	Me	2-EtO-benzyl	Me
Me	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	Me	4-NO ₂ -benzyl	Me
Me	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	Me	3-NO ₂ -benzyl	Me
Me	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	Me	2-NO ₂ -benzyl	Me

TABELA 7

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	4-Cl-Ph	H	Cl	4-F-Ph	H
Cl	3-Cl-Ph	H	Cl	3-F-Ph	H
Cl	2-Cl-Ph	H	Cl	2-F-Ph	H

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	4-Br-Ph	H	Cl	4-Me-Ph	H
Cl	3-Br-Ph	H	Cl	3-Me-Ph	H
Cl	2-Br-Ph	H	Cl	2-Me-Ph	H
Cl	4-Et-Ph	H	Cl	4- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	3-Et-Ph	H	Cl	3- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	2-Et-Ph	H	Cl	2- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Cl	4-CN-Ph	H	Cl	4- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	3-CN-Ph	H	Cl	3- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	2-CN-Ph	H	Cl	2- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Cl	4-CF ₃ -Ph	H	Cl	4-CF ₃ O-Ph	H
Cl	3-CF ₃ -Ph	H	Cl	3-CF ₃ O-Ph	H
Cl	2-CF ₃ -Ph	H	Cl	2-CF ₃ O-Ph	H
Cl	4-Ac-Ph	H	Cl	2-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	3-Ac-Ph	H	Cl	3-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	2-Ac-Ph	H	Cl	4-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Cl	4-MeO-Ph	H	Cl	4-EtO-Ph	H
Cl	3-MeO-Ph	H	Cl	3-EtO-Ph	H
Cl	2-MeO-Ph	H	Cl	2-EtO-Ph	H
Cl	4- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	4-NO ₂ -Ph	H
Cl	3- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	3-NO ₂ -Ph	H
Cl	2- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Cl	2-NO ₂ -Ph	H
Cl	4-I-Ph	H	Cl	4-(CO ₂ Me)-Ph	H
Cl	3-I-Ph	H	Cl	3-(CO ₂ Me)-Ph	H
Cl	2-I-Ph	H	Cl	2-(CO ₂ Me)-Ph	H
Cl	4-Me(C=NH)-Ph	H	Cl	4-Me(C=NMe)-Ph	H
Cl	3-Me(C=NH)-Ph	H	Cl	3-Me(C=NMe)-Ph	H
Cl	2-Me(C=NH)-Ph	H	Cl	2-Me(C=NMe)-Ph	H
Cl	4-Me(C=NOMe)-Ph	H	Cl	4-Me(C=NOEt)-Ph	H
Cl	3-Me(C=NOMe)-Ph	H	Cl	3-Me(C=NOEt)-Ph	H
Cl	2-Me(C=NOMe)-Ph	H	Cl	2-Me(C=NOEt)-Ph	H
Cl	4-MeNH(C=O)-Ph	H	Cl	4-SiMe ₃ -Ph	H
Cl	3-MeNH(C=O)-Ph	H	Cl	3-SiMe ₃ -Ph	H
Cl	2-MeNH(C=O)-Ph	H	Cl	2-SiMe ₃ -Ph	H
Cl	2,6-di-Cl-Ph	H	Cl	2,6-di-F-Ph	H
Cl	2,5-di-Cl-Ph	H	Cl	2,5-di-F-Ph	H
Cl	2,4-di-Cl-Ph	H	Cl	2,4-di-F-Ph	H

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	3,3-di-Cl-Ph	H	Cl	3,3-di-F-Ph	H
Cl	3,4-di-Cl-Ph	H	Cl	3,4-di-F-Ph	H
Cl	2,6-di-Me-Ph	H	Cl	2,6-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	2,5-di-Me-Ph	H	Cl	2,5-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	2,4-di-Me-Ph	H	Cl	2,4-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	3,3-di-Me-Ph	H	Cl	3,3-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	3,4-di-Me-Ph	H	Cl	3,4-di-CF ₃ -Ph	H
Cl	2,6-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	2,6-di-MeO-Ph	H
Cl	2,5-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	2,5-di-MeO-Ph	H
Cl	2,4-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	2,4-di-MeO-Ph	H
Cl	3,3-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	3,3-di-MeO-Ph	H
Cl	3,4-di-CF ₃ O-Ph	H	Cl	3,4-di-MeO-Ph	H
Cl	4-CHF ₂ -Ph	H	Cl	4-CHF ₂ O-Ph	H
Cl	3-CHF ₂ -Ph	H	Cl	3-CHF ₂ O-Ph	H
Cl	2-CHF ₂ -Ph	H	Cl	2-CHF ₂ O-Ph	H
Cl	2-F-3-Cl-Ph	H	Cl	2-F-3-CF ₃ -Ph	H
Cl	2-F-4-Cl-Ph	H	Cl	2-F-4-CF ₃ -Ph	H
Cl	2-F-5-Cl-Ph	H	Cl	2-F-5-CF ₃ -Ph	H
Cl	2-F-6-Cl-Ph	H	Cl	2-F-6-CF ₃ -Ph	H
Cl	3-F-2-Cl-Ph	H	Cl	3-F-2-CF ₃ -Ph	H
Cl	3-F-4-Cl-Ph	H	Cl	3-F-4-CF ₃ -Ph	H
Cl	3-F-5-Cl-Ph	H	Cl	3-F-5-CF ₃ -Ph	H
Cl	3-F-6-Cl-Ph	H	Cl	3-F-6-CF ₃ -Ph	H
Cl	4-F-3-Cl-Ph	H	Cl	4-F-3-CF ₃ -Ph	H
Cl	4-F-2-Cl-Ph	H	Cl	4-F-2-CF ₃ -Ph	H
Cl	pyrid-2-yl	H	Cl	pyrid-3-yl	H
Cl	pyrid-4-yl	H	Cl	triazin-1-yl	H
Cl	3-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	2-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	4-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	4-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	5-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	5-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	6-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	Cl	6-CF ₃ -pyrid-3-yl	H
Cl	2-CF ₃ -pyrid-4-yl	H	Cl	2-Me-pyrid-4-yl	H
Cl	3-CF ₃ -pyrid-4-yl	H	Cl	3-Me-pyrid-4-yl	H
Cl	3-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	2-Me-pyrid-3-yl	H
Cl	4-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	4-Me-pyrid-3-yl	H
Cl	5-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	5-Me-pyrid-3-yl	H

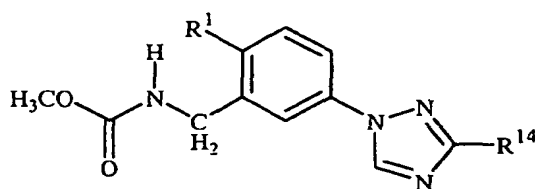
<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	6-Me-pyrid-2-yl	H	Cl	6-Me-pyrid-3-yl	H
Cl	5-Cl-thien-2-yl	H	Cl	5-F-thien-2-yl	H
Cl	4-Cl-thien-2-yl	H	Cl	4-F-thien-2-yl	H
Cl	3-Cl-thien-2-yl	H	Cl	3-F-thien-2-yl	H
Cl	5-CF ₃ -thien-2-yl	H	Cl	5-OCF ₃ -thien-2-yl	H
Cl	4-CF ₃ -thien-2-yl	H	Cl	4-OCF ₃ -thien-2-yl	H
Cl	3-CF ₃ -thien-2-yl	H	Cl	3-OCF ₃ -thien-2-yl	H
Cl	5-Cl-thien-3-yl	H	Cl	5-F-thien-3-yl	H
Cl	4-Cl-thien-3-yl	H	Cl	4-F-thien-3-yl	H
Cl	2-Cl-thien-3-yl	H	Cl	2-F-thien-3-yl	H
Cl	5-CF ₃ -thien-3-yl	H	Cl	5-OCF ₃ -thien-3-yl	H
Cl	4-CF ₃ -thien-3-yl	H	Cl	4-OCF ₃ -thien-3-yl	H
Cl	2-CF ₃ -thien-3-yl	H	Cl	2-OCF ₃ -thien-3-yl	H
Cl	thien-2-yl	H	Cl	thien-3-yl	H
Cl	4-Cl-benzyl	H	Cl	4-F-benzyl	H
Cl	3-Cl-benzyl	H	Cl	3-F-benzyl	H
Cl	2-Cl-benzyl	H	Cl	2-F-benzyl	H
Cl	4-Br-benzyl	H	Cl	4-Me-benzyl	H
Cl	3-Br-benzyl	H	Cl	3-Me-benzyl	H
Cl	2-Br-benzyl	H	Cl	2-Me-benzyl	H
Cl	4-Et-benzyl	H	Cl	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	3-Et-benzyl	H	Cl	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	2-Et-benzyl	H	Cl	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Cl	4-CN-benzyl	H	Cl	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	3-CN-benzyl	H	Cl	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	2-CN-benzyl	H	Cl	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Cl	4-CF ₃ -benzyl	H	Cl	4-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	3-CF ₃ -benzyl	H	Cl	3-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	2-CF ₃ -benzyl	H	Cl	2-CF ₃ O-benzyl	H
Cl	4-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	4-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	3-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	3-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	2-CHF ₂ -benzyl	H	Cl	2-CHF ₂ O-benzyl	H
Cl	4-Ac-benzyl	H	Cl	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	3-Ac-benzyl	H	Cl	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	2-Ac-benzyl	H	Cl	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Cl	4-MeO-benzyl	H	Cl	4-EtO-benzyl	H

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	3-MeO-benzyl	H	Cl	3-EtO-benzyl	H
Cl	2-MeO-benzyl	H	Cl	2-EtO-benzyl	H
Cl	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	4-NO ₂ -benzyl	H
Cl	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	3-NO ₂ -benzyl	H
Cl	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Cl	2-NO ₂ -benzyl	H
Cl	benzyl	H	Cl	phenethyl	H
Cl	methyl	H	Cl	ethyl	H
Cl	<i>n</i> -propyl	H	Cl	<i>n</i> -butyl	H
Cl	<i>i</i> -propyl	H	Cl	<i>i</i> -butyl	H
Cl	<i>c</i> -propyl	H	Cl	<i>c</i> -butyl	H
Cl	<i>n</i> -pentyl	H	Cl	<i>s</i> -butyl	H
Cl	<i>c</i> -pentyl	H	Cl	<i>n</i> -hexyl	H
Cl	<i>n</i> -heptyl	H	Cl	<i>c</i> -hexyl	H
Cl	1-naphthyl	H	Cl	2-naphthyl	H
Me	4-Cl-Ph	H	Me	4-F-Ph	H
Me	3-Cl-Ph	H	Me	3-F-Ph	H
Me	2-Cl-Ph	H	Me	2-F-Ph	H
Me	4-Br-Ph	H	Me	4-Me-Ph	H
Me	3-Br-Ph	H	Me	3-Me-Ph	H
Me	2-Br-Ph	H	Me	2-Me-Ph	H
Me	4-Et-Ph	H	Me	4- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Me	3-Et-Ph	H	Me	3- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Me	2-Et-Ph	H	Me	2- <i>i</i> -Pr-Ph	H
Me	4-CN-Ph	H	Me	4- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Me	3-CN-Ph	H	Me	3- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Me	2-CN-Ph	H	Me	2- <i>c</i> -Pr-Ph	H
Me	4-CF ₃ -Ph	H	Me	4-CF ₃ O-Ph	H
Me	3-CF ₃ -Ph	H	Me	3-CF ₃ O-Ph	H
Me	2-CF ₃ -Ph	H	Me	2-CF ₃ O-Ph	H
Me	4-Ac-Ph	H	Me	2-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Me	3-Ac-Ph	H	Me	3-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Me	2-Ac-Ph	H	Me	4-(CF ₃ C=O)-Ph	H
Me	4-MeO-Ph	H	Me	4-EtO-Ph	H
Me	3-MeO-Ph	H	Me	3-EtO-Ph	H
Me	2-MeO-Ph	H	Me	2-EtO-Ph	H
Me	4- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Me	4-NO ₂ -Ph	H

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Me	3-NO ₂ -Ph	H
Me	2- <i>i</i> -PrO-Ph	H	Me	2-NO ₂ -Ph	H
Me	4-Cl-benzyl	H	Me	4-F-benzyl	H
Me	3-Cl-benzyl	H	Me	3-F-benzyl	H
Me	2-Cl-benzyl	H	Me	2-F-benzyl	H
Me	4-Br-benzyl	H	Me	4-Me-benzyl	H
Me	3-Br-benzyl	H	Me	3-Me-benzyl	H
Me	2-Br-benzyl	H	Me	2-Me-benzyl	H
Me	4-Et-benzyl	H	Me	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Me	3-Et-benzyl	H	Me	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Me	2-Et-benzyl	H	Me	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	H
Me	4-CN-benzyl	H	Me	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Me	3-CN-benzyl	H	Me	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Me	2-CN-benzyl	H	Me	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	H
Me	4-CF ₃ -benzyl	H	Me	4-CF ₃ O-benzyl	H
Me	3-CF ₃ -benzyl	H	Me	3-CF ₃ O-benzyl	H
Me	2-CF ₃ -benzyl	H	Me	2-CF ₃ O-benzyl	H
Me	4-CHF ₂ -benzyl	H	Me	4-CHF ₂ O-benzyl	H
Me	3-CHF ₂ -benzyl	H	Me	3-CHF ₂ O-benzyl	H
Me	2-CHF ₂ -benzyl	H	Me	2-CHF ₂ O-benzyl	H
Me	4-Ac-benzyl	H	Me	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Me	3-Ac-benzyl	H	Me	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Me	2-Ac-benzyl	H	Me	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	H
Me	4-MeO-benzyl	H	Me	4-EtO-benzyl	H
Me	3-MeO-benzyl	H	Me	3-EtO-benzyl	H
Me	2-MeO-benzyl	H	Me	2-EtO-benzyl	H
Me	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Me	4-NO ₂ -benzyl	H
Me	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Me	3-NO ₂ -benzyl	H
Me	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	H	Me	2-NO ₂ -benzyl	H
Me	4-Cl-Ph	Me	Me	4-F-Ph	Me
Me	3-Cl-Ph	Me	Me	3-F-Ph	Me
Me	2-Cl-Ph	Me	Me	2-F-Ph	Me
Me	4-Br-Ph	Me	Me	4-Me-Ph	Me
Me	3-Br-Ph	Me	Me	3-Me-Ph	Me
Me	2-Br-Ph	Me	Me	2-Me-Ph	Me
Me	4-Et-Ph	Me	Me	4- <i>i</i> -Pr-Ph	Me

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Me	3-Et-Ph	Me	Me	3- <i>i</i> -Pr-Ph	Me
Me	2-Et-Ph	Me	Me	2- <i>i</i> -Pr-Ph	Me
Me	4-CN-Ph	Me	Me	4- <i>c</i> -Pr-Ph	Me
Me	3-CN-Ph	Me	Me	3- <i>c</i> -Pr-Ph	Me
Me	2-CN-Ph	Me	Me	2- <i>c</i> -Pr-Ph	Me
Me	4-CF ₃ -Ph	Me	Me	4-CF ₃ O-Ph	Me
Me	3-CF ₃ -Ph	Me	Me	3-CF ₃ O-Ph	Me
Me	2-CF ₃ -Ph	Me	Me	2-CF ₃ O-Ph	Me
Me	4-Ac-Ph	Me	Me	2-(CF ₃ C=O)-Ph	Me
Me	3-Ac-Ph	Me	Me	3-(CF ₃ C=O)-Ph	Me
Me	2-Ac-Ph	Me	Me	4-(CF ₃ C=O)-Ph	Me
Me	4-MeO-Ph	Me	Me	4-EtO-Ph	Me
Me	3-MeO-Ph	Me	Me	3-EtO-Ph	Me
Me	2-MeO-Ph	Me	Me	2-EtO-Ph	Me
Me	4- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	Me	4-NO ₂ -Ph	Me
Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	Me	3-NO ₂ -Ph	Me
Me	2- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	Me	2-NO ₂ -Ph	Me
Me	4-Cl-benzyl	Me	Me	4-F-benzyl	Me
Me	3-Cl-benzyl	Me	Me	3-F-benzyl	Me
Me	2-Cl-benzyl	Me	Me	2-F-benzyl	Me
Me	4-Br-benzyl	Me	Me	4-Me-benzyl	Me
Me	3-Br-benzyl	Me	Me	3-Me-benzyl	Me
Me	2-Br-benzyl	Me	Me	2-Me-benzyl	Me
Me	4-Et-benzyl	Me	Me	4- <i>i</i> -Pr-benzyl	Me
Me	3-Et-benzyl	Me	Me	3- <i>i</i> -Pr-benzyl	Me
Me	2-Et-benzyl	Me	Me	2- <i>i</i> -Pr-benzyl	Me
Me	4-CN-benzyl	Me	Me	4- <i>c</i> -Pr-benzyl	Me
Me	3-CN-benzyl	Me	Me	3- <i>c</i> -Pr-benzyl	Me
Me	2-CN-benzyl	Me	Me	2- <i>c</i> -Pr-benzyl	Me
Me	4-CF ₃ -benzyl	Me	Me	4-CF ₃ O-benzyl	Me
Me	3-CF ₃ -benzyl	Me	Me	3-CF ₃ O-benzyl	Me
Me	2-CF ₃ -benzyl	Me	Me	2-CF ₃ O-benzyl	Me
Me	4-CHF ₂ -benzyl	Me	Me	4-CHF ₂ O-benzyl	Me
Me	3-CHF ₂ -benzyl	Me	Me	3-CHF ₂ O-benzyl	Me
Me	2-CHF ₂ -benzyl	Me	Me	2-CHF ₂ O-benzyl	Me
Me	4-Ac-benzyl	Me	Me	2-(CF ₃ C=O)-benzyl	Me

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Me	3-Ac-benzyl	Me	Me	3-(CF ₃ C=O)-benzyl	Me
Me	2-Ac-benzyl	Me	Me	5-(CF ₃ C=O)-benzyl	Me
Me	4-MeO-benzyl	Me	Me	4-EtO-benzyl	Me
Me	3-MeO-benzyl	Me	Me	3-EtO-benzyl	Me
Me	2-MeO-benzyl	Me	Me	2-EtO-benzyl	Me
Me	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	Me	4-NO ₂ -benzyl	Me
Me	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	Me	3-NO ₂ -benzyl	Me
Me	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	Me	2-NO ₂ -benzyl	Me

TABELA 8

<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>	<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>
Cl	4-Cl-Ph	Cl	4-F-Ph
Cl	3-Cl-Ph	Cl	3-F-Ph
Cl	2-Cl-Ph	Cl	2-F-Ph
Cl	4-Br-Ph	Cl	4-Me-Ph
Cl	3-Br-Ph	Cl	3-Me-Ph
Cl	2-Br-Ph	Cl	2-Me-Ph
Cl	4-Et-Ph	Cl	4- <i>i</i> -Pr-Ph
Cl	3-Et-Ph	Cl	3- <i>i</i> -Pr-Ph
Cl	2-Et-Ph	Cl	2- <i>i</i> -Pr-Ph
Cl	4-CN-Ph	Cl	4- <i>c</i> -Pr-Ph
Cl	3-CN-Ph	Cl	3- <i>c</i> -Pr-Ph
Cl	2-CN-Ph	Cl	2- <i>c</i> -Pr-Ph
Cl	4-CF ₃ -Ph	Cl	4-CF ₃ O-Ph
Cl	3-CF ₃ -Ph	Cl	3-CF ₃ O-Ph
Cl	2-CF ₃ -Ph	Cl	2-CF ₃ O-Ph
Cl	4-Ac-Ph	Cl	2-(CF ₃ C=O)-Ph
Cl	3-Ac-Ph	Cl	3-(CF ₃ C=O)-Ph
Cl	2-Ac-Ph	Cl	4-(CF ₃ C=O)-Ph
Cl	4-MeO-Ph	Cl	4-EtO-Ph
Cl	3-MeO-Ph	Cl	3-EtO-Ph

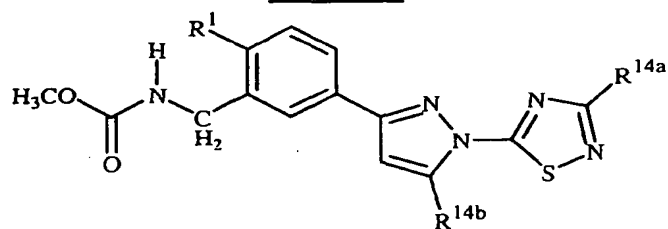
<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>	<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>
Cl	2-MeO-Ph	Cl	2-EtO-Ph
Cl	4- <i>i</i> -PrO-Ph	Cl	4-NO ₂ -Ph
Cl	3- <i>i</i> -PrO-Ph	Cl	3-NO ₂ -Ph
Cl	2- <i>i</i> -PrO-Ph	Cl	2-NO ₂ -Ph
Cl	4-I-Ph	Cl	4-(CO ₂ Me)-Ph
Cl	3-I-Ph	Cl	3-(CO ₂ Me)-Ph
Cl	2-I-Ph	Cl	2-(CO ₂ Me)-Ph
Cl	4-Me(C=NH)-Ph	Cl	4-Me(C=NMe)-Ph
Cl	3-Me(C=NH)-Ph	Cl	3-Me(C=NMe)-Ph
Cl	2-Me(C=NH)-Ph	Cl	2-Me(C=NMe)-Ph
Cl	4-Me(C=NOMe)-Ph	Cl	4-Me(C=NOEt)-Ph
Cl	3-Me(C=NOMe)-Ph	Cl	3-Me(C=NOEt)-Ph
Cl	2-Me(C=NOMe)-Ph	Cl	2-Me(C=NOEt)-Ph
Cl	4-MeNH(C=O)-Ph	Cl	4-SiMe ₃ -Ph
Cl	3-MeNH(C=O)-Ph	Cl	3-SiMe ₃ -Ph
Cl	2-MeNH(C=O)-Ph	Cl	2-SiMe ₃ -Ph
Cl	2,6- <i>di</i> -Cl-Ph	Cl	2,6- <i>di</i> -F-Ph
Cl	2,5- <i>di</i> -Cl-Ph	Cl	2,5- <i>di</i> -F-Ph
Cl	2,4- <i>di</i> -Cl-Ph	Cl	2,4- <i>di</i> -F-Ph
Cl	3,3- <i>di</i> -Cl-Ph	Cl	3,3- <i>di</i> -F-Ph
Cl	3,4- <i>di</i> -Cl-Ph	Cl	3,4- <i>di</i> -F-Ph
Cl	2,6- <i>di</i> -Me-Ph	Cl	2,6- <i>di</i> -CF ₃ -Ph
Cl	2,5- <i>di</i> -Me-Ph	Cl	2,5- <i>di</i> -CF ₃ -Ph
Cl	2,4- <i>di</i> -Me-Ph	Cl	2,4- <i>di</i> -CF ₃ -Ph
Cl	3,3- <i>di</i> -Me-Ph	Cl	3,3- <i>di</i> -CF ₃ -Ph
Cl	3,4- <i>di</i> -Me-Ph	Cl	3,4- <i>di</i> -CF ₃ -Ph
Cl	2,6- <i>di</i> -CF ₃ O-Ph	Cl	2,6- <i>di</i> -MeO-Ph
Cl	2,5- <i>di</i> -CF ₃ O-Ph	Cl	2,5- <i>di</i> -MeO-Ph
Cl	2,4- <i>di</i> -CF ₃ O-Ph	Cl	2,4- <i>di</i> -MeO-Ph
Cl	3,3- <i>di</i> -CF ₃ O-Ph	Cl	3,3- <i>di</i> -MeO-Ph
Cl	3,4- <i>di</i> -CF ₃ O-Ph	Cl	3,4- <i>di</i> -MeO-Ph
Cl	4-CHF ₂ -Ph	Cl	4-CHF ₂ O-Ph
Cl	3-CHF ₂ -Ph	Cl	3-CHF ₂ O-Ph
Cl	2-CHF ₂ -Ph	Cl	2-CHF ₂ O-Ph
Cl	2-F-3-Cl-Ph	Cl	2-F-3-CF ₃ -Ph
Cl	2-F-4-Cl-Ph	Cl	2-F-4-CF ₃ -Ph

<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>	<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>
Cl	2-F-5-Cl-Ph	Cl	2-F-5-CF ₃ -Ph
Cl	2-F-6-Cl-Ph	Cl	2-F-6-CF ₃ -Ph
Cl	3-F-2-Cl-Ph	Cl	3-F-2-CF ₃ -Ph
Cl	3-F-4-Cl-Ph	Cl	3-F-4-CF ₃ -Ph
Cl	3-F-5-Cl-Ph	Cl	3-F-5-CF ₃ -Ph
Cl	3-F-6-Cl-Ph	Cl	3-F-6-CF ₃ -Ph
Cl	4-F-3-Cl-Ph	Cl	4-F-3-CF ₃ -Ph
Cl	4-F-2-Cl-Ph	Cl	4-F-2-CF ₃ -Ph
Cl	pyrid-2-yl	Cl	pyrid-3-yl
Cl	pyrid-4-yl	Cl	2,4,6-triazin-1-yl
Cl	3-CF ₃ -pyrid-2-yl	Cl	2-CF ₃ -pyrid-3-yl
Cl	4-CF ₃ -pyrid-2-yl	Cl	4-CF ₃ -pyrid-3-yl
Cl	5-CF ₃ -pyrid-2-yl	Cl	5-CF ₃ -pyrid-3-yl
Cl	6-CF ₃ -pyrid-2-yl	Cl	6-CF ₃ -pyrid-3-yl
Cl	2-CF ₃ -pyrid-4-yl	Cl	2-Me-pyrid-4-yl
Cl	3-CF ₃ -pyrid-4-yl	Cl	3-Me-pyrid-4-yl
Cl	3-Me-pyrid-2-yl	Cl	2-Me-pyrid-3-yl
Cl	4-Me-pyrid-2-yl	Cl	4-Me-pyrid-3-yl
Cl	5-Me-pyrid-2-yl	Cl	5-Me-pyrid-3-yl
Cl	6-Me-pyrid-2-yl	Cl	6-Me-pyrid-3-yl
Cl	5-Cl-thien-2-yl	Cl	5-F-thien-2-yl
Cl	4-Cl-thien-2-yl	Cl	4-F-thien-2-yl
Cl	3-Cl-thien-2-yl	Cl	3-F-thien-2-yl
Cl	5-CF ₃ -thien-2-yl	Cl	5-OCF ₃ -thien-2-yl
Cl	4-CF ₃ -thien-2-yl	Cl	4-OCF ₃ -thien-2-yl
Cl	3-CF ₃ -thien-2-yl	Cl	3-OCF ₃ -thien-2-yl
Cl	5-Cl-thien-3-yl	Cl	5-F-thien-3-yl
Cl	4-Cl-thien-3-yl	Cl	4-F-thien-3-yl
Cl	2-Cl-thien-3-yl	Cl	2-F-thien-3-yl
Cl	5-CF ₃ -thien-3-yl	Cl	5-OCF ₃ -thien-3-yl
Cl	4-CF ₃ -thien-3-yl	Cl	4-OCF ₃ -thien-3-yl
Cl	2-CF ₃ -thien-3-yl	Cl	2-OCF ₃ -thien-3-yl
Cl	thien-2-yl	Cl	thien-3-yl
Cl	4-Cl-benzyl	Cl	4-F-benzyl
Cl	3-Cl-benzyl	Cl	3-F-benzyl
Cl	2-Cl-benzyl	Cl	2-F-benzyl

<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>	<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>
Cl	4-Br-benzyl	Cl	4-Me-benzyl
Cl	3-Br-benzyl	Cl	3-Me-benzyl
Cl	2-Br-benzyl	Cl	2-Me-benzyl
Cl	4-Et-benzyl	Cl	4- <i>i</i> -Pr-benzyl
Cl	3-Et-benzyl	Cl	3- <i>i</i> -Pr-benzyl
Cl	2-Et-benzyl	Cl	2- <i>i</i> -Pr-benzyl
Cl	4-CN-benzyl	Cl	4- <i>c</i> -Pr-benzyl
Cl	3-CN-benzyl	Cl	3- <i>c</i> -Pr-benzyl
Cl	2-CN-benzyl	Cl	2- <i>c</i> -Pr-benzyl
Cl	4-CF ₃ -benzyl	Cl	4-CF ₃ O-benzyl
Cl	3-CF ₃ -benzyl	Cl	3-CF ₃ O-benzyl
Cl	2-CF ₃ -benzyl	Cl	2-CF ₃ O-benzyl
Cl	4-CHF ₂ -benzyl	Cl	4-CHF ₂ O-benzyl
Cl	3-CHF ₂ -benzyl	Cl	3-CHF ₂ O-benzyl
Cl	2-CHF ₂ -benzyl	Cl	2-CHF ₂ O-benzyl
Cl	4-Ac-benzyl	Cl	2-(CF ₃ C=O)-benzyl
Cl	3-Ac-benzyl	Cl	3-(CF ₃ C=O)-benzyl
Cl	2-Ac-benzyl	Cl	5-(CF ₃ C=O)-benzyl
Cl	4-MeO-benzyl	Cl	4-EtO-benzyl
Cl	3-MeO-benzyl	Cl	3-EtO-benzyl
Cl	2-MeO-benzyl	Cl	2-EtO-benzyl
Cl	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	Cl	4-NO ₂ -benzyl
Cl	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	Cl	3-NO ₂ -benzyl
Cl	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	Cl	2-NO ₂ -benzyl
Cl	benzyl	Cl	phenethyl
Cl	methyl	Cl	ethyl
Cl	<i>n</i> -propyl	Cl	<i>n</i> -butyl
Cl	<i>i</i> -propyl	Cl	<i>i</i> -butyl
Cl	<i>c</i> -propyl	Cl	<i>c</i> -butyl
Cl	<i>n</i> -pentyl	Cl	<i>s</i> -butyl
Cl	<i>c</i> -pentyl	Cl	<i>n</i> -hexyl
Cl	<i>n</i> -heptyl	Cl	<i>c</i> -hexyl
Cl	1-naphthyl	Cl	2-naphthyl
Me	4-Cl-Ph	Me	4-F-Ph
Me	3-Cl-Ph	Me	3-F-Ph
Me	2-Cl-Ph	Me	2-F-Ph

<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>	<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>
Me	4-Br-Ph	Me	4-Me-Ph
Me	3-Br-Ph	Me	3-Me-Ph
Me	2-Br-Ph	Me	2-Me-Ph
Me	4-Et-Ph	Me	4- <i>i</i> -Pr-Ph
Me	3-Et-Ph	Me	3- <i>i</i> -Pr-Ph
Me	2-Et-Ph	Me	2- <i>i</i> -Pr-Ph
Me	4-CN-Ph	Me	4- <i>c</i> -Pr-Ph
Me	3-CN-Ph	Me	3- <i>c</i> -Pr-Ph
Me	2-CN-Ph	Me	2- <i>c</i> -Pr-Ph
Me	4-CF ₃ -Ph	Me	4-CF ₃ O-Ph
Me	3-CF ₃ -Ph	Me	3-CF ₃ O-Ph
Me	2-CF ₃ -Ph	Me	2-CF ₃ O-Ph
Me	4-Ac-Ph	Me	2-(CF ₃ C=O)-Ph
Me	3-Ac-Ph	Me	3-(CF ₃ C=O)-Ph
Me	2-Ac-Ph	Me	4-(CF ₃ C=O)-Ph
Me	4-MeO-Ph	Me	4-EtO-Ph
Me	3-MeO-Ph	Me	3-EtO-Ph
Me	2-MeO-Ph	Me	2-EtO-Ph
Me	4- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	4-NO ₂ -Ph
Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	3-NO ₂ -Ph
Me	2- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	2-NO ₂ -Ph
Me	4-Cl-benzyl	Me	4-F-benzyl
Me	3-Cl-benzyl	Me	3-F-benzyl
Me	2-Cl-benzyl	Me	2-F-benzyl
Me	4-Br-benzyl	Me	4-Me-benzyl
Me	3-Br-benzyl	Me	3-Me-benzyl
Me	2-Br-benzyl	Me	2-Me-benzyl
Me	4-Et-benzyl	Me	4- <i>i</i> -Pr-benzyl
Me	3-Et-benzyl	Me	3- <i>i</i> -Pr-benzyl
Me	2-Et-benzyl	Me	2- <i>i</i> -Pr-benzyl
Me	4-CN-benzyl	Me	4- <i>c</i> -Pr-benzyl
Me	3-CN-benzyl	Me	3- <i>c</i> -Pr-benzyl
Me	2-CN-benzyl	Me	2- <i>c</i> -Pr-benzyl
Me	4-CF ₃ -benzyl	Me	4-CF ₃ O-benzyl
Me	3-CF ₃ -benzyl	Me	3-CF ₃ O-benzyl
Me	2-CF ₃ -benzyl	Me	2-CF ₃ O-benzyl

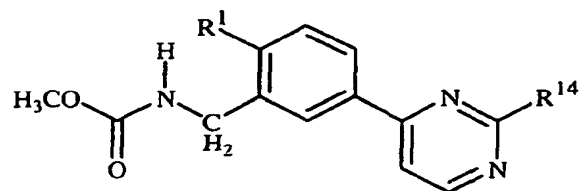
<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>	<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>
Me	4-CHF ₂ -benzyl	Me	4-CHF ₂ O-benzyl
Me	3-CHF ₂ -benzyl	Me	3-CHF ₂ O-benzyl
Me	2-CHF ₂ -benzyl	Me	2-CHF ₂ O-benzyl
Me	4-Ac-benzyl	Me	2-(CF ₃ C=O)-benzyl
Me	3-Ac-benzyl	Me	3-(CF ₃ C=O)-benzyl
Me	2-Ac-benzyl	Me	5-(CF ₃ C=O)-benzyl
Me	4-MeO-benzyl	Me	4-EtO-benzyl
Me	3-MeO-benzyl	Me	3-EtO-benzyl
Me	2-MeO-benzyl	Me	2-EtO-benzyl
Me	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	4-NO ₂ -benzyl
Me	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	3-NO ₂ -benzyl
Me	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	2-NO ₂ -benzyl

TABELA 9

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Cl	Me	H	Cl	Et	H
Cl	<i>n</i> -propyl	H	Cl	<i>c</i> -propyl	H
Cl	<i>n</i> -butyl	H	Cl	<i>c</i> -butyl	H
Cl	<i>n</i> -pentyl	H	Cl	<i>c</i> -pentyl	H
Cl	<i>n</i> -hexyl	H	Cl	<i>c</i> -hexyl	H
Cl	Ph	H	Cl	benzyl	H
Cl	<i>i</i> -propyl	H	Cl	<i>i</i> -butyl	H
Cl	<i>s</i> -butyl	H	Cl	<i>t</i> -butyl	H
Cl	CF ₃	H	Cl	CHF ₂	H
Cl	CF ₃ CH ₂	H	Cl	CF ₂ CH ₂	H
Me	Me	H	Me	Et	H
Me	<i>n</i> -propyl	H	Me	<i>c</i> -propyl	H
Me	<i>n</i> -butyl	H	Me	<i>c</i> -butyl	H
Me	<i>n</i> -pentyl	H	Me	<i>c</i> -pentyl	H
Me	<i>n</i> -hexyl	H	Me	<i>c</i> -hexyl	H

<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>	<u>R¹</u>	<u>R^{14a}</u>	<u>R^{14b}</u>
Me	Ph	H	Me	benzyl	H
Me	<i>i</i> -propyl	H	Me	<i>i</i> -butyl	H
Me	<i>s</i> -butyl	H	Me	<i>t</i> -butyl	H
Me	CF ₃	H	Me	CHF ₂	H
Me	CF ₃ CH ₂	H	Me	CF ₂ CH ₂	H
Cl	Me	Me	Cl	Et	Me
Cl	<i>n</i> -propyl	Me	Cl	<i>c</i> -propyl	Me
Cl	<i>n</i> -butyl	Me	Cl	<i>c</i> -butyl	Me
Cl	<i>n</i> -pentyl	Me	Cl	<i>c</i> -pentyl	Me
Cl	<i>n</i> -hexyl	Me	Cl	<i>c</i> -hexyl	Me
Cl	Ph	Me	Cl	benzyl	Me
Cl	<i>i</i> -propyl	Me	Cl	<i>i</i> -butyl	Me
Cl	<i>s</i> -butyl	Me	Cl	<i>t</i> -butyl	Me
Cl	CF ₃	Me	Cl	CHF ₂	Me
Cl	CF ₃ CH ₂	Me	Cl	CF ₂ CH ₂	Me
Cl	Me	CF ₃	Cl	Et	CF ₃
Cl	<i>n</i> -propyl	CF ₃	Cl	<i>c</i> -propyl	CF ₃
Cl	<i>n</i> -butyl	CF ₃	Cl	<i>c</i> -butyl	CF ₃
Cl	<i>n</i> -pentyl	CF ₃	Cl	<i>c</i> -pentyl	CF ₃
Cl	<i>n</i> -hexyl	CF ₃	Cl	<i>c</i> -hexyl	CF ₃
Cl	Ph	CF ₃	Cl	benzyl	CF ₃
Cl	<i>i</i> -propyl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -butyl	CF ₃
Cl	<i>s</i> -butyl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -butyl	CF ₃
Cl	CF ₃	CF ₃	Cl	CHF ₂	CF ₃
Cl	CF ₃ CH ₂	CF ₃	Cl	CF ₂ CH ₂	CF ₃

TABELA 10



<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>	<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>
Cl	4-Cl-Ph	Cl	4-F-Ph
Cl	3-Cl-Ph	Cl	3-F-Ph
Cl	2-Cl-Ph	Cl	2-F-Ph

<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>	<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>
Cl	4-Br-Ph	Cl	4-Me-Ph
Cl	3-Br-Ph	Cl	3-Me-Ph
Cl	2-Br-Ph	Cl	2-Me-Ph
Cl	4-Et-Ph	Cl	4- <i>i</i> -Pr-Ph
Cl	3-Et-Ph	Cl	3- <i>i</i> -Pr-Ph
Cl	2-Et-Ph	Cl	2- <i>i</i> -Pr-Ph
Cl	4-CN-Ph	Cl	4- <i>c</i> -Pr-Ph
Cl	3-CN-Ph	Cl	3- <i>c</i> -Pr-Ph
Cl	2-CN-Ph	Cl	2- <i>c</i> -Pr-Ph
Cl	4-CF ₃ -Ph	Cl	4-CF ₃ O-Ph
Cl	3-CF ₃ -Ph	Cl	3-CF ₃ O-Ph
Cl	2-CF ₃ -Ph	Cl	2-CF ₃ O-Ph
Cl	4-Ac-Ph	Cl	2-(CF ₃ C=O)-Ph
Cl	3-Ac-Ph	Cl	3-(CF ₃ C=O)-Ph
Cl	2-Ac-Ph	Cl	4-(CF ₃ C=O)-Ph
Cl	4-MeO-Ph	Cl	4-EtO-Ph
Cl	3-MeO-Ph	Cl	3-EtO-Ph
Cl	2-MeO-Ph	Cl	2-EtO-Ph
Cl	4- <i>i</i> -PrO-Ph	Cl	4-NO ₂ -Ph
Cl	3- <i>i</i> -PrO-Ph	Cl	3-NO ₂ -Ph
Cl	2- <i>i</i> -PrO-Ph	Cl	2-NO ₂ -Ph
Cl	4-I-Ph	Cl	4-(CO ₂ Me)-Ph
Cl	3-I-Ph	Cl	3-(CO ₂ Me)-Ph
Cl	2-I-Ph	Cl	2-(CO ₂ Me)-Ph
Cl	4-Me(C=NH)-Ph	Cl	4-Me(C=NMe)-Ph
Cl	3-Me(C=NH)-Ph	Cl	3-Me(C=NMe)-Ph
Cl	2-Me(C=NH)-Ph	Cl	2-Me(C=NMe)-Ph
Cl	4-Me(C=NOMe)-Ph	Cl	4-Me(C=NOEt)-Ph
Cl	3-Me(C=NOMe)-Ph	Cl	3-Me(C=NOEt)-Ph
Cl	2-Me(C=NOMe)-Ph	Cl	2-Me(C=NOEt)-Ph
Cl	4-MeNH(C=O)-Ph	Cl	4-SiMe ₃ -Ph
Cl	3-MeNH(C=O)-Ph	Cl	3-SiMe ₃ -Ph
Cl	2-MeNH(C=O)-Ph	Cl	2-SiMe ₃ -Ph
Cl	pyrid-2-yl	Cl	pyrid-3-yl
Cl	pyrid-4-yl	Cl	2,4,6-triazin-1-yl
Cl	3-CF ₃ -pyrid-2-yl	Cl	2-CF ₃ -pyrid-3-yl

<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>	<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>
Cl	4-CF ₃ -pyrid-2-yl	Cl	4-CF ₃ -pyrid-3-yl
Cl	5-CF ₃ -pyrid-2-yl	Cl	5-CF ₃ -pyrid-3-yl
Cl	6-CF ₃ -pyrid-2-yl	Cl	6-CF ₃ -pyrid-3-yl
Cl	2-CF ₃ -pyrid-4-yl	Cl	2-Me-pyrid-4-yl
Cl	3-CF ₃ -pyrid-4-yl	Cl	3-Me-pyrid-4-yl
Cl	3-Me-pyrid-2-yl	Cl	2-Me-pyrid-3-yl
Cl	4-Me-pyrid-2-yl	Cl	4-Me-pyrid-3-yl
Cl	5-Me-pyrid-2-yl	Cl	5-Me-pyrid-3-yl
Cl	6-Me-pyrid-2-yl	Cl	6-Me-pyrid-3-yl
Cl	4-Cl-benzyl	Cl	4-F-benzyl
Cl	3-Cl-benzyl	Cl	3-F-benzyl
Cl	2-Cl-benzyl	Cl	2-F-benzyl
Cl	4-Br-benzyl	Cl	4-Me-benzyl
Cl	3-Br-benzyl	Cl	3-Me-benzyl
Cl	2-Br-benzyl	Cl	2-Me-benzyl
Cl	4-Et-benzyl	Cl	4- <i>i</i> -Pr-benzyl
Cl	3-Et-benzyl	Cl	3- <i>i</i> -Pr-benzyl
Cl	2-Et-benzyl	Cl	2- <i>i</i> -Pr-benzyl
Cl	4-CN-benzyl	Cl	4- <i>c</i> -Pr-benzyl
Cl	3-CN-benzyl	Cl	3- <i>c</i> -Pr-benzyl
Cl	2-CN-benzyl	Cl	2- <i>c</i> -Pr-benzyl
Cl	4-CF ₃ -benzyl	Cl	4-CF ₃ O-benzyl
Cl	3-CF ₃ -benzyl	Cl	3-CF ₃ O-benzyl
Cl	2-CF ₃ -benzyl	Cl	2-CF ₃ O-benzyl
Cl	4-CHF ₂ -benzyl	Cl	4-CHF ₂ O-benzyl
Cl	3-CHF ₂ -benzyl	Cl	3-CHF ₂ O-benzyl
Cl	2-CHF ₂ -benzyl	Cl	2-CHF ₂ O-benzyl
Cl	4-Ac-benzyl	Cl	2-(CF ₃ C=O)-benzyl
Cl	3-Ac-benzyl	Cl	3-(CF ₃ C=O)-benzyl
Cl	2-Ac-benzyl	Cl	5-(CF ₃ C=O)-benzyl
Cl	4-MeO-benzyl	Cl	4-EtO-benzyl
Cl	3-MeO-benzyl	Cl	3-EtO-benzyl
Cl	2-MeO-benzyl	Cl	2-EtO-benzyl
Cl	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	Cl	4-NO ₂ -benzyl
Cl	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	Cl	3-NO ₂ -benzyl
Cl	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	Cl	2-NO ₂ -benzyl

<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>	<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>
Cl	benzyl	Cl	phenethyl
Cl	methyl	Cl	ethyl
Cl	<i>n</i> -propyl	Cl	<i>n</i> -butyl
Cl	<i>i</i> -propyl	Cl	<i>i</i> -butyl
Cl	<i>c</i> -propyl	Cl	<i>c</i> -butyl
Cl	<i>n</i> -pentyl	Cl	<i>s</i> -butyl
Cl	<i>c</i> -pentyl	Cl	<i>n</i> -hexyl
Cl	<i>n</i> -heptyl	Cl	<i>c</i> -hexyl
Me	4-Cl-Ph	Me	4-F-Ph
Me	3-Cl-Ph	Me	3-F-Ph
Me	2-Cl-Ph	Me	2-F-Ph
Me	4-Br-Ph	Me	4-Me-Ph
Me	3-Br-Ph	Me	3-Me-Ph
Me	2-Br-Ph	Me	2-Me-Ph
Me	4-Et-Ph	Me	4- <i>i</i> -Pr-Ph
Me	3-Et-Ph	Me	3- <i>i</i> -Pr-Ph
Me	2-Et-Ph	Me	2- <i>i</i> -Pr-Ph
Me	4-CN-Ph	Me	4- <i>c</i> -Pr-Ph
Me	3-CN-Ph	Me	3- <i>c</i> -Pr-Ph
Me	2-CN-Ph	Me	2- <i>c</i> -Pr-Ph
Me	4-CF ₃ -Ph	Me	4-CF ₃ O-Ph
Me	3-CF ₃ -Ph	Me	3-CF ₃ O-Ph
Me	2-CF ₃ -Ph	Me	2-CF ₃ O-Ph
Me	4-Ac-Ph	Me	2-(CF ₃ C=O)-Ph
Me	3-Ac-Ph	Me	3-(CF ₃ C=O)-Ph
Me	2-Ac-Ph	Me	4-(CF ₃ C=O)-Ph
Me	4-MeO-Ph	Me	4-EtO-Ph
Me	3-MeO-Ph	Me	3-EtO-Ph
Me	2-MeO-Ph	Me	2-EtO-Ph
Me	4- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	4-NO ₂ -Ph
Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	3-NO ₂ -Ph
Me	2- <i>i</i> -PrO-Ph	Me	2-NO ₂ -Ph
Me	4-Cl-benzyl	Me	4-F-benzyl
Me	3-Cl-benzyl	Me	3-F-benzyl
Me	2-Cl-benzyl	Me	2-F-benzyl
Me	4-Br-benzyl	Me	4-Me-benzyl

<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>	<u>R¹</u>	<u>R¹⁴</u>
Me	3-Br-benzyl	Me	3-Me-benzyl
Me	2-Br-benzyl	Me	2-Me-benzyl
Me	4-Et-benzyl	Me	4- <i>i</i> -Pr-benzyl
Me	3-Et-benzyl	Me	3- <i>i</i> -Pr-benzyl
Me	2-Et-benzyl	Me	2- <i>i</i> -Pr-benzyl
Me	4-CN-benzyl	Me	4- <i>c</i> -Pr-benzyl
Me	3-CN-benzyl	Me	3- <i>c</i> -Pr-benzyl
Me	2-CN-benzyl	Me	2- <i>c</i> -Pr-benzyl
Me	4-CF ₃ -benzyl	Me	4-CF ₃ O-benzyl
Me	3-CF ₃ -benzyl	Me	3-CF ₃ O-benzyl
Me	2-CF ₃ -benzyl	Me	2-CF ₃ O-benzyl
Me	4-CHF ₂ -benzyl	Me	4-CHF ₂ O-benzyl
Me	3-CHF ₂ -benzyl	Me	3-CHF ₂ O-benzyl
Me	2-CHF ₂ -benzyl	Me	2-CHF ₂ O-benzyl
Me	4-Ac-benzyl	Me	2-(CF ₃ C=O)-benzyl
Me	3-Ac-benzyl	Me	3-(CF ₃ C=O)-benzyl
Me	2-Ac-benzyl	Me	5-(CF ₃ C=O)-benzyl
Me	4-MeO-benzyl	Me	4-EtO-benzyl
Me	3-MeO-benzyl	Me	3-EtO-benzyl
Me	2-MeO-benzyl	Me	2-EtO-benzyl
Me	4- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	4-NO ₂ -benzyl
Me	3- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	3-NO ₂ -benzyl
Me	2- <i>i</i> -PrO-benzyl	Me	2-NO ₂ -benzyl

FORMULAÇÃO/UTILIDADE

Um composto de acordo com a presente invenção geralmente será utilizado como ingrediente ativo fungicida em uma composição, ou seja

5 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
5 composições líquidas incluem soluções (incluindo concentrados emulsionáveis), suspensões, emulsões (incluindo microemulsões e/ou 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,
10 emulsão concentrada, microemulsão e suspoemulsão. Os tipos gerais de composições líquidas não aquosas são concentrado emulsionável, concentrado 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
15 revestimentos de sementes) e similares, que podem ser dispersíveis em água (“molháveis”) ou hidrossolúveis. Filmes e revestimentos formados com 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
20 formulação sólida; alternativamente, toda a formulação de ingrediente ativo pode ser encapsulada (ou “sobrerrevestida”). A encapsulação pode controlar ou retardar a liberação do ingrediente ativo. Um grânulo emulsionável combina as vantagens de uma formulação concentrada emulsionável e de uma formulação granular seca. Composições de alta resistência são principalmente
25 utilizadas como intermediários para formulação adicional.

Formulações pulverizáveis são tipicamente estendidas em um 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
 5 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 na cova durante o plantio. Formulações líquidas e sólidas podem ser aplicadas sobre sementes vegetais na forma de tratamentos
 10 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,
 15 que somam 100% em peso.

	Percentual em peso		
	<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
 5 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,
 10 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
 15 ciclo-hexanona, 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
 20 insaturados, tais como metanol, etanol, *n*-propanol, álcool isopropílico, *n*-butanol, álcool isobutílico, *n*-hexanol, 2-etil hexanol, *n*-octanol, decanol, álcool isodecílico, iso-octadecanol, álcool cetílico, álcool laurílico, álcool tridecílico, álcool oleílico, ciclo-hexanol, álcool tetra-hidrofurfurílico, álcool diacetona e álcool benzílico. Diluentes líquidos também incluem glicerol ésteres de ácidos
 25 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 frequentemente incluem um ou mais tensoativos. Quando adicionados a um líquido, os tensoativos (também conhecidos como “agentes ativos na superfície”) geralmente modificam, mais frequentemente reduzem a tensão superficial do líquido. Dependendo da natureza dos grupos hidrofílicos e lipofílicos em uma molécula de tensoativo, os tensoativos podem ser úteis como agentes umectantes, dispersantes, emulsificantes ou agentes desespumantes.

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: alcoxilados álcoois tais como alcóxidos 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; etoxilados amina, alcanolamidas e alcanolamidas etoxiladas; triglicérides alcóxidos, tais como óleos de soja, mamona e colza etoxilados; alcóxidos de alquilfenol, tais como etoxilados de octilfenol, etoxilados de nonilfenol, etoxilados de dinonil fenol e etoxilados 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,

5 ésteres polietoxilados tais como ésteres de ácidos graxos de sorbitan polietoxilado, ésteres de ácidos graxos 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),

10 polímeros de enxerto ou 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

15 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 alcoxilados álcoois, fosfato ésteres de alcoxilados de alquilfenol e fosfato ésteres de etoxilados de

20 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;

25 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: 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.

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 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.

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 (alguns dos quais podem ser considerados como também funcionando como diluentes sólidos, diluentes líquidos ou tensoativos). Esses aditivos e auxiliares de formulação podem controlar: pH (tampões), formação de espuma durante o processamento (antiespumantes tais como poliorganossiloxanos), sedimentação de ingredientes ativos (agentes formadores de suspensão), viscosidade (espessantes tixotrópicos), crescimento microbiano em recipientes

(antimicrobianos), congelamento de produto (anticongelantes), cor (tinturas/dispersões de pigmento), lavagem (formadores de filme ou aglutinantes), evaporação (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.

O composto da Fórmula 1 e quaisquer outros ingredientes ativos são tipicamente incorporados às composições do presente por meio de dissolução do ingrediente ativo em um solvente ou de moagem em um diluente líquido ou seco. 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 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 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 (tal como em moinho martelo ou moinho de energia fluida). Grânulos e pelotas podem ser

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, 5 McGraw-Hill, Nova Iorque, 1963, págs. 8–57 e seguintes, e WO 91/13546. 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 10 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* 15 *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 20 169–182; 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, Reino Unido, 2000.

25 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 nas Tabelas Índice A e B. Sem elaboração adicional, acredita-se que os técnicos no assunto, utilizando a

descrição acima, possam utilizar a presente invenção ao máximo possível. Os Exemplos a seguir destinam-se, portanto, a ser considerados meramente ilustrativos, sem limitar o relatório descritivo de nenhuma forma. Os percentuais são em peso, exceto quando indicado em contrário.

5

EXEMPLO A**Concentrado de Alta Resistência**

Composto 1	98,5%
Sílica aerogel	0,5%
Sílica fina amorfa sintética	1,0%.

10

EXEMPLO B**Pó molhável**

Composto 2	65,0%
Dodecilfenol polietileno glicol éter	2,0%
Ligninossulfonato de sódio	4,0%
Silicoaluminato de sódio	6,0%
Montmorilonita (calcinação)	23,0%.

15

EXEMPLO C**Grânulos**

Composto 3	10,0%
grânulos de atapulgita (matéria de baixa volatilidade, 0,71/0,30 mm; peneiras padrão norte-americano nº 25-50)	90,0%.

20

EXEMPLO D**Pelotas extrudadas**

Composto 4	25,0%
Sulfato de sódio anidro	10,0%
Ligninossulfonato de cálcio bruto	5,0%
Alquilnaftalenossulfonato de sódio	1,0%

25

Bentonita de cálcio/magnésio	59,0%.
------------------------------	--------

EXEMPLO E**Concentrado emulsionável**

Composto 8	10,0%
5 Hexoleato de polioxietileno sorbitol	20,0%
Metil éster de ácido graxo C ₆ -C ₁₀	70,0%.

EXEMPLO F**Microemulsão**

Composto 10	5,0%
10 Copolímero de polivinilpirrolidona e acetato de vinila	30,0%
Alquilpoliglicosídeo	30,0%
Mono-oleato de glicerila	15,0%
Água	20,0%

EXEMPLO G**Tratamento de sementes**

Composto 14	20,00%
Copolímero de polivinilpirrolidona e acetato de vinila	5,00%
20 Cera de ácido Montana	5,00%
Ligninossulfonato de cálcio	1,00%
Copolímeros de bloco de polioxietileno e polioxipropileno	1,00%
Álcool estearílico (POE 20)	2,00%
25 Poliorganossilano	0,20%
Tintura vermelha corante	0,05%
Água	65,75%

Os compostos 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 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 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 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 *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 bidwellii*; doenças *Venturia* tais como *Venturia inaequalis*; doenças *Septoria* tais como *Septoria nodorum* e *Septoria tritici*; doenças de míldew 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 *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 *Gaeumannomyces graminis*; Basidiomicetes, incluindo doenças da ferrugem causadas por *Puccinia* spp. (tais como *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*,
 5 *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*, *Fusarium graminearum* e *Fusarium oxysporum*; *Verticillium dahliae*; *Sclerotium rolfsii*; *Rhynchosporium secalis*; *Cercosporidium personatum*, *Cercospora*
 10 *arachidicola* e *Cercospora beticola*; e outros gêneros e espécies relacionados intimamente com esses patógenos. Além da sua atividade como fungicida, as composições ou combinações também possuem atividade contra bactérias tais como *Erwinia amylovora*; *Xanthomonas compestris*; *Pseudomonas syringae* e outras espécies relacionadas.

15 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, frutos, sementes, tubérculos ou bulbos, ou aos meios (solo ou areia) nos quais as plantas a serem protegidas
 20 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 irrigação para o tratamento de plantas.

25 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 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, 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 os quais os compostos de acordo com a presente invenção podem ser formulados são: inseticidas tais como abamectina, acefato, acetamiprid, amidoflumet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfós-metil, bifentrina, bifenazato, buprofezina, carbofuran, cartap, clorantraniliprol (DPX-E2Y45), clorfenapir, clorfluazuron, clorpirifós, clorpirifós-metil, cromafenozida, clotianidina, ciflumetofen, ciflutrina, beta-ciflutrina, ci-halotrina, lambdaci-halotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuron, diazinon, dieldrina, diflubenzuron, dimeflutrina, dimetoato, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endossulfan, enestroburina (SYP-Z071), esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, 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, metoxiclor, metoflutrina, monocrotofós, metoxifenoazida, nitenpiram, nitiazina, novaluron, noviflumuron (XDE-007), oxamil, paration, paration-metil, permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofós, proflutrina, pimetozina, pirafluprol, piretrina, piridilil, pirifluquinazon, piriprol, piriproxifen, rotenona, rianodina, espinoteram, espinosad, espiroclufen, espiromesifen (BSN 2060), espirotetramat, sulprofós,

tebufenozida, teflubenzuron, teflutrina, terbufós, tetraclorvinfós, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tioissultap-sódio, tralometrina, triazamato, triclorfon e triflumuron; fungicidas tais como acibenzolar-S-metil, aldimorf, amisulbrom, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxil, benalaxil-M, benodanil, benomil,

5 bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropil, betoxazim, binapacril, bifenil, bitertanol, bixafen, blasticidina-S, mistura de Bordéus (sulfato de cobre tribásico), boscalid, bromuconazol, bupirimato, captafol, captan, carbendazim, carboxin, carpropamid, cloroneb, clorotalonil, clozolinato, clotrimazol, oxicleto de cobre, sais de cobre, tais como sulfato de cobre e hidróxido de cobre, ciazofamid,

10 ciflufenamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, diclofluanid, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimetirimol, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, ditianon, dodemorf, dodina, edifenfós, enestroburina, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram,

15 fenhexamid, fenoxanil, fempiclonil, fenpropidin, fenpropimorf, acetato de fentina, cloreto de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetil-alumínio, fuberidazol, furalaxil, furametapir, guazatina, hexaconazol, himexazol,

20 imazalil, imibenconazol, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, iodicarb, ipconazol, iprobenfós, iprodiona, iprovalicarb, isoprotilano, isotianil, casugamicina, cresoxim-metil, mancozeb, mandipropamid, maneb, mapanipirim, mepronil, meptildinocap, metalaxil, metalaxil-M, metconazol, metassulfocarb, metiram, metominostrobin, metrafenona, miclobutanil,

25 naftifina, neo-asozina (metanoarsonato férrico), nuarimol, octilinona, ofurace, orisastrobina, oxadixil, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, oxitetraciclina, pefurazoato, penconazol, pencicuron, pentiopirad, ácido fosforoso e seus sais, ftalida, picobenzamid, picoxistrobina, piperalina,

polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, cloridrato de propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, protiocarb, protioconazol, priazofós, piraclostrobina, piribencarb, piributicarb, pirifenox, pirimetanil, pirrolnitrina, piroquilon, quinometionato, quinoxifen, quintozene, siltiofam,

5 simeconazol, espiroxamina, estreptomicina, enxofre, tebuconazol, tecloftalam, tecnazeno, terbinafina, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato, tiofanato-metil, tiram, tiadinil, tolclufós-metil, tolifluanid, triadimefon, triadimenol, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, valifenal, vinclozolina, zineb, ziram, zoxamida, *N*-[2-

10 (1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida, *N*-[2-(1*S*, 2*R*)-[1,1'-biciclopropil]-2-ilfenil]-3-(difluorometil)-1-metil-1*H*-pirazolo-4-carboxamida, α -[metóxi-imino]-*N*-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)-fenil]-etóxi]imino]metil]benzenoacetamida, 2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-ilideno]amino]óxi]metil]- α -(metóxi-imino)-*N*-metilbenzenoacetamida, *N*-[2-[4-[[3-

15 (4-clorofenil)-2-propin-1-il]óxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]óxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida, 2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-(2-metoxifenil)-2-tiazolidinilideno]acetonitrila, 2-butóxi-6-iodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-

20 isoxazolidinil]piridina, *N*-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]-metil]propil]carbamato de 4-fluorofenila, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidina, *N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbenzenossulfonamida, *N*-[[ciclopropilmetóxi]amino][6-(difluorometóxi)-2,3-difluorofenil]metileno]benzenoacetamida, *N'*-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenóxi]-

25 2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilmetanimidamida e 1-[(2-propeniltio)carbonil]-2-(1-metiletil)-4-(2-metilfenil)-5-amino-1*H*-pirazol-3-ona; nematicidas tais como aldicarb, imiciafós, oxamil e fenamifós; bactericidas tais como estreptomicina; acaricidas tais como amitraz, chinometionat, clorobenzilato, ci-hexatina, dicofol,

dienoclor, etoxazol, fenazaquin, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridaben e tebufenpirad; e agentes biológicos que incluem bactérias entomopatogênicas, tais como *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* e as delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* (tais como Cellcap, MPV, MPVII); fungos entomopatogênicos, tais como fungo de muscardina verde; e vírus entomopatogênicos incluindo que incluem, nucleopóli-hedrovírus (NPV) tais como HzNPV, AfNPV; e vírus granulose (GV) tais como CpGV.

Os compostos de acordo com a presente invenção e suas composições podem ser aplicados a plantas transformadas geneticamente para expressar proteínas tóxicas a pragas invertebradas (tais como deltaendotoxinas de *Bacillus thuringiensis*). O efeito dos compostos fungicidas aplicados por via exógena de acordo com a presente invenção pode ser sinérgico com as proteínas de toxina expressas.

Referências gerais para protetores agrícolas (ou seja, inseticidas, fungicidas, nematicidas, acaricidas, herbicidas e agentes biológicos) incluem *The Pesticide Manual*, décima-terceira edição, C. D. S. Thomlin, ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2003 e *The BioPesticide Manual*, segunda edição, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2001.

Para realizações em que um ou mais desses vários parceiros de 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 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 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 composições) de (a) um composto da Fórmula 1 com (b) 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 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:

- (b1) fungicidas de carbamato de metil benzimidazol (MBC);
- (b2) fungicidas de dicarboximida;
- (b3) fungicidas inibidores da demetilação (DMI);
- (b4) fungicidas de fenilamida;
- (b5) fungicidas de amina/morfolina;
- (b6) fungicidas inibidores da biossíntese de fosfolipídios;
- (b7) fungicidas de carboxamida;
- (b8) fungicidas de hidróxi(2-amino)pirimidina;
- (b9) fungicidas de anilinopirimidina;
- (b10) fungicidas de carbamato de *N*-fenila;
- (b11) fungicidas inibidores externos de quinona (QoI);
- (b12) fungicidas de fenilpirrol;

(b13) fungicidas de quinolina;

(b14) fungicidas inibidores da peroxidação de lipídios;

(b15) fungicidas inibidores da biossíntese de melanina-reductase
(MBI-R);

5 (b16) fungicidas inibidores da biossíntese de melanina-
desidratase (MBI-D);

(b17) fungicidas de hidroxianilida;

(b18) fungicidas inibidores de esqualeno-epoxidase;

(b19) fungicidas de polioxina;

10 (b20) fungicidas de fenilureia;

(b21) fungicidas inibidores internos de quinona (Qil);

(b22) fungicidas de benzamida;

(b23) fungicidas antibióticos de ácido enopiranurônico;

(b24) fungicidas antibióticos de hexopiranosila;

15 (b25) fungicidas da síntese de proteína: antibióticos de
glucopiranosila;

(b26) fungicidas da biossíntese de inositol e tre-halase:
antibióticos de glucopiranosila;

(b27) fungicidas de cianoacetamido-oxima;

20 (b28) fungicidas de carbamato;

(b29) fungicidas de desacoplamento da fosforilação oxidativa;

(b30) fungicidas de organo estanho;

(b31) fungicidas de ácido carboxílico;

(b32) fungicidas heteroaromáticos;

25 (b33) fungicidas de fosfonato;

(b34) fungicidas de ácido ftalâmico;

(b35) fungicidas de benzotriazina;

(b36) fungicidas de benzenossulfonamida;

- (b37) fungicidas de piridazinona;
- (b38) fungicidas de tiofenocarboxamida;
- (b39) fungicidas de pirimidinamida;
- (b40) fungicidas de amida de ácido carboxílico (CAA);
- 5 (b41) fungicidas antibióticos de tetraciclina;
- (b42) fungicidas de tiocarbamato;
- (b43) fungicidas de benzamida;
- (b44) fungicidas de indução da defesea de plantas hospedeiras;
- (b45) fungicidades de atividade de contato em múltiplos locais;
- 10 (b46) fungicidas diferentes de fungicidas de componente (a) e componentes (b1) a (b45); e
- sais de compostos de (b1) a (b46).

“Fungicidas de carbamato de metilbenzimidazol (MBC) (b1)” (código 1 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem a

15 mitose por meio de união a β -tubulina durante a montagem de microtúbulos. A inibição da montagem de microtúbulos pode romper a divisão celular, transporte na célula e estrutura celular. Fungicidas de carbamato de metil benzimidazol incluem fungicidas de benzimidazol e tiofanato. Os benzimidazóis incluem benomil, carbendazim, fuberidazol e tiabendazol. Os tiofanatos incluem

20 tiofanato e tiofanato-metil.

“Fungicidas de dicarboximida (b2)” (código 2 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) são propostos para inibir a peroxidação de lipídios em fungos por meio de interferência com NADH citocromo c reductase. Exemplos incluem clozolinato, iprodiona, procimidona e vinclozolin.

25 “Fungicidas inibidores da demetilação (DMI) (b3)” (código 3 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem C14-demetilase que desempenha um papel na produção de esteróis. Esteróis, tais como ergosterol, são necessários para função e estrutura das membranas, tornando-

as essenciais para o desenvolvimento de paredes celulares funcionais. A exposição a estes fungicidas resulta, portanto, em crescimento anormal e eventualmente morte de fungos sensíveis. Os fungicidas de DMI são divididos entre diversas classes químicas: azóis (incluindo triazóis e imidazóis),
 5 pirimidinas, piperazinas e piridinas. Os triazóis incluem azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol (incluindo diniconazol-M), epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol,
 10 triadimefon, triadimenol, triticonazol e uniconazol. Os imidazóis incluem clotrimazol, imazalil, oxpoconazol, procloraz, pefurazoato e triflumizol. As pirimidinas incluem fenarimol e nuarimol. As piperazinas incluem triforina. As piridinas incluem pirifenox. Pesquisas bioquímicas demonstraram que todos os fungicidas mencionados acima são fungicidas DMI conforme descrito por K. H.
 15 Kuck et al em *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: Nova Iorque, 1995, 205-258.

“Fungicidas de fenilamida (b4)” (código 4 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) são inibidores específicos de RNA
 20 polimerase em fungos oomicetes. Os fungos sensíveis expostos a esses fungicidas exibem capacidade reduzida de incorporação de uridina em rRNA. Evita-se o crescimento e desenvolvimento em fungos sensíveis por meio de exposição a esta classe de fungicida. Os fungicidas de fenilamida incluem os fungicidas acilalanina, oxazolidinona e butirolactona. As acilalaninas incluem
 25 benalaxil, benalaxil-M, furalaxil, metalaxil e metalaxil-M/mefenoxam. As oxazolidinonas incluem oxadixil. As butirolactonas incluem ofurace.

“Fungicidas de amina/morfolina (b5)” (código 5 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem dois locais alvo no processo

biossintético de esteróis, $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ isomerase e Δ^{14} reductase. Esteróis, tais como ergosterol, são necessários para função e estrutura de membrana, o que os torna essenciais para o desenvolvimento de paredes celulares funcionais. A exposição a estes fungicidas resulta, portanto, em crescimento anormal e eventualmente morte de fungos sensíveis. Fungicidas de amina/morfolina (também conhecidos como inibidores da biossíntese de esteróis não de DMI) incluem os fungicidas morfolina, piperidina e espirocetamina. As morfolinas incluem aldimorf, dodemorf, fempropimorf, tridemorf e trimorfamida. As piperidinas incluem fempropidin e piperalin. As espirocetaminas incluem espiroxamina.

“Fungicidas inibidores da biossíntese de fosfolipídios (b6)” (código 6 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem o crescimento de fungos afetando a biossíntese de fosfolipídios. Os fungicidas de biossíntese de fosfolipídios incluem os fungicidas fosforotiolato e ditiolano. Os fosforotiolatos incluem eidfenfós, iprobenfós e pirazofós. Os ditiolanos incluem isoprotiolano.

“Fungicidas de carboxamida (b7)” (código 7 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas) incluem a respiração fúngica do complexo II (succinato desidrogenase) por meio de rompimento de uma enzima fundamental no Ciclo de Krebs (ciclo TCA) denominada succinato desidrogenase. A inibição da respiração evita que o fungo fabrique ATP e, desta forma, inibe o crescimento e a reprodução. Os fungicidas de carboxamida incluem benzamida, furan carboxamida, oxatiin carboxamida, tiazol carboxamida, pirazol carboxamida e piridino carboxamida. As benzamidas incluem benodanil, flutolanil e mepronil. As furan carboxamidas incluem fenfuram. A oxatiin carboxamida inclui carboxin e oxicarboxin. As tiazol carboxamidas incluem tifluzamida. As pirazol carboxamidas incluem furametpir, pentiopirad, bixafen, *N*-[2-(1*S*,2*R*)-[1,1'-biciclopropil]-2-ilfenil]-3-(difluorometil)-1-

metil-1*H*-pirazolo-4-carboxamida e *N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazolo-4-carboxamida. A piridino carboxamida inclui boscalid.

“Fungicidas de hidróxi(2-amino)pirimidina (b8)” (código 8 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem a síntese de ácidos nucleicos por meio de interferência com adenosino desaminase. Exemplos incluem bupirimato, dimetirimol e etirimol.

“Fungicidas de anilinopirimidina (b9)” (código 9 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) são propostos para inibir a biossíntese da metionina de aminoácidos e impedir a secreção de enzimas hidrolíticas que lisam células vegetais durante infecções. Exemplos incluem ciprodinil, mepanipirim e pirimetanil.

“Fungicidas de carbamato de *N*-fenila (b10)” (código 10 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem a mitose por meio de união a β -tubulina e rompimento do conjunto de microtúbulos. A inibição do conjunto de microtúbulos pode romper a divisão celular, transporte no interior da célula e a estrutura da célula. Exemplos incluem dietofencarb.

“Fungicidas inibidores externos de quinona (QoI) (b11)” (código 11 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem a respiração mitocondrial do Complexo III em fungos afetando a ubiquinol oxidase. A oxidação de ubiquinol é bloqueada no local “fora de quinona” (Q_o) do complexo de citocromo bc_1 , que está localizado na membrana mitocondrial interna de fungos. A inibição da respiração mitocondrial evita o crescimento e o desenvolvimento normal dos fungos. Os fungicidas inibidores externos de quinona (também conhecidos como fungicidas de estrobilurina) incluem os fungicidas metoxiacrilato, metoxicarbamato, oximinoacetato, oximinoacetamida, oxazolidinodiona, di-hidrodioxazina, imidazolinona e benzilcarbamato. Os metoxiacrilatos incluem azoxistrobina, enestroburina (SYP-Z071) e picoxistrobina. Os metoxicarbamatos incluem piraclostrobina. Os

oximinoacetatos incluem cresoxim-metil e trifloxistrobina. As oximinoacetamidas incluem dimoxistrobina, metominostrobin, orisastrobina, α -[metóxi-imino]-*N*-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]-etóxi]imino]metil]benzenoacetamida e 2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-ilideno]amino]óxi]metil]- α -(metóxi-imino)-*N*-metilbenzenoacetamida. As oxazolidinodionas incluem famoxadona. As di-hidrodioxazinas incluem fluoxastrobina. As imidazolinonas incluem fenamidona. Os benzilcarbamatos incluem piribencarb.

“Fungicidas de fenilpirrol (b12)” (código 12 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem uma quinase de proteína MAP associada à transdução de sinal osmótico em fungos. Fenpiclonil e fludioxonil são exemplos desta classe de fungicidas.

“Fungicidas de quinolina (b13)” (código 13 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) são propostos para inibir a transdução de sinal afetando proteínas G em sinalização celular inicial. Demonstrou-se que eles interferem com a germinação e/ou formação de apressório em fungos que causam doenças do míldio do pó. Quinoxifen é um exemplo desta classe de fungicida.

“Fungicidas inibidores da peroxidação de lipídios (b14)” (código 14 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) são propostos para inibir a peroxidação de lipídios que afeta a síntese de membrana em fungos. Os membros desta classe, tais como etridiazol, podem também afetar outros processos biológicos tais como a respiração e a biossíntese de melanina. Fungicidas de peroxidação de lipídios incluem fungicidas de 1,2,4-tiadiazol e carbono aromático. Os carbonos aromáticos incluem bifenila, cloroneb, dicloran, quintozene, tecnazene e tolclofós-metil. Os 1,2,4-tiadiazóis incluem etridiazol.

“Fungicidas inibidores da biossíntese de melanina-reductase

(MBI-R) (b15)” (código 16.1 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem a etapa de redução naftal na biossíntese de melanina. A melanina é necessária para infecções de plantas hospedeiras por alguns fungos. Os fungicidas inibidores da biossíntese de melanina-reductase incluem os fungicidas isobenzofuranona, pirroloquinolinona e triazolobenzotiazol. As isobenzofuranonas incluem ftalida. As pirroloquinolinonas incluem piroquilona. Os triazolobenzotiazóis incluem triciclazol.

“Fungicidas inibidores da biossíntese de melanina-desidratase (MBI-D) (b16)” (código 16.2 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem scitalone desidratase na biossíntese de melanina. Melanina é necessária para infecções de plantas hospedeiras por alguns fungos. Fungicidas inibidores da biossíntese de melanina-desidratase incluem os fungicidas ciclopropanocarboxamida, carboxamida e propionamida. As ciclopropanocarboxamidas incluem carpropamid. As carboxamidas incluem diclocimet. As propionamidas incluem fenoxanil.

“Fungicidas de hidroxianilida (b17)” (código 17 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem C4-demetilase que desempenha um papel na produção de esterol. Exemplos incluem fenhexamid.

“Fungicidas inibidores de esqualeno-epoxidase (b18)” (código 18 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem esqualeno-epoxidase no processo de biossíntese de ergosterol. Esteróis tais como ergosterol são necessários para a função e estrutura de membranas, o que os torna essenciais para o desenvolvimento de paredes de células funcionais. A exposição a estes fungicidas resulta, portanto, em crescimento anormal e eventualmente morte de fungos sensíveis. Fungicidas inibidores de esqualeno-epoxidase incluem fungicidas de tiocarbamato e alilamina. Os tiocarbamatos incluem piributicarb. As alilaminas incluem naftifina e terbinafina.

“Fungicidas de polioxina (b19)” (código 19 do Comitê de Ação de

Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem a sintase de quitina. Exemplos incluem polioxina.

“Fungicidas de fenilureia (b20)” (código 20 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) são propostos para afetar a divisão celular.

5 Exemplos incluem pencicuron.

“Fungicidas inibidores internos de quinona (Qil) (b21)” (código 21 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem a respiração mitocondrial do Complexo III em fungos afetando ubiquinol reductase. A redução de ubiquinol é bloqueada no lado “interno de quinona” (Q_i) do complexo de citocromo *bc*₁, que está localizado na membrana mitocondrial interna de fungos. A inibição da respiração mitocondrial evita o desenvolvimento e crescimento normal dos fungos. Os fungicidas inibidores internos de quinona incluem os fungicidas cianoimidazol e sulfamoiltriazol. Os cianoimidazóis incluem ciazofamid. Os sulfamoiltriazóis incluem amissulbrom.

15 “Fungicidas de benzamida (b22)” (código 22 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibe a mitose por meio de união a β -tubulina e rompendo o conjunto de microtúbulos. A inibição do conjunto de microtúbulos pode romper a divisão celular, o transporte no interior da célula e a estrutura celular. Exemplos incluem zoxamida.

20 “Fungicidas antibióticos de ácido enopiranurônico (b23)” (código 23 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem o crescimento de fungos afetando a biossíntese de proteínas. Exemplos incluem blasticidina-S.

25 “Fungicidas antibióticos de hexopiranosila (b24)” (código 24 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem o crescimento de fungos afetando a biossíntese de proteínas. Exemplos incluem casugamicina.

“Fungicidas de síntese de proteínas: antibióticos de glucopiranosila (b25)” (código 25 do Comitê de Ação de Resistência a

Fungicidas (FRAC)) inibem o crescimento de fungos afetando a biossíntese de proteínas. Exemplos incluem estreptomicina.

“Fungicidas de biossíntese de tre-halase e inositol: antibióticos de glucopiranosila (b26)” (código 26 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem tre-halase no processo de biossíntese de inositol. Exemplos incluem validamicina.

“Fungicidas de cianoacetamido oxima (b27)” (código 27 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) incluem cimoxanil.

“Fungicidas de carbamato (b28)” (código 28 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) são considerados inibidores de múltiplos locais do crescimento fúngico. Propõe-se que eles interfiram com a síntese de ácidos graxos em membranas celulares, que rompe em seguida a permeabilidade da membrana celular. Propamacarb, cloridrato de propamacarb, iodocarb e protiocarb são exemplos desta classe de fungicida.

“Fungicidas de desacoplamento de fosforilação oxidativa (b29)” (código 29 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem a respiração fúngica por meio do desacoplamento da fosforilação oxidativa. A inibição da respiração evita o crescimento e desenvolvimento fúngico normal. Esta classe inclui 2,6-dinitroanilinas tais como fluazinam, pirimidono-hidrazonas tais como ferinzone e crotonatos de dinitrofenila tais como dinocap, meptildinocap e binapacril.

“Fungicidas de organo estanho (b30)” (código 30 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem a sintase de trifosfato de adenosina (ATP) no processo de fosforilação oxidativa. Exemplos incluem acetato de fentina, cloreto de fentina e hidróxido de fentina.

“Fungicidas de ácido carboxílico (b31)” (código 31 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem o crescimento de fungos afetando topoisomerase de ácido desoxirribonucleico (DNA) tipo II (girase).

Exemplos incluem ácido oxolínico.

“Fungicidas heteroaromáticos (b32)” (código 32 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) são propostos para afetar a síntese de DNA e ácido ribonucleico (RNA). Os fungicidas heteroaromáticos incluem os
5 fungicidas isoxazol e isotiazolona. Os isoxazóis incluem himexazol e as isotiazolonas incluem octilinona.

“Fungicidas de fosfonato (b33)” (código 33 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) incluem ácido fosforoso e seus vários sais, incluindo fosetil-alumínio.

10 “Fungicidas de ácido ftalâmico (b34)” (código 34 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) incluem tecloftalam.

“Fungicidas de benzotriazina (b35)” (código 35 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) incluem triazóxido.

15 “Fungicidas de benzenossulfonamida (b36)” (código 36 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) incluem flussulfamida.

“Fungicidas de piridazinona (b37)” (código 37 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) incluem diclomezina.

20 “Fungicidas de tiofenocarboxamida (b38)” (código 38 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) são propostos para afetar a produção de ATP. Exemplos incluem siltiofam.

“Fungicidas de pirimidinamida (b39)” (código 39 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem o crescimento de fungos afetando a biossíntese de fosfolipídios e incluem diflumentorim.

25 “Fungicidas de amida de ácido carboxílico (CAA) (b40)” (código 40 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) são propostos para inibir a biossíntese de fosfolipídios e a deposição de parede celular. A inibição destes processos evita o crescimento e causa a morte do fungo alvo. Fungicidas de amida de ácido carboxílico incluem amida de ácido cinâmico,

carbamato de valinamida e fungicidas de amida de ácido mandélico. As amidas de ácido cinâmico incluem dimetomorf e flumorf. Os carbamatos de valinamida incluem bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropil, iprovalicarb e valifenal. As amidas de ácido mandélico incluem mandipropamid, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]óxi]-3-metoxifenil]-etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida e *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]óxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida.

“Fungicidas antibióticos de tetraciclina (b41)” (código 41 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem o crescimento de fungos afetando a oxidorreductase de dinucleotídeos de nicotinamida adenina do complexo 1 (NADH). Exemplos incluem oxitetraciclina.

“Fungicidas de tiocarbamato (b42)” (código 42 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) incluem metassulfocarb.

“Fungicidas de benzamida (b43)” (código 43 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) inibem o crescimento de fungos por meio da deslocalização de proteínas similares a espectrina. Exemplos incluem fungicidas de acilpícolida tais como fluopícolida e fluopiram.

“Fungicidas de indução da defesa de plantas hospedeiras (b44)” (código P do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC)) incluem mecanismos de defesa de plantas hospedeiras. Fungicidas de indução de defesa de plantas hospedeiras incluem fungicidas benzotiadiazol, benzisotiazol e tiadiazolocarboxamida. Os benzotiadiazóis incluem acibenzolar-S-metil. Os benzisotiazóis incluem probenazol. As tiadiazolocarboxamidas incluem tiadinil e isotianil.

“Fungicidas de contato de múltiplos locais (b45)” inibem o crescimento dos fungos por meio de diversos locais de ação e possuem atividade de contato/preventiva. Esta classe de fungicidas inclui “fungicidas de cobre (b45.1) (código M1 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas

(FRAC) M1)", "fungicidas de enxofre (b45.2) (código M2 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC))", "fungicidas de ditiocarbamato (b45.3) (código M3 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC))", "fungicidas de ftalimida (b45.4) (código M4 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC))", "fungicidas de cloronitrila (b45.5) (código M5 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC))", "fungicidas de sulfamida (b45.6) (código M6 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas)", "fungicidas de guanidina (b45.7) (código M7 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC))", "fungicidas de triazina (b45.8) (código M8 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC))" e "fungicidas de quinona (b45.9) (código M9 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC))". "Fungicidas de cobre" são compostos inorgânicos que contêm cobre, tipicamente no estado de oxidação de cobre (II); exemplos incluem oxiclureto de cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre, que incluem composições tais como mistura de Bordéus (sulfato de cobre tribásico). "Fungicidas de enxofre" são substâncias inorgânicas que contêm anéis ou cadeias de átomos de enxofre; exemplos incluem enxofre elementar. "Fungicidas de ditiocarbamato" contêm uma porção molecular de ditiocarbamato; exemplos incluem mancozeb, metiram, propineb, ferbam, maneb, tiram, zineb e ziram. "Fungicidas de ftalimida" contêm uma porção molecular de ftalimida; exemplos incluem folpet, captan e captafol. "Fungicidas de cloronitrila" contêm um anel aromático substituído com cloro e ciano; exemplos incluem clorotalonil. "Fungicidas de sulfamida" incluem diclofluanid e tolilfluanid. "Fungicidas de guanidina" incluem dodina, guazatina, albesilato de iminotadina e triacetato de iminotadina. "Fungicidas de triazina" incluem anilazina. "Fungicidas de quinona" incluem ditianon.

"Fungicidas diferentes de fungicidas de componente (a) e componentes (b1) a (b45); (b46)" incluem certos fungicidas considerados como possuindo um modo de ação desconhecido. Estes incluem "fungicida de tiazolo

carboxamida (b46.1) (código U5 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC))”, “fungicida de fenilacetamida (b46.2) (código U6 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC))”, “fungicida de quinazolinona (b46.3) (código U7 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC))” e “fungicida de benzofenona (b46.4) (código U8 do Comitê de Ação de Resistência a Fungicidas (FRAC))”. Os tiazolo carboxamidas incluem etaboxam. As fenilacetamidas incluem ciflufenamid e *N*-[[[(ciclopropilmetóxi)amino][6-(difluorometóxi)-2,3-difluorofenil]metileno]benzenoacetamida. As quinazolinonas incluem proquinazid, 6-bromo-3-propil-2-propilóxi-4 (3*H*)-quinazolinona, 6,8-di-iodo-3-propil-2-propilóxi-4-(3*H*)-quinazolinona, 6-cloro-2-propóxi-3-propiltieno[2,3-*d*]pirimidin-4 (3*H*)-ona, 2,3-dibutil-6-clorotieno[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[3,2-*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, 3-(ciclopropilmetil)-6-iodo-2-(propiltio)pirido[2,3-*d*]pirimidin-4 (3*H*)-ona, 2-butóxi-6-iodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 2-etóxi-6-iodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 6-iodo-2-propóxi-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 6-iodo-2-propóxi-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 2-(2-butilóxio)-6-iodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 6-iodo-2-(1-metilbutóxi)-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 2-(3-butenilóxio)-6-iodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 3-butil-6-iodo-2-(1-metiletóxi)-4*H*-1-benzopiran-4-ona e 6-iodo-3-propil-2*H*-1,3-benzoxazino-2,4 (3*H*)-diona 2-(*O*-metiloxima). As benzofenonas incluem metrafenona. O grupo (b46) também inclui betoxazin, neo-asozin (metanoarsonato férrico), pirrolinitrin, quinometionato, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidina (BAS600), 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina (SYP-Z048), *N*-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]metil]propil]carbamato de 4-fluorofenila (XR-539), *N*'-[4-[4-

cloro-3-(trifluorometil)fenóxi]-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilmetanimidamida, 2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-(2-metoxifenil)-2-tiazolidinilideno]acetonitrila (OK-5203) e *N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbenzenossulfonamida (TF-991).

5 As realizações da presente invenção incluem:

Realização D1. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição das Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b1) fungicidas carbamato de metil benzimidazol tais como benomil, carbendazim e tiofanato-metil.

Realização D2. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, as composições das Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b2) fungicidas de dicarboximida tais como procimidona, iprodiona e vinclozolin.

Realização D3. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitar-se a composições de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b3) fungicidas inibidores da demetilação tais como epoxiconazol, fluquinconazol, triadimenol, simeconazol, ipconazol, triforina, ciproconazol, difenconazol, flusilazol, flutriafol, metconazol, miclobutanil, procloraz, propiconazol, protioconazol, tebuconazol e tetraconazol.

Realização D4. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, as composições de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b4) fungicidas de fenilamida tais como metalaxil, metalaxil-M, benalaxil, benalaxil-M, furalaxil, ofurace e

oxadixil.

Realização D5. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, as composições de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui
5 pelo menos um composto selecionado a partir de (b5) fungicidas de amina/morfolina tais como aldimorf, dodemorf, fempropimorf, tridemorf, trimorfamida, fempropidin, piperalin e espiroxamina.

Realização D6. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de
10 acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b6) fungicidas inibidores da biossíntese de fosfolipídios, tais como edifenfós e isoprotilano.

Realização D7. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de
15 acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b7) fungicidas de carboxamida, tais como boscalid, pentiopirad, bixafen, carboxin e oxicarboxin.

Realização D8. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de
20 acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b8) fungicidas de hidróxi(2-amino)pirimidina tais como etirimol.

Realização D9. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de
25 acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b9) fungicidas de anilino pirimidina, tais como ciprodinil.

Realização D10. Composição de acordo com a Descrição

Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 29 e A a D), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b10) fungicidas de carbamato de *N*-fenila, tais como dietofencarb.

5 Realização D11. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b11) fungicidas inibidores externos de quinona, tais como azoxistrobin, piraclostrobin, cresoxim-metil, 10 trifloxistrobin, picoxistrobin, piribencarb, famoxadona, fenamidona, enestrobin, dimoxistrobin, metominostrobin, orisastrobin e fluoxastrobin.

 Realização D12. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 31 e A a C5), em que o componente (b) inclui 15 pelo menos um composto selecionado a partir de (b12) compostos fungicidas de fenilpirrol, tais como fempiclonil e fludioxonil.

 Realização D13. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui 20 pelo menos um composto selecionado a partir de (b13) fungicidas de quinolina, tais como quinoxifen.

 Realização D14. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui 25 pelo menos um composto selecionado a partir de (b14) fungicidas inibidores da peroxidação de lipídios, tais como cloroneb.

 Realização D15. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de

acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b15) fungicidas inibidores da biossíntese de melanina-reductase, tais como piroquilon e triciclazol.

Realização D16. Composição de acordo com a Descrição
5 Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b16) fungicidas inibidores da biossíntese de melanina-desidratase, tais como carpropamid.

Realização D17. Composição de acordo com a Descrição
10 Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b17) fungicidas de hidroxianilida, tais como fen-hexamid.

Realização D18. Composição de acordo com a Descrição
15 Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b18) fungicidas inibidores da epoxidase-esqualeno, tais como piributicarb.

Realização D19. Composição de acordo com a Descrição
20 Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b19) fungicidas de polioxina, tais como polioxina.

Realização D20. Composição de acordo com a Descrição
25 Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b20) fungicidas de fenilureia, tais como pencicuron.

Realização D21. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b21) fungicidas inibidores
5 internos de quinona, tais como ciazofamid e amissulbrom.

Realização D22. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b22) fungicidas de
10 benzamida, tais como zoxamida.

Realização D23. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b23) fungicidas antibióticos de ácido
15 enopiranurônico, tais como blasticidina-S.

Realização D24. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b24) fungicidas antibióticos de hexopiranosila,
20 tais como casugamicin.

Realização D25. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b25) fungicidas antibióticos de glucopiranosila:
25 síntese de proteínas, tais como estreptomicina.

Realização D26. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um

composto selecionado a partir de (b26) fungicidas antibióticos de glucopiranosila: biossíntese de inositol e tre-halase, tais como validamicin.

Realização D27. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b27) fungicidas de cianoacetilamido oxima, tais como cimoxanil.

Realização D28. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b28) fungicidas de carbamato, tais como propamacarb, cloridrato de propamacarb, protiocarb e iodocarb.

Realização D29. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b29) fungicidas desacopladores de fosforilação oxidativa, tais como fluazinam, binapacril, ferinzone, meptildinocap e dinocap.

Realização D30. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b30) fungicidas de organo estanho, tais como acetato de fentin.

Realização D31. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b31) fungicidas de ácido carboxílico, tais como ácido oxolínico.

Realização D32. Composição de acordo com a Descrição Resumida

da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b32) fungicidas heteroaromáticos, tais como himexazol.

5 Realização D33. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b33) fungicidas de fosfonato, tais como ácido fosforoso e seus vários sais, incluindo fosetil-alumínio.

10 Realização D34. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b34) fungicidas de ácido ftalâmico, tais como tecloftalam.

15 Realização D35. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b35) fungicidas de benzotriazina, tais como triazóxido.

20 Realização D36. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b36) fungicidas de benzenossulfonamida, tais como flussulfamida.

25 Realização D37. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b37) fungicidas de piridazinona, tais como

diclomezina.

Realização D38. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b38) fungicidas de tiofenocarboxamida, tais como siltiofam.

Realização D39. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b39) fungicidas de pirimidinamida, tais como diflumentorim.

Realização D40. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b40) fungicidas de amida de ácido carboxílico, tais como dimetomorf, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropil, iprovalicarb, valifenal, mandipropamid e flumorf.

Realização D41. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b41) fungicidas antibióticos de tetraciclina, tais como oxitetraciclina.

Realização D42. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b42) fungicidas de tiocarbamato, tais como metassulfocarb.

Realização D43. Composição de acordo com a Descrição Resumida

da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b43) fungicidas de benzamida, tais como fluopicolida e fluopiram.

5 Realização D44. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b44) fungicidas de indução de defesa da planta hospedeira, tais como acibenzolar-S-metil.

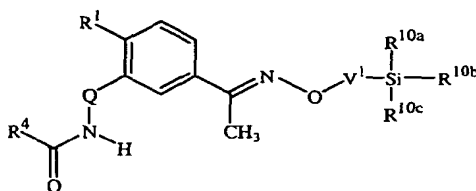
10 Realização D45. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um composto selecionado a partir de (b45) fungicidas de contato de múltiplos locais, tais como oxicleto de cobre, sulfato de cobre, hidróxido de cobre, composição de
15 Bordéus (sulfeto de cobre tribásico), enxofre elementar, mancozeb, metiram, propineb, ferbam, maneb, tiram, zineb, ziram, folpet, captan, captafol e clorotalonil.

Realização D46. Composição de acordo com a Descrição Resumida da Invenção (incluindo, mas sem limitações, a composição de acordo com as Realizações 1 a 32 e A a C5), em que o componente (b) inclui pelo menos um
20 composto selecionado a partir de (b46) fungicidas diferentes de fungicidas do componente (a) e componentes (b1) a (b45), tais como etaboxam, ciflufenamid, proquinazid, metrafenona, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 2-butoxi-6-iodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina, *N*-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]metil]propil]carbamato de 4-fluorofenila, *N*-
25 [[(ciclopropilmetóxi)amino][6-(difluorometóxi)-2,3-difluorofenil]metileno]benzenoacetamida, *N*-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenóxi]-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilmetanimidamida, 2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-

(2-metoxifenil)-2-tiazolidinilideno]acetonitrila e *N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbenzenossulfonamida.

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 a J para descrições de compostos. Vide a Tabela Índice K para dados de NMR ^1H . São utilizadas as abreviações a seguir nas Tabelas Índice que se seguem: *i* indica iso, *c* indica ciclo, *n* indica normal, *t* indica terciário, Ac é acetila, Me é metila, Et é etila, Ph é fenila, Bn é benzila, OMe é metóxi, OEt é etóxi, SMe é metiltio e CN é ciano. Os substituintes sobre benzila são ligados ao anel fenila do benzila e os números de localização dos substituintes referem-se à posição fenila unida ao componente metileno de benzila. A abreviação "Ex." indica "Exemplo" e é seguida por um algarismo que indica em qual exemplo o composto é preparado. A abreviação MP designa "ponto de fusão".

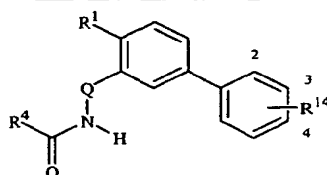
TABELA ÍNDICE A



Cmpd.	R ¹	R ⁴	Q	V ¹	R ^{10a}	R ^{10b}	R ^{10c}	MP
1 (Ex. 1)	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	**
2 (Ex. 2)	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂	Me	Me	Me	**
3	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂ C(=CH ₂)CH ₂	Me	Me	Me	*
4	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	CH=CH ₂	*
5	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	4-Cl-Ph	*
6	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	Me	*
7	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	Et	*
15	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	Ph	*
16	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	4-F-Ph	*
17	Cl	OMe	CH ₂	CH ₂	Me	Me	Bn	*

* Vide Tabela Índice K para dados de NMR ^1H .

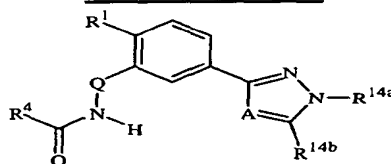
** Vide exemplo de síntese para dados de NMR ^1H .

TABELA ÍNDICE B

Cmpd.	R¹	R⁴	Q	R¹⁴	MP
8 (Ex.3)	Cl	OMe	NH	3-OCF₃	**
9	Cl	OMe	NH	4-SiMe₃	*
10	Cl	OEt	NH	4-OCF₃	*
11	Cl	OMe	NH	4-OCF₃	*
12	Cl	OMe	NH	4-CN	*
13	Cl	OMe	NH	4-SCH₃	*
14	Cl	OMe	CH₂	4-SiMe₃	*
18	Cl	OMe	O	3-OCF₃	*
19	Cl	OMe	O	3-Cl	*

* Vide Tabela Índice K para dados de NMR ¹H.

** Vide exemplo de síntese para dados de NMR ¹H.

TABELA ÍNDICE C

Cmpd.	R¹	R⁴	Q	R¹⁴ᵃ	R¹⁴ᵇ	A	MP
20	Cl	OMe	CH₂	(6-methyl-pyrid-2-yl)-CH₂-	H	CH	*
21	Cl	OMe	CH₂	H	H	CH	*
22	Cl	OMe	CH₂	3-methyl-1-butyl	H	CH	*
23	Cl	OMe	CH₂	1-(3-trimethylsilyl-propyl)-	H	CH	*
24	Cl	OMe	CH₂	1-pent-4-ynyl	H	CH	*
25	Cl	OMe	CH₂	(2-chloro-thiazol-5-yl)-CH₂-	H	CH	*
26	Cl	OMe	CH₂	-CH₂CN	H	CH	*
27	Cl	OMe	CH₂	(ethyl-dimethylsilyl)-CH₂-	H	CH	*
28	Cl	OMe	CH₂	methyl	H	CH	*
29	Cl	OMe	CH₂	1-(1-trimethylsilyl-ethyl)-	H	CH	*
30	Cl	OMe	CH₂	1-(4-methyl-pent-3-enyl)-	H	CH	*
31	Cl	OMe	CH₂	-CH₂CH₂CN	H	CH	*
32	Cl	OMe	CH₂	-CH₂CH₂CH₂CN	H	CH	*
34	Cl	OMe	CH₂	Ph	H	CH	*
35	Cl	OMe	CH₂	Me₂NSO₂-	H	CH	*
36	Cl	OMe	CH₂	1-[4,4-bis-(4-fluorophenyl)-butyl]	H	CH	*
37	Cl	OMe	CH₂	2-Cl-benzyl	H	CH	*
38	Cl	OMe	CH₂	3-CF₃-benzyl	H	CH	*
39	Cl	OMe	CH₂	1-pent-4-ynyl	Me	CH	*
40	Cl	OMe	CH₂	1-(3-trimethylsilyl-propyl)-	Me	CH	*
41	Cl	OMe	CH₂	1-(4-methyl-pentyl)-	H	CH	*

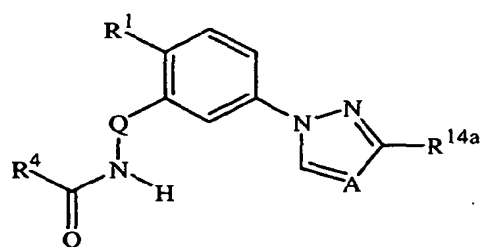
42	Cl	OMe	CH ₂	1-(3-phenyl-propyl)-	H	CH	*
43	Cl	OMe	CH ₂	1-(3-fluoro-propyl)-	H	CH	*
45	Cl	OMe	CH ₂	1-(3-trimethylsilyl-propyl)-	CF ₃	CH	*
46	Cl	OMe	CH ₂	butyl	H	CH	*
47	Cl	OMe	CH ₂	1-(3-trimethylsilyl-propyl)-	H	CCl	*
48	Cl	OMe	CH ₂	5-methyl-pyrid-2-yl	H	CH	*
49	Cl	OMe	CH ₂	6-methyl-pyrid-2-yl	H	CH	*
50	Cl	OMe	CH ₂	3-CF ₃ -Ph	H	CH	*
51	Cl	OMe	CH ₂	2-CF ₃ -Ph	H	CH	*
52	Cl	OMe	CH ₂	2-Cl-Ph	H	CH	*
53	Cl	OMe	CH ₂	2-Cl-5-CF ₃ -benzyl	H	CH	*
54	Cl	OMe	CH ₂	2-Ac-Ph	H	CH	*
55	Cl	OMe	CH ₂	4-(2-CN-Ph)-benzyl	H	CH	*
56	Cl	OMe	CH ₂	3-[1-(4-chloro-phenyl)- propane-1-one]	H	CH	*
57	Cl	OMe	CH ₂	benzyl	H	CH	*
58	Cl	OMe	CH ₂	phenethyl	H	CH	*
59	Cl	OMe	CH ₂	1-(2-phenoxy-ethyl)	H	CH	*
60	Cl	OMe	CH ₂	3-Cl-benzyl	H	CH	*
61	Cl	OMe	CH ₂	1-(2-phenoxy-propyl)	H	CH	*
62	Cl	OMe	CH ₂	2-CF ₃ -benzyl	H	CH	*
63	Cl	OMe	CH ₂	4-CF ₃ -benzyl	H	CH	*
64	Cl	OMe	NH	3-CF ₃ -Ph	H	CH	*
65	Cl	OMe	CH ₂	3-OCF ₃ -benzyl	H	CH	*
66	Cl	OMe	CH ₂	4-OCF ₃ -benzyl	H	CH	*
67	Cl	OMe	CH ₂	4-Cl-benzyl	H	CH	134-139
68	Cl	OMe	CH ₂	3-OCF ₃ -Ph	H	CH	136-138
69	Cl	OMe	CH ₂	6-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	CH	171-173
70	Cl	OMe	CH ₂	2-Me-benzyl	H	CH	*
71	Cl	OMe	CH ₂	3-Me-benzyl	H	CH	*
72	Cl	OMe	CH ₂	4-Me-benzyl	H	CH	126-129
73	Cl	OMe	CH ₂	3-NO ₂ -benzyl	H	CH	*
74	Cl	OMe	CH ₂	4-Cl-Ph	H	CH	151-153
75	Cl	OMe	CH ₂	3-CN-benzyl	H	CH	*

76	Cl	OMe	CH ₂	2-OCF ₃ -benzyl	H	CH	*
77	Cl	OMe	CH ₂	4-OCF ₃ -Ph	H	CH	149-151
78	Cl	OMe	CH ₂	3,5-di-CF ₃ -Ph	H	CH	164-166
79	Cl	OMe	CH ₂	4-CF ₃ -Ph	H	CH	180
80	Cl	OMe	CH ₂	3-Cl-Ph	H	CH	127-129
81	Cl	OMe	CH ₂	3-Me-Ph	H	CH	115-118
82	Cl	OMe	CH ₂	4-Ph-Ph	H	CH	172-174
86	Cl	OMe	CH ₂	4-CF ₃ -pyrid-2-yl	H	CH	169-171
87	Cl	OMe	CH ₂	4-CF ₃ -pyrimid-2-yl	H	CH	155-158
88	Cl	OMe	CH ₂	4-Cl-3-CF ₃ -Ph	H	CH	165-180
89	Cl	OMe	CH ₂	3-CF ₃ -Ph	H	N	160-163
90	Cl	OMe	CH ₂	3,5-di-MeO-triazin-1-yl	H	CH	*
91	Cl	OMe	CH ₂	3-BnS-1,2,4-thiadiazol-5-yl	H	CH	*
92	Cl	OMe	CH ₂	3-MeO-1,2,4-thiadiazol-5-yl	H	CH	*
93	Cl	OMe	CH ₂	3-EtS-1,2,4-thiadiazol-5-yl	H	CH	*
94	Cl	OMe	CH ₂	3-(4-CF ₃ -Ph)-1,2,4-thiadiazol-5-yl	H	CH	*
95	Cl	OMe	CH ₂	3- <i>c</i> -Pr-1,2,4-thiadiazol-5-yl	H	CH	*
96	Cl	OMe	CH ₂	3- <i>t</i> -Bu-1,2,4-thiadiazol-5-yl	H	CH	*
97	Cl	OMe	CH ₂	4-Br-Ph	H	N	160-163
98	Cl	OMe	CH ₂	Me	<i>n</i> -pentyl	CH	*
99	Cl	OMe	CH ₂	H	4- <i>t</i> -bu-Ph	CH	*
100	Cl	OMe	CH ₂	H	CF ₃	CH	*
101	Cl	OMe	CH ₂	1-(3,3-dimethylbutyl)	CF ₃	CH	*
102	Cl	OMe	CH ₂	<i>n</i> -butyl	CF ₃	CH	*
103	Cl	OMe	CH ₂	<i>n</i> -propyl	CF ₃	CH	*
104	Cl	OMe	CH ₂	3-(2-propyl)-1,2,4-thiadiazol-5-yl	H	CH	*
105	Cl	OMe	CH ₂	3-Me-1,2,4-thiadiazol-5-yl	H	CH	*
106	Cl	OMe	CH ₂	4-MeO-Ph	H	CH	*
107	Cl	OMe	CH ₂	3-MeO-Ph	H	CH	*
108	Cl	OMe	CH ₂	4-(MeO ₂ C)-Ph	H	CH	*
109	Cl	OMe	CH ₂	4-Me-Ph	H	CH	*
110	Cl	OMe	CH ₂	4-(<i>i</i> -propyl)-Ph	H	CH	*

111	Cl	OMe	CH ₂	4-Br-Ph	H	CH	*
112	Cl	OMe	CH ₂	3-Br-Ph	H	CH	*
113	Cl	OMe	CH ₂	3-CN-Ph	H	CH	*
114	Cl	OMe	CH ₂	4-CN-Ph	H	CH	*
115	Cl	OMe	CH ₂	3-F-Ph	H	CH	*
116	Cl	OMe	CH ₂	4-F-Ph	H	CH	*
117	Cl	OMe	CH ₂	3,4-di-Cl-Ph	H	CH	*
118	Cl	OMe	CH ₂	3,4-di-F-Ph	H	CH	*
150	Cl	OMe	CH ₂	4-Ac-Ph	H	CH	*

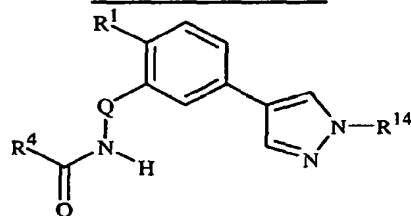
* Vide Tabela Índice K para dados de NMR ¹H.

TABELA ÍNDICE D



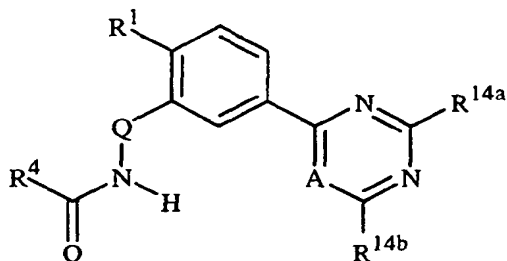
Cmpd.	R ¹	R ⁴	Q	R ^{14a}	A	MP
119	Cl	OMe	CH ₂	3-CF ₃ -Ph	CH	125-130
120	Cl	OMe	CH ₂	3-CF ₃ -Ph	N	155-157
121	Cl	OMe	CH ₂	3-Br-Ph	CH	137-140
122	Cl	OMe	CH ₂	4-Cl-Ph	CH	152-155
123 (Ex. 15)	Cl	OMe	CH ₂	3-Cl-Ph	CH	127-130
124	Cl	OMe	CH ₂	4-Br-Ph	CH	168-170

TABELA ÍNDICE E



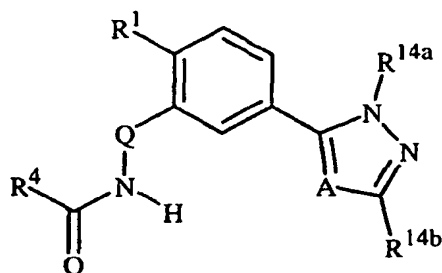
Cmpd.	R ¹	R ⁴	Q	R ¹⁴	MP
126	Cl	OMe	CH ₂	3-trimethylsilyl-1-propyl	*
127	Cl	OMe	CH ₂	H	*

128	Cl	OMe	CH ₂	benzyl	*
129	Cl	OMe	CH ₂	2-Cl-benzyl	*

TABELA ÍNDICE F

Cmpd.	R ¹	R ⁴	Q	R ^{14a}	R ^{14b}	A	MP
130	Cl	OMe	CH ₂	Cl	H	CH	*
131	Cl	OMe	CH ₂	2-Me-thiazol-4-yl	H	CH	*
132	Cl	OMe	CH ₂	4-Me-Ph	H	CH	*
133	Cl	OMe	CH ₂	3-Me-Ph	H	CH	*
134	Cl	OMe	CH ₂	Ph	H	CH	*
137	Cl	OMe	CH ₂	c-propyl	H	CH	*
138	Cl	OMe	CH ₂	CF ₃	H	CH	*
139	Cl	OMe	CH ₂	BnO	H	CH	*

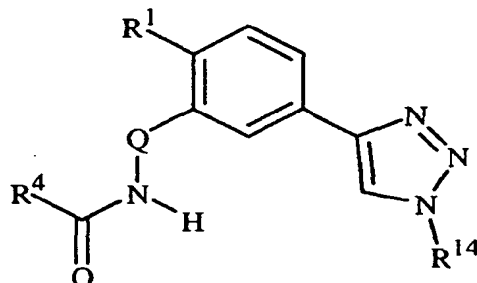
* Vide Tabela Índice K para dados de NMR ¹H.

TABELA ÍNDICE G

Cmpd.	R ¹	R ⁴	Q	R ^{14a}	R ^{14b}	A	MP
140	Cl	OMe	CH ₂	Ph	H	CH	*
141	Cl	OMe	CH ₂	Me	CF ₃	CH	*
142	Cl	OMe	CH ₂	1-(3,3-dimethyl-butyl)	CF ₃	CH	*
143	Cl	OMe	CH ₂	i-butyl	CF ₃	CH	*
144	Cl	OMe	CH ₂	n-propyl	CF ₃	CH	*

* Vide Tabela Índice K para dados de NMR ^1H .

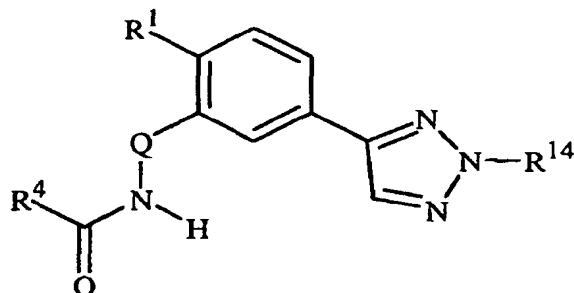
TABELA ÍNDICE H



Cmpd.	R ¹	R ⁴	Q	R ¹⁴	MP
145	Cl	OMe	CH ₂	H	*
148	Cl	OMe	CH ₂	4-Cl-Ph	*
149	Cl	OMe	CH ₂	4-Me-benzyl	*

* Vide Tabela Índice K para dados de NMR ^1H .

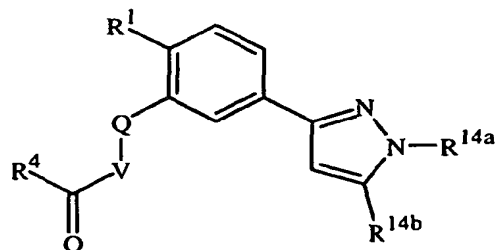
TABELA ÍNDICE I



Cmpd.	R ¹	R ⁴	Q	R ¹⁴	MP
146	Cl	OMe	CH ₂	4-Me-benzyl	*
147	Cl	OMe	CH ₂	4-Cl-Ph	*

* Vide Tabela Índice K para dados de NMR ^1H .

TABELA ÍNDICE J



Um traço ("-") indica uma união direta.

Cmpd.	R ¹	R ⁴	V	Q	R ^{14a}	R ^{14b}	MP
83	Me	OMe	—	C=O	3-CF ₃ -Ph	H	*
84	Me	OMe	—	C=NOMe	3-CF ₃ -Ph	H	*
85	Me	(NH)Me	—	C=NOMe	3-CF ₃ -Ph	H	*

* Vide Tabela Índice K para dados de NMR ¹H.

5

TABELA ÍNDICE K

Composto nº	Dados de NMR ¹ H (solução de CDCl ₃ a menos que indicado em contrário) ^a
1	δ 7,66 (br s, 1H), 7,51 (m, 1H), 7,34 (d, 1H), 5,21 (br s, 1H), 4,46 (d, 2H), 4,28 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,20 (s, 3H), 1,09 (m, 2H), 0,06 (s, 9H).
2	δ 7,66 (br s, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,35 (m, 1H), 5,18 (m, 1H), 4,46 (d, 2H), 4,14 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 1,71 (m, 2H), 0,54 (m, 2H), 0,01 (m, 9H).
3	δ 7,66 (br s, 1H), 7,53 (m, 1H), 7,35 (d, 1H), 5,18 (br s, 1H), 4,92 (d, 1H), 4,74 (s, 1H), 4,58 (s, 2H), 4,46 (d, 2H), 3,70 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,60 (s, 2H), 0,06 (m, 9H).
4	δ 7,65 (m, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,34 (d, 1H), 6,20 (m, 1H), 6,03 (m, 1H), 5,79 (m, 1H), 5,19 (s, 1H), 4,45 (d, 2H), 4,04 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 0,20 (m, 6H).
5	δ 7,62 (s, 1H), 7,51 (m, 2H), 7,44 (m, 1H), 7,33 (m, 3H), 5,18 (s, 1H), 4,44 (d, 2H), 4,17 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 0,38 (m, 6H).
6	δ 7,66 (s, 1H), 7,51 (m, 1H), 7,35 (d, 1H), 5,18 (s, 1H), 4,47 (d, 2H), 3,98 (s, 2H), 3,70 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 0,13 (m, 9H).
7	δ 7,65 (s, 1H), 7,49 (m, 1H), 7,33 (d, 1H), 5,25 (s, 1H), 4,45 (d, 2H), 4,00 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 1,00 (m, 3H), 0,62 (m, 2H), 0,09 (m, 6H).
8	δ 7,45 (m, 2H), 7,35 (m, 2H), 7,20 (m, 1H), 7,11 (d, 1H), 7,02 (dd, 1H), 6,55 (br, 1H), 6,32 (br s, 1H), 3,78 (s, 3H).
9	δ 7,59 (d, 2H), 7,52 (d, 2H), 7,33 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 7,05 (dd, 1H), 6,53 (br s, 1H), 6,29 (br s, 1H), 3,78 (s, 3H), 0,30 (s, 9H).

Composto nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
10	δ 7,54 (d, 2H), 7,35 (d, 1H), 7,27 (d, 2H), 7,11 (d, 1H), 7,00 (dd, 1H), 6,49 (br s, 1H), 6,31 (br s, 1H), 4,22 (q, 2H), 1,28 (m, 3H).
11	δ 7,54 (d, 2H), 7,34 (d, 1H), 7,27 (d, 2H), 7,10 (d, 1H), 7,00 (dd, 1H), 6,49 (br s, 1H), 6,31 (br s, 1H), 3,78 (s, 3H).
12	δ 7,71 (d, 2H), 7,65 (d, 2H), 7,38 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 7,03 (dd, 1H), 6,54 (br s, 1H), 6,33 (br s, 1H), 3,78 (s, 3H).
13	δ 7,46 (d, 2H), 7,33 (d, 1H), 7,31 (d, 2H), 7,11 (d, 1H), 7,02 (dd, 1H), 6,51 (br, 1H), 6,29 (br, 1H), 3,77 (s, 3H), 2,52 (s, 3H).
14	δ 7,60 (m, 3H), 7,54 (d, 2H), 7,43 (m, 2H), 5,18 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,69 (s, 3H), 0,30 (s, 9H).
15	δ 7,62 (br s, 1H), 7,59 (br m, 2H), 7,46 (br d, 1H), 7,38 (br m, 3H), 7,33 (br d, 1H), 4,45 (br d, 2H), 4,19 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 0,4 (s, 6H).
16	δ 7,63 (br s, 1H), 7,56 (m, 2H), 7,46 (d, 1H), 7,33 (d, 1H), 7,07 (t, 2H), 4,45 (d, 2H), 4,16 (s, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 0,4 (s, 6H).
17	δ 7,66 (br s, 1H), 7,50 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,21 (t, 2H), 7,08 (t, 1H), 7,04 (d, 2H), 4,46 (m, 2H), 3,98 (s, 2H), 3,68 (s, 3H), 2,22 (s, 2H), 2,17 (s, 3H), 0,1 (s, 6H).
18	δ 7,85 (s, 1H), 7,52 (d, 1H), 7,45 (m, 3H), 7,38 (s, 1H), 7,23 (m, 1H), 7,20 (d, 1H), 3,86 (s, 3H).
19	δ 7,84 (s, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,51 (d, 1H), 7,41 (m, 2H), 7,37 (d, 1H), 7,34 (m, 1H), 7,19 (m, 1H), 3,86 (s, 3H).
20	δ 7,82 (s, 1H), 7,69 (d, 1H), 7,53 (m, 2H), 7,38 (d, 1H), 7,07 (d, 1H), 6,81 (d, 1H), 6,59 (d, 1H), 5,46 (s, 2H), 5,17 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,57 (s, 3H).
21	δ 7,80 (s, 1H), 7,64 (m, 2H), 7,41 (d, 1H), 6,62 (d, 1H), 5,19 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).

Composto n°	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
22	δ 7,80 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,50 (d, 1H), 5,17 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 4,15 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 1,80 (m, 2H), 1,63 (m, 1H), 0,97 (d, 6H).
23	δ 7,80 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,51 (d, 1H), 5,15 (br s, 1H), 4,49 (br s, 2H), 4,11 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 1,88 (m, 2H), 0,50 (m, 2H), 0,00 (s, 9H).
24	δ 7,80 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,51 (d, 1H), 5,15 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 4,29 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,21 (m, 2H), 2,15 (m, 1H), 2,12 (m, 2H), 2,03 (m, 1H).
25	δ 7,80 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,45 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,56 (d, 1H), 5,44 (s, 2H), 5,27 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
26	δ 7,81 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 6,65 (d, 1H), 5,19 (br s, 1H), 5,11 (s, 2H), 4,50 (m, 2H), 3,70 (s, 3H).
27	δ 7,77 (d, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,27 (d, 1H), 6,49 (d, 1H), 5,14 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,77 (s, 2H), 3,70 (s, 3H), 0,96 (m, 3H), 0,63 (m, 2H), 0,11 (s, 6H).
28	δ 7,80 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,38 (m, 2H), 6,52 (d, 1H), 5,15 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 3,95 (s, 3H), 3,70 (s, 3H).
29	δ 7,78 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 6,49 (d, 1H), 5,14 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,86 (m, 1H), 3,70 (s, 3H), 1,56 (d, 3H), 0,09 (s, 9H).
30	δ 7,80 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,38 (s, 1H), 7,36 (m, 1H), 6,49 (d, 1H), 5,16 (br s, 1H), 5,10 (m, 1H), 4,50 (d, 2H), 4,12 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,57 (m, 2H), 1,99 (m, 1H), 1,69 (s, 3H), 1,53 (s, 3H).
31	δ 7,81 (s, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,52 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 6,56 (d, 1H), 5,19 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 4,42 (m, 2H), 3,70 (s, 3H), 3,01 (m, 2H).

Composto nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
32	δ 7,80 (s, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,54 (d, 1H), 5,19 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 4,30 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,34 (m, 4H).
34	δ 7,95 (d, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,76 (m, 3H), 7,47 (m, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,30 (m, 1H), 6,76 (d, 1H), 5,21 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
35	δ 8,19 (s, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,53 (s, 1H), 7,38 (m, 2H), 5,27 (br s, 1H), 4,47 (d, 2H), 3,70 (s, 3H), 2,99 (m, 6H).
36	δ 7,79 (s, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,34 (d, 1H), 7,11 (m, 4H), 6,95 (m, 4H), 6,51 (d, 1H), 5,17 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 4,14 (m, 2H), 3,88 (m, 1H), 3,67 (s, 3H), 1,99 (m, 2H), 1,86 (m, 2H).
37	δ 7,69 (d, 1H), 7,56 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,28 (d, 1H), 7,23 (d, 1H), 7,12 (m, 2H), 6,88 (d, 1H), 6,47 (d, 1H), 5,56 (br s, 1H), 5,35 (s, 2H), 4,37 (d, 2H), 3,57 (s, 3H).
38	δ 7,82 (s, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,57 (m, 1H), 7,52 (s, 1H), 7,48 (m, 1H), 7,40 (m, 3H), 6,59 (d, 1H), 5,41 (s, 2H), 5,17 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 3,69 (s, 3H).
39	δ 7,76 (s, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 6,28 (s, 1H), 5,19 (br s, 1H), 4,48 (d, 2H), 4,17 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,34 (s, 3H), 2,22 (m, 2H), 2,11 (m, 2H), 2,02 (t, 1H).
40	δ 7,77 (s, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 6,29 (s, 1H), 5,14 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 4,03 (m, 2H), 3,70 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 1,84 (m, 2H), 0,52 (m, 2H), 0,00 (m, 9H).
41	δ 7,80 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,38 (m, 2H), 6,51 (d, 1H), 5,15 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 4,12 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 1,91 (m, 2H), 1,58 (m, 1H), 1,22 (m, 2H), 0,89 (d, 6H).
42	δ 7,80 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,37 (m, 2H), 7,29 (m, 2H), 7,20 (m, 3H), 6,51 (d, 1H), 5,19 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 4,14 (m, 2H), 3,68 (s, 3H), 2,65 (m, 2H), 2,25 (m, 2H).

Composto nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
43	δ 7,80 (s, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,52 (d, 1H), 5,21 (br s, 1H), 4,50 (m, 3H), 4,39 (m, 1H), 4,30 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,30 (m, 2H).
45	δ 7,78 (s, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 6,84 (s, 1H), 5,22 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 4,19 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 1,91 (m, 2H), 0,52 (m, 2H), 0,00 (s, 9H).
46	δ 7,80 (s, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,36 (s, 0H), 6,50 (d, 1H), 5,16 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 4,14 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 1,88 (m, 2H), 1,36 (m, 2H), 0,96 (m, 3H).
47	δ 7,92 (s, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,43 (m, 2H), 5,15 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 4,06 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 1,86 (m, 2H), 0,49 (m, 2H), 0,00 (s, 9H).
48	δ 8,55 (d, 1H), 8,23 (s, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,94 (s, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,42 (d, 1H), 6,75 (d, 1H), 5,20 (br s, 1H), 4,53 (d, 2H), 3,71 (s, 3H), 2,37 (s, 3H).
49	δ 8,62 (d, 1H), 7,94 (s, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,71 (m, 1H), 7,42 (d, 1H), 7,04 (d, 1H), 6,75 (d, 1H), 5,20 (br s, 1H), 4,53 (d, 2H), 3,71 (s, 3H), 2,57 (s, 3H).
50	δ 8,05 (s, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,93 (m, 2H), 7,79 (d, 1H), 7,58 (m, 2H), 7,43 (d, 1H), 6,80 (d, 1H), 5,22 (br s, 1H), 4,53 (d, 2H), 3,71 (s, 3H).
51	δ 7,88 (s, 1H), 7,82 (m, 1H), 7,72 (m, 3H), 7,64 (m, 2H), 7,41 (d, 1H), 6,76 (d, 1H), 5,15 (br s, 1H), 4,50 (br s, 2H), 3,70 (s, 3H).
52	δ 7,92 (d, 1H), 7,90 (s, 1H), 7,76 (d, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,41 (m, 2H), 7,36 (m, 1H), 6,77 (d, 1H), 5,18 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
53	δ 7,81 (s, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,52 (m, 3H), 7,39 (d, 1H), 6,62 (d, 1H), 5,50 (s, 2H), 5,16 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 3,69 (s, 3H).
54	δ 8,31 (s, 1H), 8,04 (m, 2H), 7,93 (s, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,80 (d, 1H), 7,59 (m, 1H), 7,43 (d, 1H), 6,80 (d, 1H), 5,22 (br s, 1H), 4,53 (d, 2H), 3,71 (s, 3H), 2,69 (s, 3H).

Composto n°	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
55	δ 7,83 (s, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,69 (d, 1H), 7,62 (m, 1H), 7,54 (d, 2H), 7,45 (m, 3H), 7,36 (m, 3H), 6,59 (d, 1H), 5,41 (s, 2H), 5,24 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,68 (s, 3H).
56	δ 7,90 (m, 2H), 7,79 (s, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,52 (d, 1H), 7,43 (d, 2H), 7,36 (d, 1H), 6,47 (d, 1H), 5,16 (br s, 1H), 4,61 (m, 2H), 4,48 (d, 2H), 3,69 (s, 3H), 3,61 (m, 2H).
57	δ 7,81 (s, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,35 (m, 4H), 7,26 (s, 3H), 6,55 (d, 1H), 5,35 (s, 2H), 5,17 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
58	δ 7,81 (s, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,27 (m, 3H), 7,16 (d, 1H), 7,11 (d, 2H), 6,44 (d, 1H), 5,18 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 4,36 (m, 2H), 3,70 (s, 3H), 3,20 (t, 2H).
59	δ 7,79 (s, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,26 (m, 2H), 6,95 (m, 1H), 6,87 (d, 2H), 6,51 (d, 1H), 5,22 (br s, 1H), 4,52 (m, 2H), 4,48 (d, 2H), 4,35 (m, 2H), 3,68 (s, 3H).
60	δ 7,81 (s, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,39 (m, 2H), 7,28 (m, 2H), 7,22 (s, 1H), 7,12 (m, 1H), 6,58 (d, 1H), 5,32 (s, 2H), 5,18 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,69 (s, 3H).
61	δ 7,79 (s, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,38 (m, 2H), 7,28 (m, 2H), 6,96 (d, 1H), 6,89 (d, 2H), 6,48 (d, 1H), 5,17 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 4,38 (m, 2H), 3,94 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,38 (m, 2H).
62	δ 7,83 (s, 1H), 7,69 (d, 2H), 7,43 (m, 4H), 7,02 (d, 1H), 6,61 (d, 1H), 5,58 (s, 2H), 5,21 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,69 (s, 3H).
63	δ 7,82 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,60 (d, 2H), 7,42 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,33 (d, 2H), 6,59 (d, 1H), 5,41 (s, 2H), 5,19 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,69 (s, 3H).
64	δ 8,0 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,59 (t, 1H), 7,5 (d, 1H), 7,4 (s, 1H), 7,3 (d, 1H), 7,1 (d, 1H), 6,7 (s, 1H), 6,58 (br s, 1H), 5,7 (br s, 1H), 3,7 (s, 3H), 2,2 (s, 3H).

Composto nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
65	δ 7,81 (s, 1H), 7,67 (m, 1H), 7,39 (m, 3H), 7,15 (t, 2H), 7,08 (s, 1H), 6,59 (d, 1H), 5,36 (s, 2H), 5,20 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,69 (s, 3H).
66	δ 7,81 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,54 (m, 1H), 7,38 (m, 2H), 7,26 (m, 1H), 7,19 (m, 2H), 6,58 (d, 1H), 5,35 (s, 2H), 5,19 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,69 (s, 3H).
70	δ 7,81 (s, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,22 (m, 4H), 7,05 (d, 1H), 6,53 (d, 1H), 5,34 (s, 2H), 5,21 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,68 (s, 3H), 2,30 (s, 3H).
71	δ 7,81 (s, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,36 (m, 2H), 7,25 (m, 1H), 7,12 (d, 1H), 7,05 (m, 2H), 6,54 (d, 1H), 5,30 (s, 2H), 5,20 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,68 (s, 3H), 2,33 (s, 3H).
73	δ 8,17 (m, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,55 (m, 2H), 7,47 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,62 (d, 1H), 5,45 (s, 2H), 5,21 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,69 (s, 3H).
75	δ 7,81 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,60 (m, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,45 (m, 3H), 7,38 (d, 1H), 6,61 (d, 1H), 5,38 (s, 2H), 5,22 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,68 (s, 3H).
76	δ 7,80 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 7,29 (m, 4H), 7,11 (d, 1H), 6,57 (d, 1H), 5,43 (s, 2H), 5,22 (br s, 1H), 4,48 (d, 2H), 3,68 (s, 3H).
83	δ 8,2 (s, 1H), 8,0-8,1 (m, 3H), 7,9 (d, 1H), 7,5-7,6 (m, 2H), 7,4 (d, 1H), 6,8 (d, 1H), 4,0 (s, 3H), 2,6 (s, 3H).
84	δ 8,0 (s, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,9 (d, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,5-7,6 (m, 2H), 7,3 (d, 1H), 6,7 (d, 1H), 4,07 (s, 3H), 3,89 (s, 3H), 2,23 (s, 3H).
85	δ 8,0 (s, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,9 (d, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,5-7,6 (m, 2H), 7,3 (d, 1H), 6,7 (d, 1H), 3,89 (s, 3H), 2,9 (d, 3H), 2,2 (s, 3H).
90	δ 8,63 (d, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,86 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 6,83 (d, 1H), 5,20 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 4,16 (s, 6H), 3,70 (s, 3H).
91	δ 8,29 (d, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,46 (m, 2H), 7,31 (m, 3H), 6,82 (d, 1H), 5,25 (br, 1H), 4,51 (m, 4H), 3,71 (s, 3H).

Composto n°	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
92	δ 8,27 (d, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 6,81 (d, 1H), 5,32 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 4,11 (s, 3H), 3,71 (s, 3H).
93	δ 8,28 (d, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 6,81 (d, 1H), 5,31 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,71 (s, 3H), 3,26 (m, 2H), 1,47 (t, 3H).
94	δ 8,43 (d, 1H), 8,41 (d, 2H), 7,91 (s, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,76 (d, 2H), 7,46 (d, 1H), 6,88 (d, 1H), 5,27 (br s, 1H), 4,53 (d, 2H), 3,72 (s, 3H).
95	δ 8,25 (d, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 6,77 (d, 1H), 5,37 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,70 (s, 3H), 2,27 (m, 1H), 1,15 (m, 2H), 1,06 (m, 2H).
96	δ 8,32 (d, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,39 (m, 1H), 6,78 (d, 1H), 5,44 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,70 (s, 3H), 1,45 (s, 9H).
98	δ 7,44 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,26 (m, 1H), 5,25 (br s, 1H), 4,48 (d, 2H), 3,81 (s, 3H), 3,69 (s, 3H), 2,6 (m, 2H), 1,67 (m, 2H), 1,37 (m, 4H), 0,92 (m, 3H).
99	δ 7,80 (s, 1H), 7,57 (m, 3H), 7,39 (m, 3H), 6,74 (s, 1H), 5,72 (br s, 1H), 5,34 (br s, 1H), 4,41 (d, 2H), 3,62 (s, 3H), 1,34 (s, 9H).
100	(DMSO- d_6) δ 7,82 (s, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,65 (m, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,19 (s, 1H), 4,31 (d, 2H), 3,59 (s, 3H).
101	δ 7,78 (s, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 6,84 (s, 1H), 5,24 (br s, 1H), 4,47 (d, 2H), 4,24 (t, 2H), 3,70 (s, 3H), 1,83 (m, 2H), 1,01 (s, 9H).
102	δ 7,79 (s, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 6,85 (s, 1H), 5,23 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 4,23 (t, 2H), 3,70 (s, 3H), 1,93 (m, 2H), 1,40 (m, 2H), 0,97 (t, 3H).
103	δ 7,79 (s, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 6,85 (s, 1H), 5,23 (br s, 1H), 4,49 (d, 2H), 4,19 (t, 2H), 3,70 (s, 3H), 1,97 (m, 2H), 0,97 (t, 3H).
104	δ 8,22 (d, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,74 (d, 1H), 5,42 (br s, 1H), 4,42 (d, 2H), 3,67 (s, 3H), 3,18 (m, 1H), 1,37 (d, 6H).
105	δ 8,29 (d, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 6,81 (d, 1H), 5,32 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,71 (s, 3H), 2,62 (s, 3H).

Composto nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
106	δ 7,90 (d, 1H), 7,84 (d, 1H), 7,76 (d, 1H), 7,65 (d, 2H), 7,40 (d, 1H), 6,98 (d, 2H), 6,72 (d, 1H), 5,19 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,85 (s, 3H), 3,70 (s, 3H).
107	δ 7,93 (m, 2H), 7,78 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,37 (m, 2H), 7,30 (m, 1H), 6,84 (d, 1H), 6,75 (d, 1H), 5,19 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,89 (s, 3H), 3,70 (s, 3H).
108	δ 8,15 (d, 2H), 8,03 (d, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,85 (d, 2H), 7,78 (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 6,81 (d, 1H), 5,21 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,95 (s, 3H), 3,71 (s, 3H).
109	δ 7,90 (m, 2H), 7,77 (d, 1H), 7,63 (m, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,27 (m, 2H), 6,73 (d, 1H), 5,19 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,70 (s, 3H), 2,39 (s, 3H).
110	δ 7,91 (d, 2H), 7,77 (d, 1H), 7,65 (d, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,29 (m, 2H), 6,73 (d, 1H), 5,17 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,70 (s, 3H), 2,96 (m, 1H), 1,28 (d, 6H).
111	δ 7,92 (m, 2H), 7,77 (d, 1H), 7,61 (m, 4H), 7,41 (m, 1H), 6,77 (d, 1H), 5,19 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
112	δ 7,94 (m, 3H), 7,79 (d, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,42 (d, 2H), 7,33 (m, 1H), 6,77 (d, 1H), 5,20 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,71 (s, 3H).
113	δ 8,1 (d, 1H), 7,99 (m, 2H), 7,91 (d, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,59 (m, 2H), 7,44 (d, 1H), 6,81 (d, 1H), 5,21 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,71 (s, 3H).
114	δ 8,02 (d, 1H), 7,91 (m, 3H), 7,77 (m, 3H), 7,44 (d, 1H), 6,83 (d, 1H), 5,22 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
115	δ 7,95 (d, 1H), 7,93 (d, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,54 (m, 2H), 7,42 (m, 2H), 6,99 (m, 1H), 6,77 (d, 1H), 5,20 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
116	δ 7,89 (m, 2H), 7,74 (m, 3H), 7,44 (d, 1H), 7,16 (m, 2H), 6,75 (d, 1H), 5,22 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
117	δ 7,92 (m, 3H), 7,77 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,42 (d, 1H), 6,78 (d, 1H), 5,21 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
118	δ 7,90 (m, 2H), 7,77 (d, 1H), 7,66 (m, 1H), 7,45 (m, 2H), 7,26 (m, 1H), 6,77 (d, 1H), 5,21 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).

Composto nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário)^a
126	δ 7,74 (s, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,34 (d, 2H), 5,23 (BR 5,1H), 4,46 (d, 2H), 4,10 (2, 2H), 3,69 (5,3H), 1,88 (m, 2H), 0,49 (m, 2H), 0,00 (5,9H)
127	δ 8,02 (s, 1H), 7,83 (s, 2H), 7,36 (s, 2H), 5,30 (br s, 1H), 4,47 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
128	δ 7,78 (s, 1H), 7,60 (m, 1H), 7,31 (m, 8h), 5,32 (s, 2H), 5,28 (s, 1H), 4,43 (d, 2H), 3,67 (s, 3H).
129	δ 7,80 (s, 1H), 7,69 (s, 1H), 7,48 (s, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,33 (s, 2H), 7,26 (m, 2H), 7,09 (d, 1H), 5,45 (s, 2H), 5,24 (br s, 1H), 4,44 (d, 2H), 3,68 (s, 3H).
130	δ 8,65 (d, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,51 (d, 1H), 5,35 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
131	δ 8,84 (d, 1H), 8,27 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 8,03 (m, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,49 (d, 1H), 5,58 (m, 1H), 4,54 (d, 2H), 3,71 (s, 3H), 2,84 (s, 3H).
132	δ 8,81 (d, 1H), 8,44 (d, 2H), 8,21 (br s, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,52 (m, 2H), 7,32 (d, 2H), 5,29 (br s, 1H), 4,55 (d, 2H), 3,72 (s, 3H), 2,44 (s, 3H).
133	δ 8,83 (d, 1H), 8,36 (d, 2H), 8,21 (s, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,52 (d, 1H), 7,41 (m, 1H), 7,32 (d, 1H), 5,29 (br s, 1H), 4,56 (d, 2H), 3,72 (s, 3H), 2,48 (s, 3H).
134	δ 8,85 (d, 1H), 8,56 (m, 2H), 8,24 (s, 1H), 8,12 (d, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,52 (m, 4H), 5,29 (br s, 1H), 4,56 (d, 2H), 3,73 (s, 3H).
137	δ 8,58 (d, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,94 (d, 1H), 7,46 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 5,39 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,71 (s, 3H), 2,31 (m, 1H), 1,20 (m, 2H), 1,09 (m, 2H).
138	δ 8,92 (d, 1H), 8,16 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,54 (d, 1H), 5,31 (br s, 1H), 4,54 (d, 2H), 3,71 (s, 3H).
139	δ 8,56 (d, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,52 (d, 2H), 7,47 (d, 1H), 7,37 (m, 2H), 7,30 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 5,52 (s, 2H), 5,31 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,69 (s, 3H).

Composto nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
140	δ 7,71 (d, 1H), 7,34 (m, 3H), 7,27 (m, 4H), 7,03 (d, 1H), 6,51 (d, 1H), 5,12 (br s, 1H), 4,37 (d, 2H), 3,66 (s, 3H).
141	δ 7,49 (m, 2H), 7,29 (m, 1H), 6,56 (s, 1H), 4,49 (d, 2H), 3,91 (s, 3H), 3,68 (s, 3H).
142	δ 7,49 (d, 1H), 7,44 (s, 1H), 7,26 (d, 1H), 6,51 (s, 1H), 5,23 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 4,14 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 1,75 (m, 2H), 0,87 (s, 9H).
143	δ 7,48 (d, 1H), 7,43 (s, 1H), 7,25 (d, 1H), 6,51 (s, 1H), 5,23 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 4,11 (t, 2H), 3,69 (s, 3H), 1,79 (m, 2H), 1,24 (m, 2H), 0,86 (t, 3H).
144	δ 7,48 (d, 1H), 7,43 (s, 1H), 7,25 (d, 1H), 6,51 (s, 1H), 5,24 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 4,08 (t, 2H), 3,69 (s, 3H), 1,84 (m, 2H), 0,85 (t, 3H).
145	δ 7,94 (s, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,70 (d, 1H), 7,42 (d, 1H), 5,28 (br s, 1H), 4,50 (d, 2H), 3,71 (s, 3H).
146	δ 7,82 (s, 1H), 7,79 (br s, 1H), 7,61 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,24 (d, 2H), 7,13 (d, 2H), 5,56 (s, 2H), 5,23 (br s, 1H), 4,48 (d, 2H), 3,69 (s, 3H), 2,32 (s, 3H).
147	δ 8,08 (d, 2H), 8,04 (s, 1H), 7,96 (br s, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,48-7,44 (m, 3H), 5,25 (br s, 1H), 4,51 (d, 2H), 3,71 (s, 3H).
148	δ 8,20 (s, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,74 (d, 2H), 7,53 (d, 2H), 5,24 (br s, 1H), 4,52 (d, 2H), 3,70 (s, 3H).
149	δ 7,77 (s, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,65 (s, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,21 (s aparente, 4H), 5,52 (s, 2H), 5,21 (br s, 1H), 4,41 (d, 2H), 3,67 (2, 3H), 2,36 (s, 3H).
150	δ 8,10 (m, 3H), 7,92 (m, 3H), 7,80 (d, 1H), 6,83 (s, 1H), 5,23 (br s, 1H), 4,54 (d, 2H), 3,75 (s, 3H), 2,65 (s, 3H).

^a NMR ^1H são em ppm abaixo no fluxo a partir de tetrametilsilano.

Os acoplamentos são designados por (s) isolado, (br s) isolado amplo, (d) dupla, (t) trio, (q) quarteto, (m) múltiplo, (dd) par de duplas.

EXEMPLOS BIOLÓGICOS DA INVENÇÃO

PROTOCOLO GERAL DE PREPARAÇÃO DE SUSPENSÕES DE TESTE PARA OS TESTES A A L

Os compostos de teste foram dissolvidos em primeiro lugar em acetona em uma quantidade igual a 3% do volume final e suspensos em
5 seguida na concentração desejada (em ppm) em acetona e água purificada (mistura 50/50) 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 L. Pulverização de uma suspensão de teste de 200
10 ppm até o ponto de encharcamento das plantas de teste foi equivalente a uma taxa de aplicação de 500 g/ha.

TESTE A

A suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento sobre mudas de trigo. No dia seguinte, as mudas foram inoculadas com um pó de esporos de *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* (o agente
15 causador de míldo do pó de trigo) e incubadas em uma câmara de crescimento a 20 °C por oito dias, após o quê foram realizadas as avaliações da doença ao longo do tempo.

TESTE B

A suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento
20 sobre mudas de trigo. No dia seguinte, as mudas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (o agente causador da ferrugem das folhas de trigo) e incubadas em uma atmosfera saturada a 20 °C por 24 horas e movidas em seguida para uma câmara de crescimento a 20 °C por sete dias, após o quê foram realizadas avaliações visuais da doença.

25

TESTE C

A suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento sobre mudas de trigo. No dia seguinte, as mudas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Septoria nodorum* (o agente

causador de manchas de gluma de trigo), incubadas em uma atmosfera saturada a 20 °C por 48 horas e movidas em seguida para uma câmara de crescimento a 20 °C por sete dias, após o quê foram realizadas avaliações visuais da doença.

5

TESTE D

A suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento sobre mudas de trigo. No dia seguinte, as mudas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Septoria tritici* (o agente causador de manchas das folhas de trigo), incubadas em uma atmosfera saturada a 24 °C por 48 horas e movidas em seguida para uma câmara de crescimento a 20 °C por dezenove dias, após o quê foram realizadas avaliações visuais da doença.

10

TESTE E

A suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento sobre mudas de trigo. No dia seguinte, as mudas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Fusarium graminearum* (o agente causador de crosta da cabeça de trigo), incubadas em uma atmosfera saturada a 24 °C por 72 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.

15

20

TESTE F

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 *Botrytis cinerea* (o agente causador de Botrytis de tomate), incubadas em uma atmosfera saturada a 20 °C por 48 horas e movidas em seguida para uma câmara de crescimento a 24 °C por três dias adicionais, após o quê foram realizadas avaliações visuais da doença.

25

TESTE G

A suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento sobre mudas de pepino. No dia seguinte, as mudas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Colletotrichum orbiculare* (o agente causador de antracnose de *Colletotrichum* de pepino), incubadas em uma atmosfera saturada a 20 °C por 24 horas e movidas em seguida para uma câmara de crescimento a 24 °C por cinco dias, após o quê foram realizadas avaliações visuais da doença.

TESTE H

A suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento sobre mudas de trigo. No dia seguinte, as mudas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Alternaria solani* (o agente causador de ferrugem precoce do tomate), incubadas em uma atmosfera saturada a 27 °C por 48 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 I

A suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento sobre mudas de grama dobrada rasteira. No dia seguinte, as mudas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Rhizoctonia oryzae* (o agente causador de emplastro marrom dos gramados), incubadas em uma atmosfera saturada a 27 °C por 48 horas e movidas em seguida para uma câmara de crescimento a 27 °C por três dias, após o quê foram realizadas avaliações visuais da doença.

TESTE J

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 de ferrugem tardia 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 quatro dias, após o quê foram realizadas avaliações visuais da doença.

5

TESTE K

Mudas de uva foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Plasmopara viticola* (o agente causador de 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 e movida em seguida para uma câmara de crescimento a 20 °C por seis dias, após o quê as unidades de teste foram colocadas de volta em uma atmosfera saturada a 20 °C por 24 horas. Mediante remoção, foram realizadas avaliações visuais da doença.

10

TESTE L

A suspensão de teste foi pulverizada até o ponto de encharcamento sobre mudas de grama preta. No dia seguinte, as mudas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Pythium aphanidermatum* (o agente causador de ferrugem de pítio de grama preta), incubadas em uma atmosfera saturada coberta a 27 °C por 48 horas, as coberturas foram removidas em seguida e as plantas foram mantidas a 27 °C por três dias adicionais, após o quê foram realizadas avaliações visuais da doença.

15

20

Os resultados dos Testes A a L 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 resultados de teste. Todos os resultados são para 200 ppm, exceto quando seguidos por “*”, que indica 40 ppm, ou “**”, que indica 50 ppm.

25

TABELA A
RESULTADOS DE TESTES BIOLÓGICOS

	Percentual de controle de doença											
Composto	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste
nº	A	B	C	D	E	F	G	H	I	J	K	L
1	100	100	100	100*	100	0	-	0	0	0	66	0
2	100	100	99	91*	100	0	-	-	0	0	70	0
3	98	100	99	16*	87	0	-	-	0	0	26	0
4	98	99	99	59*	97	37	-	-	0	0	74	0
5	99	100	99	100*	0	0	-	77	0	0	23	0
6	99*	100*	96*	100*	68*	-	-	-	-	-	-	-
7	100*	100*	99*	100*	0*	-	-	-	-	-	-	-
8	100	100	99	-	92	0	100	-	0	100	99	33
9	95	99	100	-	0	29	99	-	0	0	0	0
10	98	79	82	-	0	0	25	-	0	0	0	0
11	100	100	96	-	86	0	99	-	0	93	79	87
12	98	95	98	-	98	45	91	-	0	0	0	63
13	46	89	99	-	0	0	-	-	0	0	0	0
14	96	98	93	-	0	0	0	-	0	0	0	80
15	100*	100*	100*	100*	-	0	-	33	-	-	-	-
16	99*	100*	100*	100*	-	67	-	95*	-	-	-	-
17	67	99*	100	100*	-	0	-	38	-	-	-	-
18	100*	99*	99*	98*	100	0	-	70	0	89	81	98
19	99*	99*	97*	98*	99*	0*	-	63*	-	-	-	-
20	99	100	96	-	72	0	-	0	0	0	0	0
21	0	79	0	-	0	0	-	0	0	0	0	0
22	99*	95*	99	85*	99	0	-	0	0	50	99	94*
23	99*	100*	100*	98*	99	0	-	0	0	91	99*	93*

	Percentual de controle de doença											
Composto	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste
nº	A	B	C	D	E	F	G	H	I	J	K	L
24	96*	99*	99*	-	96*	0	-	0	0	0*	83	-
25	91	96	78	96	77	37	-	76	0	0	63	0
26	0	73	0	26	0	0	-	0	0	60	6	0
27	96	99*	94*	96*	93	0	-	0	0	0	76	0
28	54	88	0	86	0	0	-	28	0	0	25	0
29	78**	98**	82**	96**	-	0**	-	67**	0**	0**	27**	0**
30	83	98	73	90	-	0	-	0	0	0	74	0
31	0*	0*	0*	69*	-	0*	-	0*	0*	0*	20*	0*
32	41	80	0	88	-	0	-	0	0	0	34	0
34	97*	100*	97*	100*	98*	0	-	90*	0	0	78	0
35	76	76	0	100	0	0	-	0	-	-	-	-
36	98*	99*	99*	97*	26	0	-	78	-	-	-	-
37	99*	100*	100*	100*	99*	0	-	0	-	-	-	-
38	98*	99*	100*	100*	96*	0	-	82	-	-	-	-
39	99*	100*	99*	100*	91*	0	-	0	-	-	-	-
40	99*	100*	99*	100*	13*	0*	-	50*	-	-	-	-
41	99	100*	100	98*	99*	0	-	0	-	-	-	-
42	98*	100*	100*	100*	100*	0	-	0	-	-	-	-
43	91	99	95	93	94	0	-	0	-	-	-	-
45	99*	100*	100	99*	26	0	-	0	-	-	-	-
46	94*	99*	99	91*	94*	0	-	0	-	-	-	-
47	98*	100*	100*	99*	94	0	-	66	-	-	-	-
48	65*	100*	99*	99*	94*	0*	-	99*	-	-	-	-
49	79	100*	99	100*	99*	0	-	99*	-	-	-	-

	Percentual de controle de doença											
Composto	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste
nº	A	B	C	D	E	F	G	H	I	J	K	L
50	100*	99*	100*	100*	97*	0	-	55	-	-	-	-
51	97*	99*	98*	100*	-	0*	-	60*	-	-	-	-
52	100*	100*	100*	100*	-	99	-	92	-	-	-	-
53	98*	99*	94*	99*	-	0*	-	92*	-	-	-	-
54	99*	100*	99*	99*	-	0*	-	-	-	-	-	-
55	88*	88*	92*	95*	-	0*	-	16*	-	-	-	-
56	89*	97*	97*	90*	-	0*	-	92*	-	-	-	-
57	97*	100*	87*	100*	-	0*	-	96*	-	-	-	-
58	98*	100*	100*	99*	-	0*	-	89*	-	-	-	-
59	98*	100*	100*	99*	-	0*	-	89*	-	-	-	-
60	98*	100*	99*	97*	-	0*	-	87*	-	-	-	-
61	84*	100*	99*	99*	-	0*	-	0*	-	-	-	-
62	99*	99*	100*	100*	-	0*	-	0*	-	-	-	-
63	97*	100*	99*	100*	-	0*	-	98*	-	-	-	-
64	99*	100*	99	93*	-	16	-	62	-	-	-	-
65	99*	99*	99*	100*	-	0*	-	8*	-	-	-	-
66	99*	100*	100*	100*	-	0*	-	96*	-	-	-	-
67	96*	99*	99*	100*	-	0	-	86*	-	-	-	-
68	97*	100*	99*	100*	-	0	-	86*	-	-	-	-
69	97*	92*	98*	98*	-	0	-	32	-	-	-	-
70	99*	99*	100*	100*	-	-	-	96*	-	-	-	-
71	99*	100*	100*	100*	-	-	-	84*	-	-	-	-
72	99*	99*	100*	100*	-	97*	-	94*	-	-	-	-
73	74*	98*	96*	98*	-	95*	-	14*	-	-	-	-

	Percentual de controle de doença											
Composto	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste
nº	A	B	C	D	E	F	G	H	I	J	K	L
74	100*	100*	100*	100*	-	51*	-	99*	-	-	-	-
75	72*	93*	10*	91*	-	20*	-	61*	-	-	-	-
76	99*	100*	99*	100*	-	0*	-	0*	-	-	-	-
77	99*	100*	100*	100*	-	-	-	96*	-	-	-	-
78	100*	85*	0*	90*	-	33*	-	0*	-	-	-	-
79	99*	99*	100*	99*	-	0*	-	-	-	-	-	-
80	98*	98*	100*	100*	-	60*	-	29*	-	-	-	-
81	85*	99*	100*	99*	-	81*	-	97*	-	-	-	-
82	60*	0*	86*	-	-	0*	-	7*	-	-	-	-
83	19	0	0	89	-	0	-	0	-	-	-	-
84	98*	80	92	99*	-	67	-	54	-	-	-	-
85	100*	97*	99*	99*	-	0	-	86	-	-	-	-
86	99*	100*	100*	98*	-	0*	-	9*	-	-	-	-
87	82*	100*	97*	99*	-	0*	-	9*	-	-	-	-
88	95*	97*	100*	100*	-	0*	-	0*	-	-	-	-
89	100*	100*	100*	100*	-	0	-	89*	-	-	-	-
90	0*	90*	0*	80*	-	0*	-	0*	-	-	-	-
91	0*	90*	0*	80*	-	0*	-	0*	-	-	-	-
92	82	97*	92*	72	-	0	-	15	-	-	-	-
93	93*	98*	100*	96*	-	0	-	15	-	-	-	-
94	0	17	0	40	-	0	-	0	-	-	-	-
95	100*	100*	100*	100*	-	90*	-	25	-	-	-	-
96	100*	100*	100*	100*	-	0	-	59	-	-	-	-
97	98*	100*	100*	100*	-	0	-	85	-	-	-	-

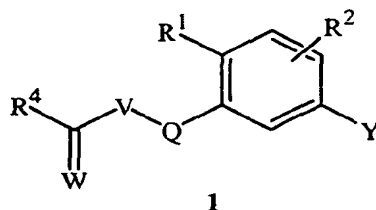
	Percentual de controle de doença											
Composto	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste
nº	A	B	C	D	E	F	G	H	I	J	K	L
98	91	98*	90*	98	-	0	-	0	-	-	-	-
99	82	74	0	92	-	98	-	0	-	-	-	-
100	0	0	0	40	-	0	-	0	-	-	-	-
101	98*	99*	100*	95*	-	0	-	0	-	-	-	-
102	98*	98*	96*	98*	-	0	-	-	-	-	-	-
103	99*	98*	87	99*	-	0	-	-	-	-	-	-
104	100*	100*	100*	100*	-	0	-	40	-	-	-	-
105	51	100*	100*	99*	-	0	-	90*	-	-	-	-
106	98*	100*	100*	100*	-	0	-	92*	-	-	-	-
107	100*	100*	100*	99*	-	89	-	99*	-	-	-	-
108	0	86	95	98*	-	0	-	28	-	-	-	-
109	98*	100*	100*	99*	-	92*	-	100*	-	-	-	-
110	100*	100*	100*	97*	-	96*	-	85	-	-	-	-
111	99*	100*	100*	100*	-	95	-	90*	-	-	-	-
112	88	99*	100*	100*	-	0	-	93	-	-	-	-
113	92	99	100	100	-	24	-	0	-	-	-	-
114	93	99	100	100	-	0	-	0	-	-	-	-
115	98	99	100	100	-	32	-	96	-	-	-	-
116	99	100	100	96	-	0	-	99	-	-	-	-
117	98	99	100	100	-	94	-	95	-	-	-	-
118	100	100	100	100	-	40	-	99	-	-	-	-
119	100*	100*	100*	100*	-	51	-	57	-	-	-	-
120	98*	79	0	94*	-	0	-	0	-	-	-	-
121	98*	98*	100*	99*	-	0	-	90*	-	-	-	-

	Percentual de controle de doença											
Composto	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste
nº	A	B	C	D	E	F	G	H	I	J	K	L
122	100*	100*	100*	100*	-	63	-	97*	-	-	-	-
123	98*	99*	100*	99*	-	63	-	87	-	-	-	-
124	100*	100*	100*	100*	-	0	-	99*	-	-	-	-
126	95	98*	99	97*	0	0	-	0	-	-	-	-
127	0	9	0	53	-	0	-	0	-	-	-	-
128	29	98	82	96*	-	0	-	0	-	-	-	-
129	94	98	90	92*	-	0	-	0	-	-	-	-
130	80	67	92	96	-	0	-	0	-	-	-	-
131	0	0	0	13	-	0	-	0	-	-	-	-
132	80	95*	98*	100*	-	0	-	0	-	-	-	-
133	94	93	93	92*	-	0	-	0	-	-	-	-
134	0	84	96*	87	-	0	-	0	-	-	-	-
137	95	99	90*	97*	-	0	-	15	-	-	-	-
138	56	48	92	77	-	0	-	0	-	-	-	-
139	87	100*	99*	92*	-	0	-	26	-	-	-	-
140	0	32	0	96	-	0	-	0	-	-	-	-
141	96	89	82	98	-	0	-	0	-	-	-	-
142	85	55	0	92	-	0	-	16	-	-	-	-
143	93	19	0	93	-	0	-	0	-	-	-	-
144	97	19	0	95	-	0	-	0	-	-	-	-
145	0	0	0	30	-	0	-	15	-	-	-	-
146	52	93	99	93	-	0	-	22	-	-	-	-
147	100*	99*	99*	100*	-	61	-	15	-	-	-	-
148	85	90*	90	98*	-	46	-	0	-	-	-	-

	Percentual de controle de doença											
Composto	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste	Teste
n°	A	B	C	D	E	F	G	H	I	J	K	L
149	0	99	100	99	-	0	-	0	-	-	-	-
150	71	98	100	99	-	0	-	92	-	-	-	-

REIVINDICAÇÕES

1. COMPOSTO, selecionado a partir da Fórmula 1, seus *N*-óxidos e sais:

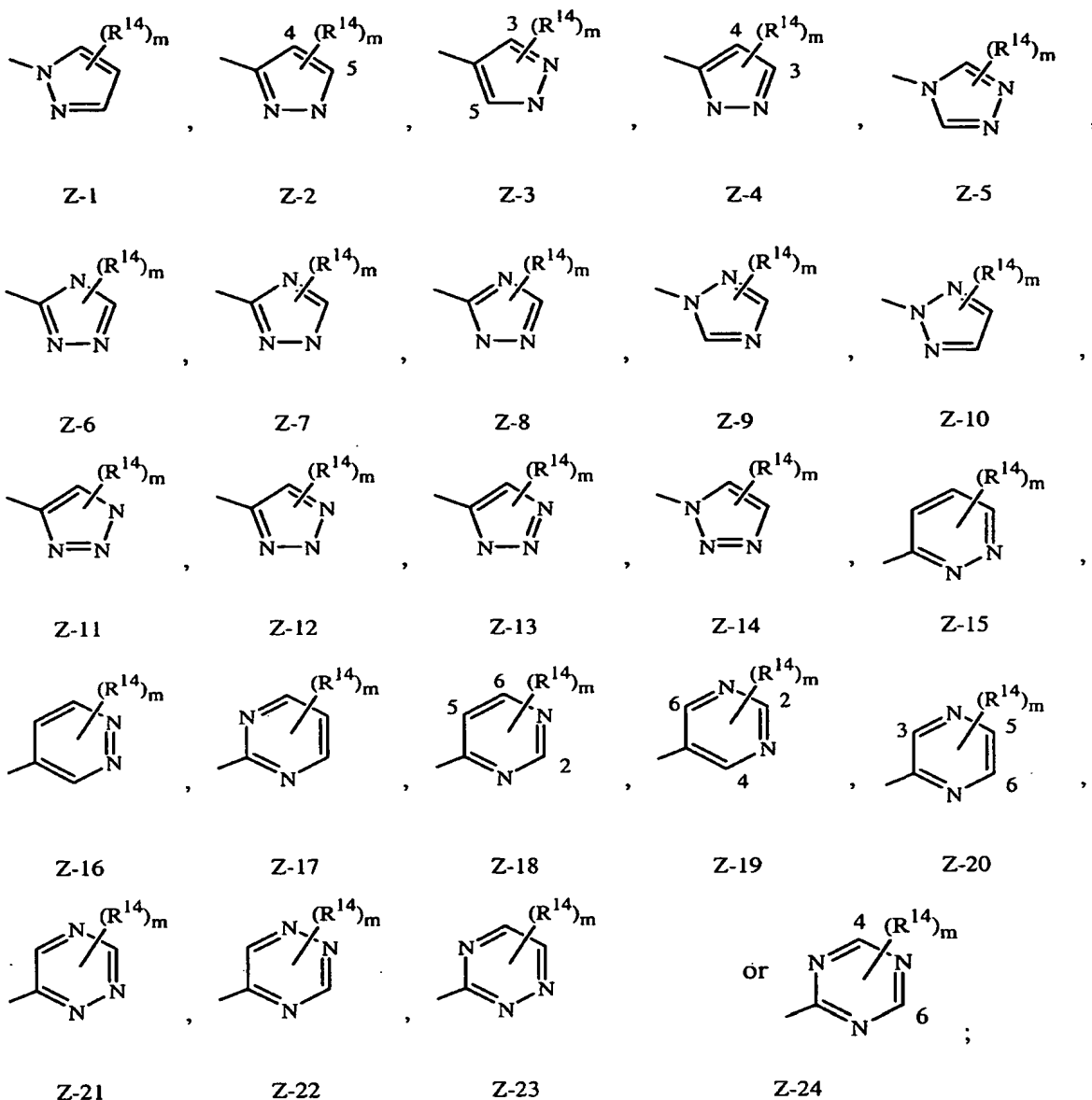


5 em que:

- cada R^1 e R^2 é independentemente H, halogênio, CN, alquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , haloalcóxi C_1-C_3 , cicloalquila C_3-C_6 , trialquilsilila C_3-C_{15} ou halotrialquilsilila C_3-C_{15} ;
- V é uma união direta ou NR^3 ;
- 10 - R^3 é H, alquila C_1-C_3 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_3 , alquilcarbonila C_2-C_6 , haloalquilcarbonila C_2-C_6 , alcóxicarbonila C_2-C_6 ou haloalcóxicarbonila C_2-C_6 ;
- R^4 é H, alquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , cicloalcóxi C_3-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , haloalquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_8 , halodialquilamino C_2-C_8 ou
- 15 cicloalquilamino C_3-C_6 ;
- W é O ou S;
- Q é $CR^{6a}R^{6b}$, O, NR^7 , $C(=N)-O-R^7$ ou $C(=O)$;
- Y é $-C(R^5)=N-O-(CR^{8a}R^{8b})_p-X-(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}$, ou
- 20 Z; ou um anel fenila substituído com um substituinte selecionado a partir de haloalcóxi C_1-C_5 , trialquilsilila C_3-C_{15} , trialquilsililalquila C_4-C_{20} , trialquilsililalcóxi C_4-C_{20} , trialquilsililalcóxicarbonila C_5-C_{25} opcionalmente substituído com até quatro substituintes adicionais selecionados independentemente a partir de halogênio, CN, alquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_3 , haloalcóxi C_1-C_3 , trialquilsilila C_3-C_{15} ,
- 25 halotrialquilsilila C_3-C_{15} , trialquilsililalquila C_4-C_{20} , trialquilsililalcóxi C_4-C_{20} e

trialquilsililalcoxialquila C₅-C₂₅; desde que, quando Y for um anel fenila, Q seja O, NR⁷, C=N-O-R⁷ ou C(=O);

- Z é um anel heteroarômático com cinco ou seis membros selecionado a partir de Z-1 a Z-24:



5

- R⁵ é H, CN, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, trialquilsilila C₃-C₁₅ ou halotrialquilsilila C₃-C₁₅;

- R^{6a} é H, OH, halogênio, CN, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alcoxialquila C₂-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ ou alquilsulfonila C₁-C₆;

- R^{6b} é H, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , alcoxialquila C_2-C_6 , alcóxi C_1-C_6 ou haloalcóxi C_1-C_6 ; ou

- R^{6a} e R^{6b} são tomados em conjunto com o átomo de carbono ao qual são ligados para formar um anel cicloalquila C_3-C_6 ou anel halocicloalquila C_3-C_6 ;

- R^7 é H, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou haloalquilcarbonila C_2-C_3 ;

- cada R^8 e R^{9a} é independentemente H, OH, CN, halogênio, alquila C_1-C_5 , haloalquila C_1-C_5 ou alcóxi C_1-C_5 ;

- cada R^{8b} e R^{9b} é independentemente H, CN, halogênio, alquila C_1-C_5 , haloalquila C_1-C_5 ou alcóxi C_1-C_5 ; ou

- cada par de R^{8a} e R^{8b} ou R^{9a} e R^{9b} ligados ao mesmo átomo de carbono pode ser tomado independentemente junto com o átomo de carbono ao qual são ligados para formar um anel cicloalquila C_3-C_6 ou halocicloalquila C_3-C_6 ; ou

- cada R^{8a} , R^{8b} , R^{9a} ou R^{9b} pode ser tomado independentemente junto com um R^{8a} , R^{8b} , R^{9a} ou R^{9b} ligado a um átomo de carbono adjacente e os átomos de carbono aos quais são ligados para formar um anel cicloalquila C_3-C_6 ou halocicloalquila C_3-C_6 ;

- cada R^{10a} , R^{10b} e R^{10c} é independentemente alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , alcoxialquila C_2-C_8 , haloalcoxialquila C_2-C_8 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , alquilcicloalquila C_4-C_7 , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquenila C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquilcarbonila C_2-C_6 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , trialquilsililalquila C_4-C_{12} ou J;

- cada J é independentemente um anel fenila; um anel heteroaromático com cinco ou seis membros; ou um sistema de anéis bicíclicos fundidos com oito, nove ou dez membros, ou um anel carbocíclico ou

heterocíclico não aromático com três a seis membros, em que o mencionado anel ou sistema de anéis inclui opcionalmente membros de anéis selecionados a partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), C(=NR¹¹), NR¹¹, SiR^{12a}R^{12b} e S(=O)_u(=NR¹¹)_z e cada anel ou sistema de anéis opcionalmente substituído

5 com até cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R¹³; ou

- dois dentre R^{10a}, R^{10b} ou R^{10c} são tomados junto com o átomo de silício ao qual são ligados para formar um anel saturado que contém de três a seis átomos de carbono além do átomo de silício como membros de anéis, em que o anel é opcionalmente substituído sobre átomos de carbono

10 com halogênio;

- X é uma união direta, O, NR¹¹, C(=O), C(=S) ou C(=NR¹¹); ou um anel fenila, um anel heteroaromático com cinco ou seis membros ou um anel carbocíclico ou heterocíclico não aromático com três a oito membros, em que o mencionado anel inclui opcionalmente membros de anéis selecionados a

15 partir do grupo que consiste de C(=O), C(=S), C(=NR¹¹), NR¹¹, SiR^{12a}R^{12b} e S(=O)_u(=NR¹¹)_z, opcionalmente substituído com até cinco substituintes selecionados independentemente a partir de R¹³;

- cada R¹¹ é independentemente H, CN, NH₂, OH, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquilcarbonila C₂-C₆, haloalquilcarbonila C₂-C₆ ou alcóxi C₁-C₆;

20

- cada R^{12a} e R^{12b} é independentemente alquila C₁-C₅, alquenila C₂-C₅, alquinila C₂-C₅, cicloalquila C₃-C₈, halocicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₇, alquilcicloalquilalquila C₅-C₈, haloalquila C₁-C₅, alcóxi C₁-C₅ ou haloalcóxi C₁-C₅;

- cada R¹³ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆,

25

- alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alquilcarbonila C₂-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₆, trialquilsilila C₃-C₁₅ ou halotrialquilsilila C₃-C₁₅;
- cada R¹⁴ é independentemente H, halogênio, ciano, hidróxi, amino, nitro, -CH(=O) ou -C(=O)NH₂; ou alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, halocicloalquila C₃-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, haloalquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₈, alcóxicarbonila C₂-C₈, alquilaminocarbonila C₂-C₈, dialquilaminocarbonila C₃-C₁₀, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈, halocicloalcóxi C₃-C₈, alquilcarbonilóxi C₂-C₈, cicloalquilcarbonilóxi C₄-C₁₀, alquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, cicloalquilsulfonila C₃-C₈, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₈, alquilcarbonilamino C₂-C₈, alquilsulfonilamino C₁-C₆, alquilaminossulfonila C₁-C₆, dialquilaminossulfonila C₂-C₈, naftalenila ou G^A, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio, ciano, hidróxi, amino, nitro, -CH(=O), -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, -C(R¹⁵)=N-O-R¹⁶, -C(R¹⁵)=N-R¹⁶, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, haloalquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₈, haloalquilcarbonila C₂-C₈, cicloalquilcarbonila C₄-C₁₀, alcóxicarbonila C₂-C₈, cicloalcóxicarbonila C₄-C₁₀, alquilaminocarbonila C₂-C₈, dialquilaminocarbonila C₃-C₁₀, cicloalquilaminocarbonila C₄-C₁₀, 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 C₃-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₈, alquilcarbonilóxi C₂-C₈, haloalquilcarbonilóxi C₂-C₈, cicloalquilcarbonilóxi C₄-C₁₀, alquiltio C₁-C₆, benziltio, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆,

haloalquilsulfonila C_1-C_6 , cicloalquilsulfonila C_3-C_8 , trialquilsilila C_3-C_{10} ,
 alquilamino C_1-C_6 , dialquilamino C_2-C_8 , haloalquilamino C_1-C_6 ,
 halodialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_8 , alquilcarbonilamino C_2-C_8 ,
 haloalquilcarbonilamino C_1-C_6 , alquilsulfonilamino C_1-C_6 , haloalquilsulfonilamino
 5 C_1-C_6 e G^B ;

- G^A é independentemente um anel fenila, benzila, benzilóxi, benzoíla, fenóxi ou fenilsulfonila ou um anel heteroaromático com cinco ou seis membros;

- cada G^B é independentemente um anel fenila ou um anel
 10 heteroaromático com cinco ou seis membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio, alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , alquilcicloalquila C_4-C_7 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , ciano, nitro, alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 e alquiltio
 15 C_1-C_6 ;

- cada R^{15} é alquila C_1-C_3 , cicloalquila C_3-C_8 ou haloalquila C_1-C_3 ;

- cada R^{16} é H, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou haloalquilcarbonila C_2-C_3 ;

20 - m é um número inteiro de 1 a 3;

- p e q são independentemente um número inteiro de 0 a 5; desde que, quando p for 0, X seja diferente de O ou NR^{11} ; e

- u e z em cada caso de $S(=O)_u(=NR^{11})_z$ são independentemente 0, 1 ou 2, desde que a soma de u e z em cada caso de
 25 $S(=O)_u(=NR^{11})_z$ seja 0, 1 ou 2.

2. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, em que:

- R^1 é halogênio, CN, alquila C_1-C_2 , alcóxi C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;

- R^2 é H, halogênio, CN, metila ou trifluorometila;
 - V é NR^3 ;
 - R^3 é H, alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou haloalquilcarbonila C_2-C_3 ;
- 5 - R^4 é alcóxi C_1-C_2 , haloalcóxi C_1-C_2 , alquilamino C_1-C_2 ou dialquilamino C_2-C_4 ;
- W é O;
 - Q é $CR^{6a}R^{6b}$, $C=N-O-R^7$, O ou NR^7 ;
 - R^5 é alquila C_1-C_3 ou haloalquila C_1-C_3 ; e
- 10 - Y é $-C(R^5)=N-O-(CR^{8a}R^{8b})_p-X-(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}$.
3. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 2, em que:
- R^1 é F, Cl, Br, CN, metila ou haloalquila C_1 ;
 - R^2 é H, F ou Cl;
 - R^3 é H, alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 ;
- 15 - R^4 é alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;
- Q é $CR^{6a}R^{6b}$ ou NR^7 ;
 - R^5 é alquila C_1-C_3 ;
 - p é 0; e
 - X é uma união direta.
- 20 4. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, em que:
- R^1 é halogênio, CN, alquila C_1-C_2 , alcóxi C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;
- R^2 é H, halogênio, CN, metila ou trifluorometila;
 - V é NR^3 ;
- 25 - R^3 é H, alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou haloalquilcarbonila C_2-C_3 ;
- R^4 é alcóxi C_1-C_2 , haloalcóxi C_1-C_2 , alquilamino C_1-C_2 ou dialquilamino C_2-C_4 ;

- W é O;
- Q é O ou NR⁷; e
- Y é um anel fenila substituído com um substituinte selecionado a partir de haloalcóxi C₁-C₅, trialquilsilila C₃-C₁₅, halotrialquilsilila C₃-C₁₅, trialquilsilila C₄-C₂₀, trialquilsililalcóxi C₄-C₂₀ e trialquilsililalcoxialquila C₅-C₂₅ e opcionalmente substituído com até quatro substituintes adicionais selecionados independentemente a partir de halogênio, CN, alquila C₁-C₃, alcóxi C₁-C₃, haloalcóxi C₁-C₃, trialquilsilila C₃-C₁₅, halotrialquilsilila C₃-C₁₅, trialquilsililalquila C₄-C₂₀, trialquilsililalcóxi C₄-C₂₀ e trialquilsililalcoxialquila C₅-C₂₅.

5. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 4, em que:

- R¹ é halogênio, CN, alquila C₁-C₂ ou haloalquila C₁-C₂;
- R² é H ou halogênio;
- R³ é H, alquila C₁-C₂ ou haloalquila C₁-C₂;
- R⁴ é alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂;
- Q é NR⁷;
- R⁵ é alquila C₁-C₃; e
- Y é um anel fenila substituído com um substituinte adicional

selecionado a partir de haloalcóxi C₁-C₃, trialquilsilila C₃-C₉, halotrialquilsilila C₃-C₉, trialquilsililalquila C₄-C₁₂ e trialquilsililalcóxi C₄-C₁₂ e opcionalmente substituído com até quatro substituintes adicionais selecionados independentemente a partir de halogênio, CN, alquila C₁-C₃, alcóxi C₁-C₃ e haloalcóxi C₁-C₃.

6. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, em que:

- R¹ é halogênio, CN, alquila C₁-C₂, alcóxi C₁-C₂, haloalquila C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂;
- R² é H, halogênio, CN, metila ou trifluorometila;
- R³ é H, alquila C₁-C₂, haloalquila C₁-C₂, alquilcarbonila C₂-

C₃ ou haloalquilcarbonila C₂-C₃;

- R⁴ é alcóxi C₁-C₂, haloalcóxi C₁-C₂, alquilamino C₁-C₂ ou dialquilamino C₂-C₄;

- W é O;

5 - Q é CR^{6a}R^{6b}, O, C=N-O-R⁷ ou NR⁷; e

- Y é Z.

7. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 6, em que:

- R¹ é halogênio, CN, alquila C₁-C₂ ou haloalquila C₁-C₂;

- R² é H ou halogênio;

10 - R³ é H, alquila C₁-C₂ ou haloalquila C₁-C₂;

- R⁴ é alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂;

- R⁵ é alquila C₁-C₃; e

- Y é Z-1, Z-2, Z-3, Z-4, Z-6, Z-7, Z-8, Z-9, Z-11, Z-12, Z-18

ou Z-24.

15 8. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 7, em que:

- cada R¹⁴ é independentemente alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, haloalquila C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ ou G^A, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio, ciano, hidróxi, amino, nitro, -CH(=O),
 20 -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, C(R¹⁵)=N-O-R¹⁶, C(R¹⁵)=N-R¹⁶, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, haloalquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₈, haloalquilcarbonila C₂-C₈, cicloalquilcarbonila C₄-C₁₀, alcóxicarbonila C₂-C₈, cicloalcoxycarbonila C₄-C₁₀, alquilaminocarbonila C₂-C₈, dialquilaminocarbonila C₃-C₁₀, cicloalquilaminocarbonila C₄-C₁₀, alcóxi C₁-C₆,
 25 haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈ e trialquilsilila C₃-C₁₀.

9. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 8, em que cada G^A é independentemente fenila ou 1,2,4-tiadiazol, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados

independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, haloalquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₈, haloalquilcarbonila C₂-C₈, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈ e trialquilsilila C₃-C₁₀.

10. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 7, em que Q é

5 CR^{6a}R^{6b}.

11. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 7, em que:

- V é NR³; e

- R¹⁴ é independentemente alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈,

ou G^A, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes

10 selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de halogênio, ciano, hidróxi, amino, nitro, -CH(=O), -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, C(R¹⁵)=N-O-R¹⁶, C(R¹⁵)=N-R¹⁶, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₈, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, haloalquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₈, haloalquilcarbonila C₂-C₈, cicloalquilcarbonila C₄-C₁₀, alcóxicarbonila C₂-C₈, cicloalcóxicarbonila C₄-C₁₀,
15 alquilaminocarbonila C₂-C₈, dialquilaminocarbonila C₃-C₁₀, cicloalquilaminocarbonila C₄-C₁₀, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, cicloalcóxi C₃-C₈ e trialquilsilila C₃-C₁₀.

12. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, que é selecionado a partir do grupo que consiste de:

20 - N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)etóxi]imino]etil]fenil]metil]carbamato de metila;

- N-[[2-cloro-5-[1-[[2-(trimetilsilil)propóxi]imino]etil]fenil]metil]carbamato de metila;

25 - 2-[4-cloro-3'-(trifluorometóxi)[1,1'-bifenil]-3-il]hidrazinocarboxilato de metila;

- N-[[2-cloro-5-[1-[[[(trimetilsilil)metóxi]imino]etil]fenil]metil]carbamato de metila;

- N-[[2-cloro-5-[1-

[[[etildimetilsilil)metóxi]imino]etil]fenil]metil]carbamato de metila;

- *N*-[[2-cloro-5-[1-(4-clorofenil)-1*H*-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila;

5 - *N*-[[2-cloro-5-[1-(4-metoxifenil)-1*H*-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila;

- *N*-[[5-[1-(4-acetilfenil)-1*H*-pirazol-3-il]-2-clorofenil]metil]carbamato de metila;

- *N*-[[2-cloro-5-[1-[3-(trimetilsilil)propil]-1*H*-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila; e

10 - *N*-[[2-cloro-5-[1-(4-metilfenil)metil]-1*H*-pirazol-3-il]fenil]metil]carbamato de metila.

13. COMPOSIÇÃO FUNGICIDA, que compreende (a) um composto de acordo com a reivindicação 1; e (b) pelo menos um outro fungicida.

15 14. COMPOSIÇÃO FUNGICIDA, que compreende (1) uma quantidade eficaz como fungicida de um composto de acordo com a reivindicação 1; e (2) pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos.

20 15. 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 de acordo com a reivindicação 1.

RESUMO**“COMPOSTO, COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS E MÉTODO DE CONTROLE DE DOENÇAS DAS PLANTAS”**

São descritos compostos da Fórmula 1 que incluem todos os seus isômeros geométricos, estereoisômeros, *N*-óxidos e sais, em que W é O ou S; V é uma união direta ou NR³; Q é CR^{6a}R^{6b}, O, NR⁷, C=N-O-R⁷ ou C(=O); Y é -C(R⁵)=N-O-(CR^{8a}R^{8b})_p-X-(CR^{9a}R^{9b})_q-SiR^{10a}R^{10b}R^{10c}; ou um anel fenila substituído conforme definido no relatório descritivo; ou Z; e R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R^{6a}, R^{6b}, R⁷, R^{8a}, R^{8b}, R^{9a}, R^{9b}, R^{10a}, R^{10b}, R^{10c}, Z, p e q 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.