

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

(21) **PI0617513-9 A2**

(22) Data de Depósito: 16/10/2006
(43) Data da Publicação: 26/07/2011
(RPI 2116)



(51) Int.Cl.:

C07C 275/54 2006.01
C07C 317/42 2006.01
C07C 323/44 2006.01
C07D 213/40 2006.01
C07D 277/32 2006.01
C07D 295/12 2006.01
C07D 295/22 2006.01
C07D 307/14 2006.01
C07D 307/52 2006.01
C07D 309/04 2006.01
C07D 317/28 2006.01
A01N 41/10 2006.01
A01N 41/12 2006.01

(54) Título: **COMPOSTOS DE BENZOILURÉIA, PROCESSO PARA A PRODUÇÃO E USO DOS MESMOS E MÉTODO PARA CONTROLAR PESTES**

(30) Prioridade Unionista: 20/10/2005 JP 2005-305418, 31/03/2006 JP 2006-097942, 13/07/2006 JP 2006-192557, 13/07/2006 JP 2006-192557, 13/07/2006 JP 2006-192557, 20/10/2005 JP 2005-305418, 31/03/2006 JP 2006-097942

(73) Titular(es): Sumitomo Chemical Company, Limited

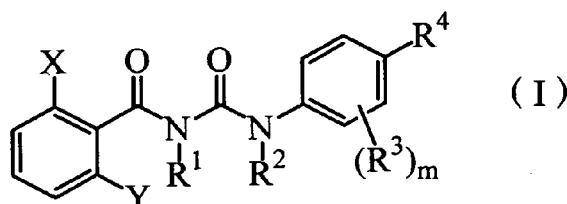
(72) Inventor(es): Masato Konobe, Norihisa Sakamoto, Shigeyuki Itoh, Tomohiro Araki, Yoshitomo Tohyama

(74) Procurador(es): Dannemann, Siemsen, Bigler & Ipanema Moreira

(86) Pedido Internacional: PCT JP2006320984 de 16/10/2006

(87) Publicação Internacional: WO 2007/046513 de 26/04/2007

(57) Resumo: COMPOSTOS DE BENZOILUREIA, PROCESSO PARA A PRODUÇÃO E USO DOS MESMOS E MÉTODO PARA CONTROLAR PESTES presente invenção refere-se a um composto de benzoilureia representado pela fórmula (1): em que, X e Y representa um átomo de flúor ou um átomo de cloro, R¹ representa um grupo alquila inferior ou similar, R² representa um grupo alquila inferior, R³ representa um átomo de halogênio ou similar, R⁴ representa um grupo alquiltio opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, ou um sal destes, e uso deste para controlar pestes e similares.



Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**COMPOSTOS DE BENZOILUREIA, PROCESSO PARA A PRODUÇÃO E USO DOS MESMOS E MÉTODO PARA CONTROLAR PESTES**".

Campo Técnico

5 A presente invenção refere-se a um composto de benzoilureia e uso deste para controlar peste.

Técnica Antecedente

EP 0263438A2, EP 0165903A2, US 4.468.405, US 4.170.657, US 4.234.600, US 2005-0159599A1 e outros descrevem compostos de benzoilureia e derivados destes tendo uma atividade pesticida.

Descrição da Invenção

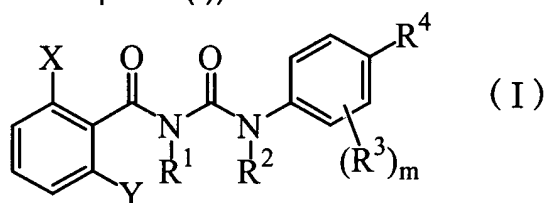
Entretanto, algumas vezes estes compostos podem não mostrar necessariamente uma suficiente eficácia no controle de pestes.

Os problemas da presente invenção são fornecer um composto tendo uma excelente eficácia no controle de pestes.

Como um resultado de estudos intensivos para solucionar o problema acima mencionado, os presentes inventores descobriram que o composto de benzoilureia representado pela seguinte fórmula (I) tem uma excelente eficácia no controle de pestes, e completou a presente invenção.

20 Isto é, a presente invenção fornece:

Um composto de benzoilureia representado pela fórmula (I) (a seguir, referido como composto (I))



em que, X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou átomo de cloro, respectivamente,

25 R¹ representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi

- inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoíla, um grupo alcanoíla inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, grupo formila, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo alcanoilóxi inferior alquila inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4 e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio, R^2 representa um grupo alquila inferior,
- R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, R^4 representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, e m representa um número inteiro de 0 a 4; ou um sal destes.
- O composto de acordo com o acima mencionado, em que X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

- R^1 representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoíla, um grupo alcanoíla inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 ou 2, e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,
- R^2 representa um grupo alquila inferior,
- R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,
- R^4 representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2,

m representa um número inteiro de 0 a 2.

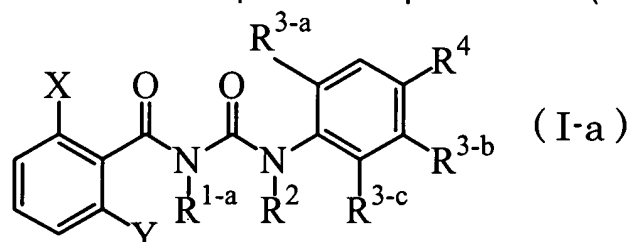
- O composto de acordo com o acima mencionado ou, em que R^1 representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior, um grupo aril alquilocarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanoila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo arilsulfonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 ou 2, e A representa um grupo alcóxi inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,
- R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior,
- R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio.

O composto de acordo com qualquer um dos acima mencionados a, em que n representa um número inteiro de 1 ou 2.

O composto de acordo com qualquer um dos acima mencionados a, em que R^4 representa um grupo alcóxi inferior.

- O composto de acordo com qualquer um dos acima mencionados a, em que R^1 representa um grupo alquila inferior substituído com um ou mais átomos de halogênio.

um composto de benzoilureia representado pela fórmula (I-a)



em que, X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou átomo de cloro, respectivamente,

R^{1-a} representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila inferior,

5 R^2 representa um grupo alquila inferior, e

(1) quando R^{3-a} e R^{3-b} representam um átomo de halogênio, R^{3-c} representa um átomo de hidrogênio, ou

(2) quando R^{3-a} e R^{3-c} representam um átomo de halogênio, R^{3-b} representa um átomo de hidrogênio, ou

10 (3) quando R^{3-a} representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior, R^{3-b} e R^{3-c} representam um átomo hidrogênio, e

R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

O composto de acordo com o acima mencionado, em que (1) quando R^{3-a} e R^{3-b} representam um átomo de halogênio, R^{3-c} representa um

20 átomo de hidrogênio, ou

(2) quando R^{3-a} e R^{3-c} representam um átomo de halogênio, R^{3-b} representa um átomo de hidrogênio, e

R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio.

25 O composto de acordo com o acima mencionado, em que R^{3-a} representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior,

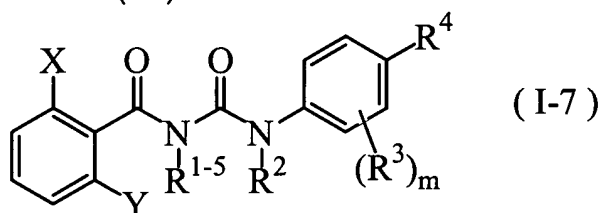
R^{3-b} e R^{3-c} representam um átomo hidrogênio,

R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um

ou mais átomos de halogênio.

O composto de acordo com qualquer um dos acima mencionados a, em que R^3 representa um grupo alquila inferior substituído com um átomo de halogênio.

- 5 Um processo para produzir um composto representado pela fórmula (I-7)



em que, X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

- 10 R^{1-5} representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alquilo-
- 15 xocarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanóila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, grupo formila, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxycarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo alcanóilóxi inferior alquila inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4, e A
- 20
- 25

representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,

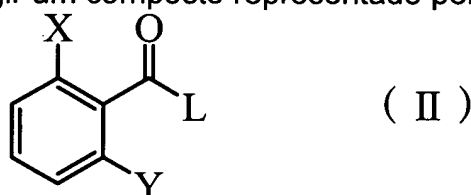
R^2 representa um grupo alquila inferior,

- 5 R^3 representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

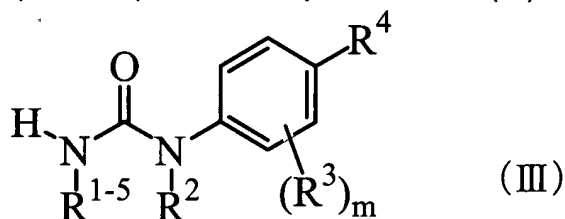
R^4 representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior
10 or opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, e

m representa um número inteiro de 0 a 4,

- 15 que compreende reagir um composto representado pela fórmula (II)



em que X e Y são como acima definido, e L representa um átomo de halogênio, com um composto representado pela fórmula (III)



em que cada símbolo é como definido acima, em um solvente orgânico na presença de uma base orgânica ou um carbonato de metal, e isolar.

- 20 [12] O processo de acordo com o acima mencionado, em que R^{1-5} representa um grupo alquila inferior,

R^3 representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila inferior,

- R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de
25 halogênio, e n representa um número inteiro de 0, e

m representa um número inteiro de 1.

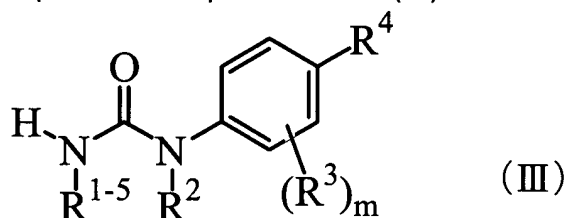
[13] Um pesticida compreendendo o composto ou um sal destes de acordo com qualquer um dos acima mencionados a como um ingrediente ativo.

[14] Uso do composto ou um sal destes de acordo com qualquer um dos acima mencionados a para controlar peste.

[10] Uso do composto de acordo com qualquer um dos acima mencionados a para fabricar um pesticida para controlar pestes.

[16] Um método para controlar pestes que compreende aplicar o composto ou um sal destes de acordo com qualquer um dos acima mencionados a à pestes diretamente ou ao habitat de pestes.

[17] Um composto representado pela fórmula (III)



em que, R^{1-5} representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alcanoilóxi inferior alquila inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanóila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, grupo formila, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais de átomo de halogênio, um grupo aril sulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior,

- um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4, e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um
- 5 grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,
- R^2 representa um grupo alquila inferior,
- R^3 representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,
- 10 R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de
- 15 halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, e m representa um número inteiro de 0 a 4.

O composto de acordo com, em que R^{1-5} representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou

20 mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo N,N-di(inferior

25 alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por -

30 $(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4, e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo

de halogênio.

Exemplos adequados pertinentes a uma variedade de definições e exemplos incluídos no escopo da presente invenção usados nas descrições acima descritas e abaixo descritas da presente especificação serão descritos em detalhes abaixo.

O termo "inferior" indica um grupo tendo 6 ou menos átomos de carbono a menos que de outro modo mencionado aqui, e preferivelmente, pode ser um grupo tendo 4 ou menos átomos de carbono.

Um exemplo adequado do "um ou mais" inclui 1 a 6, preferivelmente 1 a 4.

Exemplos adequados do "grupo alquila inferior" e "alquila inferior" incluem um grupo C1-C6 alquila de cadeia linear ou ramificado, por exemplo, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, n-pentila, sec-pentila, isopentila, neopentila, n-hexila, isoexila e similares são exemplificados.

A "cicloalquila inferior" refere-se à cicloalquila, e indica um grupo tendo 6 ou menos átomos de carbono que constitui o anel.

Exemplos adequados do "grupo cicloalquila inferior" e "cicloalquila inferior" incluem um grupo C3-C6 alquila cíclico, por exemplo, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, cicloexila e similares são exemplificados.

Exemplos adequados do "grupo alquenila inferior" incluem um grupo C2-C6 alquenila de cadeia linear ou ramificado, por exemplo, vinila, alila, isopropenila, isobutenila, 1-metilalila, 2-pentenila, 2-hexenila e similares são exemplificados.

Exemplos adequados do "grupo alquinila inferior" incluem um grupo C2-C6 alquinila, por exemplo, etinila, 2-propinila, 1-propinila, 2-butinila, 3-butinila, 3-pentinila, 3-hexinila e similares são exemplificados.

Exemplos adequados do "grupo arila" e "arila" incluem um grupo C6-C14 hidrocarboneto aromático tal como fenila opcionalmente substituída com alquila inferior (por exemplo, fenila, mesitila, xilila, tolila e similares), naftila, antrila, indanila e similares, preferivelmente fenila e naftila, e estes "grupo arila" e "arila" podem ter um substituinte adequado tal como um grupo

alquila inferior, um halogênio, um grupo arila e similares.

Como o halogênio, flúor, cloro, bromo e iodo são exemplificados.

Exemplos adequados do "grupo alcóxi inferior" e "alcóxi inferior" incluem um grupo C1-C6 alcóxi ramificado ou de cadeia linear, por exemplo, metóxi, etóxi, propóxi, isopropóxi, butóxi, isobutóxi, terc-butóxi, pentilóxi, 5 terc-pentilóxi, neo-pentilóxi, hexilóxi, isoexilóxi e similares são exemplificados, e preferivelmente metóxi, etóxi, propóxi, butóxi, pentilóxi, hexilóxi, isoe-xilóxi são exemplificados.

Exemplos adequados do "grupo alcanoíla inferior" incluem uns 10 grupos C2-C6 alcanoíla ramificados ou de cadeia linear, por exemplo, acetila, 2-metil acetila, 2,2-dimetilacetila, propionila, butilila, isobutilila, pentanoíla, 2,2-dimetilpropionila, hexanoíla e similares são exemplificados.

Em R¹, exemplos do "grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio" incluem metila, etila, 2-bromoetila, 2,2,2-trifluoroetila, propila, 3,3,3-trifluoropropila, isopropila, butila, 15 isobutila, sec-butila, terc-butila, 4,4,4-trifluorobutila, pentila, isopentila, neopentila, 5,5,5-trifluoropentila, hexila e 6,6,6-trifluorohexila.

Exemplos do "grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio" incluem vinila, 1-propenila, 2-propenila, isopropenila, 2-butenila, isobutenila e 3,3-dicloro-2-propenila. 20

Exemplos do "grupo alquinila inferior" incluem etinila, 2-propinila e 1-propinila.

Exemplos do "grupo arila" incluem fenila, 1-naftila, 2-naftila e bifenilila.

Exemplos do "grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais dos grupos alcóxi inferior" incluem benzila, fenetila, 2-metoxibenzila, 3-metoxibenzila e 4-metoxibenzila. 25

Exemplos do "grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio" incluem metoximetila, etoximetila, 1-propoximetila, 2-metoxietila, 2-etoxietila, 3-metoxipropila, 3-etoxipropila e 2-cloroetoximetila. 30

Exemplos do "grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substi-

tuído com um ou mais átomos de halogênio" incluem fenoximetila, 2-fenoxietila e 4-clorofenoximetila.

Exemplos do "grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior" incluem dimetilaminometila, 2-(dimetilamino)etila, dietilaminometila e 2-
5 (dietilamino)etila.

Exemplos do "grupo alquiltio inferior alquila inferior" incluem metiltiometila, etiltiometila, 2-(metiltio)etila e 2-(etiltio)etila.

Exemplos do "grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior" incluem metilsulfinilmetila, etilsulfinilmetila, 2-(metilsulfinil)etila e 2-(etilsulfinil)etila.

10 Exemplos do "grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior" incluem metilsulfonilmetila, etilsulfonilmetila, 2-(metilsulfonil)etila e 2-(etilsulfonil)etila.

Exemplos do "grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior" incluem (2-metoxietóxi)metila.

15 Exemplos do "grupo alcóxicarbonila inferior" incluem metoxycarbonila, etoxycarbonila, propiloxycarbonila, isopropiloxycarbonila, butoxycarbonila e terc-butoxycarbonila.

Exemplos do "grupo aril alquiloxy carbonila inferior" incluem benziloxycarbonila.

20 Exemplos do "grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila" incluem dimetilcarbamoila e dietilcarbamoila.

Exemplos do "grupo alcanoila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio" incluem acetila, propionila, trifluoroacetila e cloroacetila.

25 Exemplos do "grupo sulfonilalquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio" incluem metano sulfonila, etano sulfonila e trifluorometano sulfonila.

Exemplos do "grupo aril sulfonila" incluem benzenossulfonila e toluenossulfonila.

30 Exemplos do "grupo arilóxi carbonila" incluem fenoxycarbonila.

Exemplos adequados do "grupo cicloalquila inferior" e "cicloalquila inferior" incluem um grupo C3-C6 alquila cíclico, por exemplo, ciclopro-

pila, ciclobutila, ciclopentila, cicloexila e similares são exemplificados.

Exemplos do "grupo cicloalquila inferior alquila inferior" incluem ciclopropilmetila, ciclopropiletila, ciclobutilmetila, ciclobutiletila, ciclopentilmetila, ciclopentiletila, cicloexilmetila, e cicloexiletila.

5 Exemplos do "grupo di(inferior alquil)amino" incluem dimetilamino, e dietilamino.

Exemplos do "grupo alcóxi inferior" incluem metóxi e etóxi.

Exemplos do "grupo alcanoilóxi inferior alquila inferior" incluem acetoximetila e acetoxietila.

10 Exemplos do "grupo aril alcóxi inferior alquila inferior" incluem benziloximetila e benziloxietila.

Exemplos do "anel heterocíclico saturado de 6 membros" incluem morfolino e 4-tetraidropiranila.

15 Exemplos do "anel heterocíclico de 5 ou 6 membros que pode ser substituído com um átomo de halogênio" em A incluem 2-furila, 3-furila, morfolino, 2-tetraidrofurila, 3-tetraidrofurila, 1,3-dioxolan-2-ila, 2-tiazolila, 4-tiazolila, 5-tiazolila, 2-clorotiazol-5-ila, 2-piridila, 3-piridila e 4-piridila.

Exemplos do "grupo di(inferior alcóxi)metila" incluem dimetoximetila.

20 Exemplos do "grupo alcóxicarbonila inferior" incluem metoxycarbonila.

Em R^2 , exemplos do "grupo alquila inferior" incluem metila e etila.

25 Em R^3 , exemplos do "átomo de halogênio" incluem flúor, cloro, bromo e iodo.

30 Exemplos do "grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio" incluem metila, clorometila, difluorometila, triclorometila, trifluorometila, etila, 2-bromoetila, 2,2,2-trifluoroetila, 1,1,2,2,2-pentafluoroetila, propila, 3,3,3-trifluoropropila, isopropila, butila, isobutyla, sec-butyla, terc-butyla, e 4,4,4-trifluorobutyla.

Em R^4 , exemplos do "grupo alcóxicarbonila inferior" incluem metoxycarbonila, etoxycarbonila, propiloxycarbonila, isopropiloxycarbonila, butoxi-

carbonila, e terc-butoxicarbonila.

Em R⁵, exemplos do "grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio" incluem metila, etila, isopropila, terc-butila, difluorometila, trifluorometila, triclorometila, diclorofluorometila, 5 clorodifluorometila, 2,2,2-trifluoroetila, 1,1,2,2-tetrafluoroetila, 1,1,2,2,2-pentafluoroetila, 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propila, 1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propila, 1,1,1,2,3,3,3-heptafluoro-2-propila, e triclorometila.

Exemplos do "grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio" incluem 2-propenila e 3,3-dicloro-2- 10 propenila.

Exemplos do "grupo alquinila inferior" incluem 2-propinila.

Exemplos do "grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio" incluem 2-trifluorometóxi- 1,1,2-trifluoroetila.

15 Além disso, deve ser observado que na presente especificação, o grupo metila pode ser referido como Me, e o grupo etila pode ser referido como Et.

Como exemplos da modalidade de composto (I), os seguintes são exemplificados:

20 Modalidade 1

Na fórmula (I),

um composto benzoilureia, em que

X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

25 R¹ representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila 30 inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um gru-

- po alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoíla, um grupo alcanoíla inferior opcionalmente substituído com
- 5 um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior, um grupo heterocíclico
- 10 saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$, em que l representa um número inteiro de 1 ou 2, e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio, R^2 representa um grupo alquila inferior,
- 15 R^3 representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, R^4 representa um grupo alcóxicarbonila inferior ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$, em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior
- 20 or opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, e m representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.
- 25 Modalidade 2
- Na fórmula (I),
- um composto benzoilureia, em que
- X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,
- 30 R^1 representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior opcional-

- mente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoíla, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo arilsulfonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$, em que l representa um número inteiro de 1 ou 2, e A representa um grupo alcoxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,
- R^2 representa um grupo alquila inferior,
- R^3 representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila inferior,
- R^4 representa um grupo alcoxicarbonila inferior ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, e
- m representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 3

- Na fórmula (I),
- um composto benzoilureia em que
- X e Y independentemente representam um átomo de flúor e um átomo de cloro, respectivamente,
- R^1 representa um átomo de hidrogênio, metila, etila, 2,2,2-trifluoroetila, 2-propenila, 2-propinila, benzila, metoximetila, 2-metoxietila, 2-fenoxietila, 2-

- (dimetilamino)etila, 2-(metiltio)etila, 2-(metilsulfinil)etila, 2-(metilsulfonil)etila, metoxicarbonila, benziloxicarbonila, dimetilcarbamoíla, acetila, metanossulfonila, benzenossulfonila, fenoxicarbonila, ciclopropila, cicloexila, ciclopropilmetila, cicloexilmetila, dimetilamino, metóxi, morfolino, 4-tetraidropiranila,
- 5 2,2-dimetoxietila, metoxicarbonilmetila, 2-tetraidrofurilmetila, 2-furilmetila, (1,3-dioxolan-2-il)metila, 2-piridilmetila, 3-piridilmetila, (2-clorotiazol-5-il)metila, 2-metoxibenzila, 3-metoxibenzila, 4-metoxibenzila, etoximetila, 2-cloroetoximetila, benziloximetila, (2-metoxietóxi)metila, ou 2-morfolinoetila, R^2 representa metila ou etila,
- 10 R^3 representa átomo de flúor, átomo de cloro, trifluorometila, ou metila, R^4 representa terc-butoxicarbonila, trifluorometiltio, trifluorometilsulfinila, trifluorometilsulfonila, difluorometiltio, triclorometiltio, metiltio, etiltio, 1,1,2,2-tetrafluoroetiltio, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfinila, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfonila, 2,2,2-trifluoroetiltio, 1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio, 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-
- 15 propiltio, 1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiltio, 2-propeniltio, 2-propenilsulfinila, 2-propenilsulfonila, 3,3-dicloro-2-propeniltio, 2-propiniltio, 2-propinilsulfinila, 2-propinilsulfonila, ou 1,1,2-trifluoro-2-trifluorometoxietiltio, e m representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.
- Modalidade 4
- 20 Na fórmula (I), um composto benzoilureia em que X e Y independentemente representam um átomo de flúor e um átomo de cloro, respectivamente, R^1 representa um átomo de hidrogênio, metila, etila, 2,2,2-trifluoroetila, 2-propenila, 2-propinila, benzila, metoximetila, 2-metoxietila, 2-(metiltio)etila, 2-
- 25 (metilsulfinil)etila, 2-(metilsulfonil)etila, metoxicarbonila, benziloxicarbonila, dimetilcarbamoíla, acetila, metanossulfonila, benzenossulfonila, ciclopropila, ciclopropilmetila, dimetilamino, metóxi, morfolino, 4-tetraidropiranila, metoxicarbonilmetila, 2-tetraidrofurilmetila, 2-furilmetila, 2-piridilmetila, 3-
- 30 piridilmetila, (2-clorotiazol-5-il)metila, 2-metoxibenzila, 3-metoxibenzila, 4-metoxibenzila, etoximetila, 2-cloroetoximetila, benziloximetila, (2-metoxietóxi)metila, ou 2-morfolinoetila,

R² representa metila ou etila,

R³ representa átomo de flúor, átomo de cloro, trifluorometila, ou metila,

R⁴ representa terc-butoxicarbonila, trifluorometiltio, trifluorometilsulfinila, trifluorometilsulfonila, difluorometiltio, triclorometiltio, metiltio, etiltio, 1,1,2,2-tetrafluoroetiltio, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfinila, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfonila, 2,2,2-trifluoroetiltio, 1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio, 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio, 1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiltio, 2-propeniltio, 2-propiniltio, ou 1,1,2-trifluoro-2-trifluorometoxietiltio, e
m representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

10 Modalidade 5

Qualquer um dos compostos representados pelos seguintes:

- 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia,
- 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1-metilureia,
- 3-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia,
- 15 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-etil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia,
- 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-(2-flúor-4-metiltiofenil)-1-metilureia,
- 3-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-1-(2-flúor-4-metiltiofenil)-1-metilureia,
- 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia,
- 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-(2-flúor-4-etiltiofenil)-1-metilureia,
- 20 3-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-1-(2-flúor-4-etiltiofenil)-1-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(metoximetil)-3-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1,3-
- 25 dimetilureia,
- 1-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-(2-flúor-4-metiltiofenil)-1,3-dimetilureia,
- 1-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-3-(2-flúor-4-metiltiofenil)-1,3-dimetilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-(2-flúor-4-etiltiofenil)-1,3-dimetilureia,
- 30 1-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-3-(2-flúor-4-etiltiofenil)-1,3-dimetilureia,
- 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometilsulfinil)fenil]-1-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometilsulfinil)fenil]-1,3-dimetilureia,

- 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(trifluorometilsulfonil)fenil]-1-metilureia,
 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometilsulfonil)fenil]-1,3-dimetilureia,
 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)fenil]-
 1,3-dimetilureia,
- 5 3-(2-cloro-6-fluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1-
 metilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetanossulfinil)fenil]-1-
 metilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetanossulfonil)fenil]-1-
- 10 metilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(2,2,2-trifluoroetiltio)fenil]-1-metilureia,
 1-[2-cloro-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoi)-1-metilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)fenil]-
 1-metilureia,
- 15 3-(2-cloro-6-fluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-
 propiltio)fenil]-1-metilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)fenil]-1-
 metilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiltio)fenil]-1-
- 20 metilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2,3-dimetil-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2,3-dimetil-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)fenil]-1-
 metilureia,
 1-[2-cloro-4-(difluorometiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoi)-1-metilureia,
- 25 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[4-(difluorometiltio)-2-metilfenil]-1-metilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-metil-1-[2-metil-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(t-butoxicarbonil)fenil]-1-metilureia,
 1-(2-cloro-6-fluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1,3-
 dimetilureia,
- 30 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetanossulfinil)fenil]-1,3-
 dimetilureia,
 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetanossulfonil)fenil]-1,3-

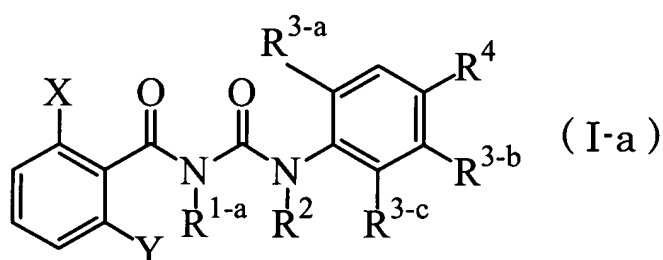
- dimetilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-etil-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-1,3-dimetil-3-[2-metil-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(t-butoxicarbonil)fenil]-1,3-dimetilureia,
- 5 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(2,2,2-trifluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
- 1-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
- 10 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2,3-dimetil-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2,3-dimetil-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
- 15 1-[2-cloro-4-(difluorometiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1,3-dimetilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[4-(difluorometiltio)-2-metilfenil]-1,3-dimetilureia,
- 1-acetil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metoxycarbonil-3-metilureia,
- 20 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metanossulfonil-3-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-1-(N,N-dimetilcarbamoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-1-etil-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia,
- 25 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[4-(difluorometiltio)-2-fluorofenil]-1-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[4-(difluorometiltio)-2-fluorofenil]-1,3-dimetilureia,
- 1-alil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-propargilureia,
- 30 1-benzil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(2-fenoxietil)ureia,

- 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(2-tetraidrofurilmetil)ureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(2-furilmetil)-3-metilureia,
- 5 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(2-metoxietil)-3-metilureia,
- 1-ciclopropil-1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)ureia,
- 10 1-ciclopropilmetil-1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-3-(2-metiltioetil)ureia,
- 15 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-3-(2-metilsulfiniletil)ureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-3-(2-metilsulfoniletil)ureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(2-piridilmetil)ureia,
- 20 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(3-piridilmetil)ureia,
- 1-[(2-clorotiazol-5-il)metil]-1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia,
- 25 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-morfolinourea,
- 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(2-morfolinoetil)ureia,
- 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-
- 30 metoxicarbonilmetil-3-metilureia,
- 1-[4-(t-butoxicarbonil)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoi)-1-metilureia,
- 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(2-propeniltio)fenil]-1-metilureia,

- 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(2-propiniltio)fenil]-1-metilureia,
 1-[3,5-dicloro-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoi)-1-metilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-metil-1-[4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]ureia,
 5 3-(2,6-diclorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia,
 1-(2,6-diclorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
 1-benziloxicarbonil-1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia,
 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-
 10 fenilsulfonilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2,5-difluoro-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia,
 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2,5-difluoro-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2,6-difluoro-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia,
 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2,6-difluoro-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
 15 1-[2-cloro-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoi)-1,3-dimetilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-metil-1-[2-metil-4-(pentafluoroetiltio)fenil]ureia,
 1-(2,6-difluorobenzoi)-1,3-dimetil-3-[2-metil-4-(pentafluoroetiltio)fenil]ureia,
 1-[2-cloro-4-(pentafluoroetiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoi)-1-metilureia,
 1-[2-cloro-4-(pentafluoroetiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoi)-1,3-dimetilureia,
 20 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[2-flúor-4-(1,1,2-trifluoro-2-trifluorometoxietiltio)fenil]-1-metilureia,
 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(1,1,2-trifluoro-2-trifluorometoxietiltio)fenil]-1,3-dimetilureia,
 3-(2,6-difluorobenzoi)-1-[4-(difluorometiltio)-2,3-dimetilfenil]-1-metilureia,
 25 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[4-(difluorometiltio)-2,3-dimetilfenil]-1,3-dimetilureia,
 1-dimetilamino-1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia, ou
 1-(2,6-difluorobenzoi)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metóxi-3-metilureia.

30 Modalidade 6

Um composto benzoiureia (I - a) representado pela fórmula (I - a)



em que, X e Y independentemente representam átomo de flúor ou átomo de cloro, respectivamente,

R^{1-a} representa átomo de hidrogênio ou um grupo alquila inferior,

R^2 representa um grupo alquila inferior, e

5 (1) quando R^{3-a} e R^{3-b} representam um átomo de halogênio, R^{3-c} representa um átomo de hidrogênio,

(2) quando R^{3-a} e R^{3-c} representam um átomo de halogênio, R^{3-b} representa um átomo de hidrogênio, ou,

(3) quando R^{3-a} representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior, R^{3-b} e R^{3-c} representam um átomo hidrogênio, e

R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$, em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 7

Um composto benzoilureia em que na fórmula (I - a), X e Y independentemente representam átomo de flúor ou átomo de cloro, respectivamente,

R^{1-a} representa um átomo de hidrogênio, ou um grupo alquila inferior,

R^2 representa um grupo alquila inferior, e

(1) quando R^{3-a} e R^{3-b} representam um átomo de halogênio, R^{3-c} representa um átomo de hidrogênio,

25 (2) quando R^{3-a} e R^{3-c} representam um átomo de halogênio, R^{3-b} representa um átomo de hidrogênio, e

R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de

halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 8

Um composto benzoilureia em que na fórmula (I - a), X e Y independentemente representam átomo de flúor ou átomo de cloro, respectivamente,

R^{1-a} representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila inferior,

R^2 representa um grupo alquila inferior,

R^{3-a} representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior,

R^{3-b} e R^{3-c} representam um átomo hidrogênio, e

R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 9

Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

R^1 representa um átomo de hidrogênio, um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquinila, um grupo C6-C14 arila, um grupo C7-C11 aralquila, um grupo C2-C6 alcoxialquila, um grupo C7-C14 ariloxialquila, um grupo C3-C6 N,N-di(alquil)aminoalquila, um grupo C2-C6 alquiltioalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfinilalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfonilalquila, um grupo C3-C9 alcoxialcoxialquila, um grupo C2-C6 alcoxicarbonila, um grupo C8-C12 aralquioxycarbonila, um grupo N,N-di(C1-C6 alquil)carbamoila, um grupo C2-C6 alquilcarbonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo formila, um grupo C1-C5 alquilsulfonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C6-C10 arilsulfonila,

R^2 representa um grupo C1-C2 alquila,

R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

R^4 representa um grupo C2-C6 alcoxicarbonila ou um grupo representado

por $S(O)_nR^5$,

R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquinila, ou
 5 um grupo C2-C4 alcoxialquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

m representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 4, e

n representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 10

10 Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

R^1 representa um átomo de hidrogênio ou um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C2-C6 alcoxialquila,

15 R^2 representa um grupo C1-C2 alquila,

R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

R^4 representa um grupo C2-C6 alcóxicarbonila ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$,

20 R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquinila, ou um grupo C2-C4 alcoxialquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

25 m representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 4, e

n representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 11

Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

30 R^1 representa um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C2-C6 alcoxialquila,

R^2 representa um grupo C1-C2 alquila,

R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

R^4 representa um grupo C2-C6 alcóxicarbonila ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$,

- 5 R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquinila, ou um grupo C2-C4 alcóxiálquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

- 10 m representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 4, e
n representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 12

Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

- 15 R^1 representa um átomo de hidrogênio, um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquinila, um grupo C6-C14 arila, um grupo C7-C11 arálquila, um grupo C2-C6 alcóxiálquila, um grupo C7-C14 arilalcóxiálquila, um grupo C3-C6 N,N-di(alquil)aminoalquila, um grupo C2-C6 alquiltioalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfinilalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfonilalquila, um grupo C3-C9 alcóxiálcoxialquila, um grupo C2-C6 alcóxicarbonila, grupo C8-12 aralquiloxicarbonila, ou grupo N,N-di(C1-C6 alquil)carbamoila, um grupo C2-C6 alquilcarbonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de
- 20 halogênio, um grupo formila, um grupo C1-C5 alquilsulfonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C6 - C10 arilsulfonila,

R^2 representa um grupo C1-C2 alquila,

R^3 representa um átomo de halogênio,

- 30 R^4 representa um grupo C2-C6 alcóxicarbonila ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$,

R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou

mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquinila, ou um grupo C2-C4 alcoxialquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

- 5 m representa um número inteiro de 1 ou 2, e no caso onde m representa 2, R^3 pode ser o mesmo ou diferente, e
n representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 13

- Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,
- 10 R^1 representa um átomo de hidrogênio, um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquinila, um grupo C6-C14 arila, um grupo C7-C11 aralquila,
- 15 la, um grupo C2-C6 alcoxialquila, um grupo C7-C14 ariloxialquila, um grupo C3-C6 N,N-di(alquil)aminoalquila, um grupo C2-C6 alquiltioalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfinilalquila, grupo C2-C6 alquilsulfonilalquila, um grupo C3-C9 alcoxialcoxialquila, um grupo C2-C6 alcoxicarbonila, um grupo C8-C12 aralquiloxicarbonila, um grupo N,N-di(C1-C6 alquil)carbamoila, um grupo C2-C6
- 20 alquilcarbonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo formila, um grupo C1-C5 alquilsulfonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C6-C10 arilsulfonila,
- R^2 representa um grupo C1-C2 alquila,
- 25 R^3 representa um átomo de halogênio,
- R^4 representa um grupo C2-C6 alcoxicarbonila ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$,
- R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquinila, ou
- 30 um grupo C2-C4 alcoxialquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

m representa um número inteiro de 1, e

n representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 14

- Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,
- 5 R^1 representa um átomo de hidrogênio, um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C2-C6 alcoxialquila,
- R^2 representa um grupo C1-C2 alquila,
- 10 R^3 representa um átomo de halogênio,
- R^4 representa um grupo C2-C6 alcóxicarbonila ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$,
- R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquinila, ou
- 15 um grupo C2-C4 alcoxialquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,
- m representa um número inteiro de 1, e
- n representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

20 Modalidade 15

- Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,
- R^1 representa um átomo de hidrogênio, um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6
- 25 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquinila, um grupo C6-C14 arila, um grupo C7-C11 aralquila, um grupo C2-C6 alcoxialquila, um grupo a C7-C14 ariloxialquila, um grupo C3-C6 N,N-di(alquil)aminoalquila, um grupo C2-C6 alquiltioalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfinilalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfonilalquila, um
- 30 grupo C3-C9 alcoxialcoxialquila, um grupo C2-C6 alcóxicarbonila, um grupo C8-C12 aralquioxycarbonila, um grupo N,N-di(C1-C6 alquil)carbamoila, um grupo C2-C6 alquilcarbonila opcionalmente substituído com um ou mais á-

tomos de halogênio, um grupo formila, um grupo C1-C5 alquilsulfonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C6-C10 arilsulfonila,

R^2 representa um grupo C1-C2 alquila,

- 5 R^3 representa um átomo de halogênio, ou um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$,

- R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquinila, ou um grupo C2-C4 alcoxialquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

m representa um número inteiro de 0 a 4, e

n representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

15 Modalidade 16

Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

- R^1 representa um átomo de hidrogênio, um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquinila, um grupo C6-C14 arila, um grupo C7-C11 aralquila, um grupo C2-C6 alcoxialquila, um grupo C7-C14 ariloxialquila, um grupo C3-C6 N,N-di(alquil)aminoalquila, um grupo C2-C6 alquiltioalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfinilalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfonilalquila, um grupo C3-C9 alcoxialcoxialquila, um grupo C2-C6 alcoxycarbonila, um grupo C8-C12 aralquilocarbonila, um grupo N,N-di(C1-C6 alquil)carbamoila, um grupo C2-C6 alquilcarbonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo formila, um grupo C1-C5 alquilsulfonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C6-C10 arilsulfonila,

30 C10 arilsulfonila,

R^2 representa um grupo C1-C2 alquila,

R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo C1-C4 alquila opcional-

mente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$,

R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

5 m representa um número inteiro de 0 a 4, e

n representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 17

Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

10 R^1 representa um átomo de hidrogênio ou um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquinila, um grupo C6-C14 arila, um grupo C7-C11 aralquila, um grupo C2-C6 alcoxialquila, um grupo C7-C14 ariloxialquila, um

15 grupo C3-C6 N,N-di(alquil)aminoalquila, um grupo C2-C6 alquiltioalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfonilalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfonilalquila, um grupo C3-C9 alcoxialcoxialquila, um grupo C2-C6 alcoxicarbonila, um grupo C8-C12 aralquilocarbonila, um grupo N,N-di(C1-C6 alquil)carbamoila, um grupo C2-C6 alquilcarbonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo formila, um grupo C1-C5 alquilsulfonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C6-C10 arilsulfonila,

R^2 representa um grupo C1-C2 alquila,

R^3 representa um átomo de halogênio,

25 R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$,

R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C4 alquinila, ou um grupo C2-C4 alcoxialquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

30

m representa um número inteiro de 1, e

n representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 18

um composto de benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

R¹ representa um átomo de hidrogênio, um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C6 alquinila, um grupo C6-C14 arila, um grupo C7-C11 aralquila, um grupo C2-C6 alcoxialquila, um grupo C7-C14 ariloxialquila, um grupo C3-C6 N,N-di(alquil)aminoalquila, um grupo C2-C6 alquiltioalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfinilalquila, um grupo C2-C6 alquilsulfonilalquila, um grupo C3-C9 alcoxialcoxialquila, um grupo C2-C6 alcoxicarbonila, um grupo C8-C12 aralquilocarbonila, um grupo N,N-di(C1-C6 alquil)carbamoila, um grupo C2-C6 alquilcarbonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo formila, um grupo C1-C5 alquilsulfonila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C6-C10 arilsulfonila,

R² representa um grupo C1-C2 alquila,

R³ representa um átomo de halogênio,

R⁴ representa um grupo representado por S(O)_nR⁵,

R⁵ representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

m representa um número inteiro de 1, e

n representa qualquer um de um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 19

Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

R¹ representa um átomo de hidrogênio, um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C2-C6 alcoxialquila,

R² representa um grupo C1-C2 alquila,

R³ representa um átomo de halogênio ou um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$,

R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

m representa qualquer um dos números inteiros de 0 a 4, e

5 n representa qualquer um dos números inteiros de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 20

Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

10 R^1 representa um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio ou um grupo C2-C6 alcoxialquila,

R^2 representa um grupo C1-C2 alquila,

R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$,

15 R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

m representa qualquer um dos números inteiros de 0 a 4, e

n representa qualquer um dos números inteiros de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 21

20 Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y representam um átomo de flúor, respectivamente,

R^1 representa um grupo C1-C6 alquila,

R^2 representa um grupo C1-C2 alquila,

R^3 representa um átomo de halogênio,

25 R^4 representa um grupo representado por SR^5 ,

R^5 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e

m representa qualquer um dos números inteiros de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 22

30 Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

R¹ representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior, um grupo arilóxi alquila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanoila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo formila, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$, em que l representa um número inteiro de 1 a 4 e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio.

R^2 representa um grupo aquila inferior,

R³ representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

R^4 representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, e

m representa um número inteiro de 0 a 4, ou um sal destes.

Modalidade 23

Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

R¹ representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, a N,N-di(inferior alquil)amino grupo alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanoila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por -(CH₂)_l-A em que l representa um número inteiro de 1 ou 2 e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcóxicarbonila inferior ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,

R² representa um grupo alquila inferior,

R³ representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

R⁴ representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo representado por S(O)_nR⁵ em que R⁵ representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo

po alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, e

m representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

5 Modalidade 24

Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,

R¹ representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoíla, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo arilsulfonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 ou 2, e A representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,

R² representa um grupo alquila inferior,

R³ representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila inferior,

R⁴ representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R⁵ representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente

substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, e

m representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

Modalidade 25

- 5 Um composto benzoilureia em que na fórmula (I), X e Y independentemente representam um átomo de flúor e um átomo de cloro, respectivamente,

R¹ representa um átomo de hidrogênio, metila, etila, 2,2,2-trifluoroetila, 2-propenila, 2-propinila, benzila, metoximetila, 2-metoxietila, 2-fenoxietila, 2-(dimetilamino)etila, 2-(metiltio)etila, 2-(metilsulfinil)etila, 2-(metilsulfonil)etila, metoxicarbonila, benziloxicarbonila, dimetilcarbamoila, acetila, metanossulfonila, benzenossulfonila, fenoxicarbonila, ciclopropila, cicloexila, ciclopropilmetila, cicloexilmetila, dimetilamino, metóxi, morfolino, 2,2-dimetoxietila, metoxicarbonilmetila, 2-tetraidrofurilmetila, 2-furilmetila, (1,3-dioxolan-2-il)metila, 2-piridilmetila, 3-piridilmetila, (2-clorotiazol-5-il)metila, 2-metoxibenzila, 3-metoxibenzila, 4-metoxibenzila, etoximetila, 2-cloroetoximetila, benziloximetila, trifluorometila, ou 2-morfolinoetila,

R² representa metila ou etila,

R³ representa um átomo de flúor, um átomo de cloro ou metila,

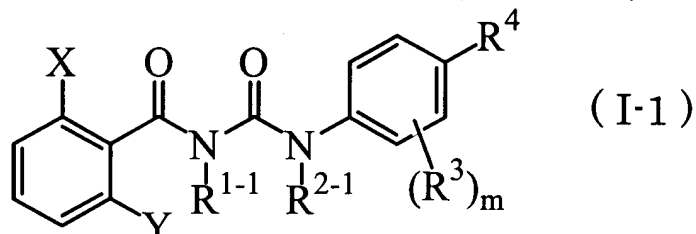
- 20 R⁴ representa terc-butoxicarbonila, trifluorometiltio, trifluorometilsulfinila, trifluorometilsulfonila, difluorometiltio, metiltio, etiltio, 1,1,2,2-tetrafluoroetiltio, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfinila, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfonila, 2,2,2-trifluoroetiltio, 1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio, 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio, 1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiltio, 2-propeniltio, 2-propenilsulfinila, 2-propenilsulfonila, 3,3-dicloro-2-propeniltio, 2-propiniltio, 2-propinilsulfinila, 2-propinilsulfonila, ou 1,1,2-trifluoro-2-trifluorometoxietiltio, e
- 25 m representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

A seguir, um método para produzir o composto (I) será explicado.

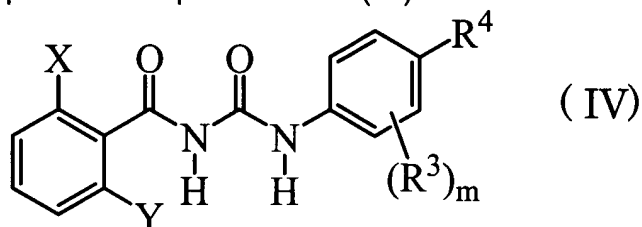
- 30 O composto (I) pode ser produzido de acordo com o seguinte (Processo de Produção 1) a (Processo de Produção 8).
(Processo de Produção 1)

Entre composto (I), um método para produzir um composto de benzoilureia representado pela fórmula (I-1) em que R^1 e R^2 são o mesmo grupo alquila inferior.

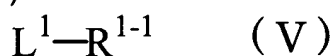
Entre composto (I), o composto representado pela fórmula (I-1):



- 5 em que, X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou um átomo de cloro, respectivamente,
 R^{1-1} e R^{2-1} representam o mesmo grupo alquila inferior,
 R^3 representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,
 10 R^4 representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, e
 15 m representa um número inteiro de 0 a 4, pode ser produzido reagindo-se um composto representado pela fórmula (IV):



- em que, X, Y, R^3 , R^4 e m são como definidos acima, com um composto representado pela fórmula (V):



em que, R^{1-1} é como definido acima, e L^1 representa um átomo de halogênio, grupo metanossulfonilóxi, grupo benzenossulfonilóxi, grupo toluenossulfonilóxi, grupo metoxissulfonilóxi, ou grupo etoxissulfonilóxi.

A reação é geralmente realizada em um solvente sob a presença de uma base.

Exemplos do solvente usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água, e uma mistura destes.

Exemplos da base usada para a reação incluem hidróxidos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio e similares, hidretos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidreto de sódio, hidreto de potássio, hidreto de cálcio e similares, carbonatos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como carbonato de sódio, carbonato de potássio e similares, alcoolatos de metal de álcali tais como etilato de sódio, metilato de sódio e similares, reagentes de lítio orgânico tais como n-butil lítio, diisopropilamida de lítio e similares, e bases orgânicas tais como trietilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno e similares.

Quando um reagente que é líquido sob a condição de reação é usado, a quantidade em excesso de cada reagente pode ser usada em termos da quantidade dos reagentes usados para a reação, porém geralmente, o composto representado pela fórmula (V) é usado com uma taxa de 2 a 4 moles e a base é usada com uma taxa de 2 a 4 moles com relação a um mol do composto representado pela fórmula (IV).

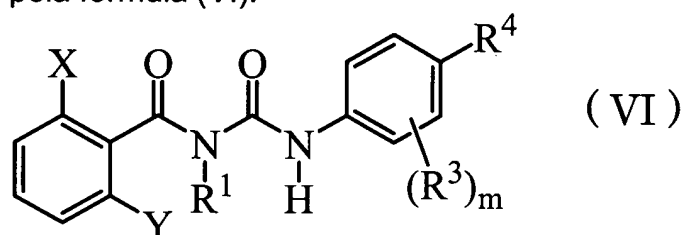
A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 150°C, e o tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 100 horas.

Após o término da reação, o composto representado pela fórmu-

la (I-1) pode ser isolado submetendo-se a mistura reacional às operações pós-tratamento tal como adicionando a mistura reacional à água, extraíndo com um solvente orgânico, secando a camada orgânica, concentrando o extrato e similares. O composto isolado representado pela fórmula (I-1) pode ser também purificado por recristalização, cromatografia de coluna e similares.

(Processo de Produção 2)

Composto (I) pode ser produzido reagindo-se um composto representado pela fórmula (VI):



em que, X, Y, R^3 , R^4 e m são como definidos acima,
 R^1 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanoíla inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo formila, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo alcanoióxi inferior

alquila inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4, e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcoxicarbonila inferior ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros, com um composto representado pela fórmula (VII):



em que, R^2 representa um grupo alquila inferior, e L^2 representa um átomo de halogênio, grupo metanossulfonilóxi, grupo benzenossulfonilóxi, grupo toluenossulfonilóxi, grupo metoxissulfonilóxi, ou grupo etoxissulfonilóxi.

A reação é geralmente realizada em um solvente sob a presença de uma base.

Exemplos do solvente usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água e uma mistura destes.

Exemplos da base usada para a reação incluem hidróxidos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio e similares, hidretos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidreto de sódio, hidreto de potássio, hidreto de cálcio e similares, carbonatos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como carbonato de sódio, carbonato de potássio e similares, alcoolatos de metal de álcali tais como etilato de sódio, metilato de sódio e similares, reagente de lítio orgânico tal como n-butil lítio, diisopropilamida de lítio e similares, bases orgânicas tais como trietilamina, piridina, 1,8-

diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno e similares.

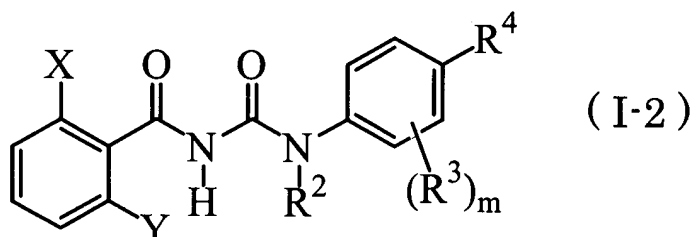
Quando um reagente que é líquido sob a condição de reação é usado, a quantidade em excesso de cada reagente pode ser usada em termos da quantidade dos reagentes usados para a reação, porém geralmente, o composto representado pela fórmula (VII) é usado com uma taxa de 1 a 3 moles e a base é usada com uma taxa de 1 a 3 moles com relação a um mol do composto representado pela fórmula (VI).

A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 150°C, e o tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 100 horas.

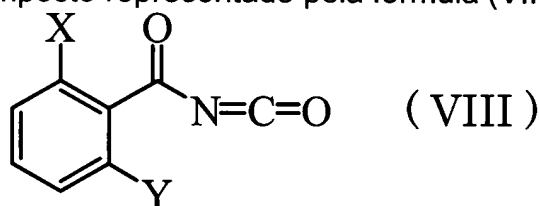
Após o término da reação, o composto (I) pode ser isolado submetendo-se a mistura reacional às operações pós-tratamento tal como adicionando a mistura reacional à água, extraíndo com um solvente orgânico, secando a camada orgânica, concentrando o extrato e similares. O composto isolado (I) pode ser também purificado por recristalização, cromatografia de coluna e similares.

(Processo de Produção 3)

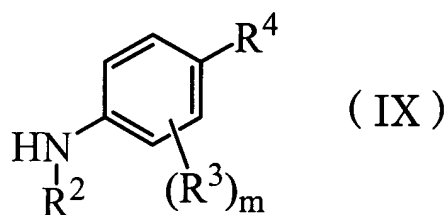
Entre o composto (I), um composto representado pela fórmula (I-2):



em que, X, Y, R², R³, R⁴ e m são como definidos acima, pode ser produzido reagindo-se um composto representado pela fórmula (VIII):



em que, X e Y são como definidos acima, com um composto representado pela fórmula (IX):



em que, R^2 , R^3 , R^4 e m são como definidos acima.

A reação é geralmente realizada em um solvente.

Exemplos do solvente usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água e uma mistura destes.

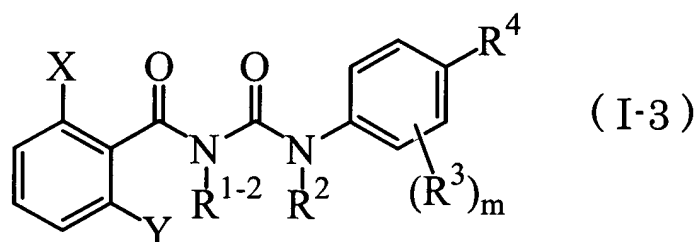
A quantidade do composto representado pela fórmula (IX) usada para a reação é geralmente em uma taxa de 0,5 a 2 moles com relação a um mol de um composto representado pela fórmula (VIII).

A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 150°C , e o tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 100 horas.

Após o término da reação, o composto representado pela fórmula (I-2) pode ser isolado submetendo-se a mistura reacional às operações pós-tratamento tal como adicionando a mistura reacional à água, extraíndo com um solvente orgânico, secando a camada orgânica, concentrando o extrato e similares. O composto isolado representado pela fórmula (I-2) pode ser também purificado por recristalização, cromatografia de coluna e similares.

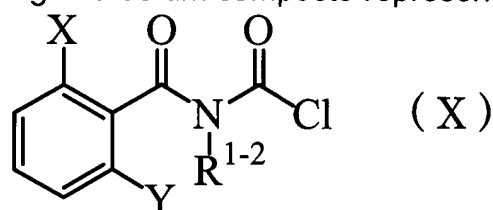
(Processo de Produção 4)

Entre o composto (I), o composto representado pela fórmula (I-3):

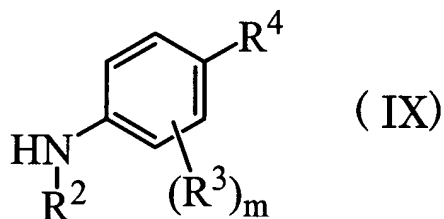


em que, X, Y, R², R³, R⁴ e m são como definidos acima,

R¹⁻² representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, ou um grupo representado por -(CH₂)_l-A em que l representa um número inteiro de 1 a 4, e A representa um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio, pode ser produzido reagindo-se um composto representado pela fórmula (X):



em que, X, Y e R¹⁻² são como definidos acima, com um composto representado pela fórmula (IX):



em que, R², R³, R⁴ e m são como definidos acima.

20

A reação é geralmente realizada em um solvente sob a presença

de uma base.

Exemplos do solvente usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofuran, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água e uma mistura destes.

Exemplos da base usada para a reação incluem hidróxidos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio e similares, hidretos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidreto de sódio, hidreto de potássio, hidreto de cálcio e similares, carbonatos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como carbonato de sódio, carbonato de potássio e similares, alcoolatos de metal de álcali tais como etilato de sódio, metilato de sódio e similares, reagentes de lítio orgânicos tais como n-butil lítio, diisopropilamida de lítio e similares, bases orgânicas tais como trietilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno e similares.

Quando um reagente que é líquido sob a condição de reação é usado, a quantidade em excesso de cada reagente pode ser usada em termos da quantidade dos reagentes usados para a reação, porém geralmente, o composto representado pela fórmula (IX) é usado com uma taxa de 1 a 4 moles e a base é usada com uma taxa de 1 a 4 moles com relação a um mol do composto representado pela fórmula (X).

A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 150°C, e o tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 200 horas.

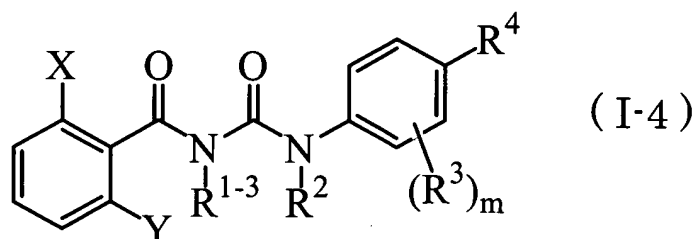
Após o término da reação, o composto representado pela fórmula (I-3) pode ser isolado submetendo-se a mistura reacional às operações

pós-tratamento tal como adicionando a mistura reacional à água, extraíndo com um solvente orgânico, secando a camada orgânica, concentrando o extrato e similares. O composto isolado representado pela fórmula (I-3) pode ser também purificado por recristalização, cromatografia de coluna e similares.

5

(Processo de Produção 5)

Entre o composto (I), o composto representado pela fórmula (I-4):



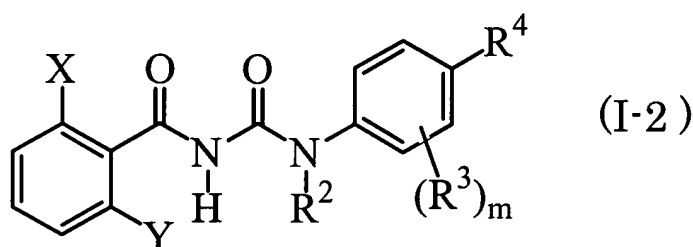
em que, X, Y, R^2 , R^3 , R^4 e m são como definidos acima,

10

R^{1-3} representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxycarbonila inferior, um grupo aril alquiloxy-carbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoíla, um grupo alcanoíla inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo formila, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, ou um grupo ariloxycarbonila, um grupo cicloalquila inferior, ou um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4, e A representa um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio),

25

pode ser produzido reagindo-se um composto representado pela fórmula (I-2):



em que, X, Y, R², R³, R⁴ e m são como definidos acima, com um composto representado pela fórmula (XII):



- 5 em que, R¹⁻³ é como definido acima,
L³ representa um átomo de halogênio, grupo metanossulfonilóxi, grupo benzenossulfonilóxi, grupo toluenossulfonilóxi, grupo metoxissulfonilóxi, ou grupo etoxissulfonilóxi, na presença de uma base.

10 A reação é geralmente realizada em um solvente sob a presença de uma base.

Exemplos do solvente usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água e s

15

20 mistura destes.

Exemplos da base usada para a reação incluem hidróxidos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio e similares, hidretos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidreto de sódio, hidreto de potássio, hidreto de cálcio e similares, carbonatos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como carbonato de sódio, carbonato de potássio e similares, alcoolatos de metal de álcali tais como etilato de sódio, metilato de sódio e

25

similares, reagentes de lítio orgânicos tais como n-butil lítio, diisopropilamida de lítio e similares, bases orgânicas tais como trietilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno e similares.

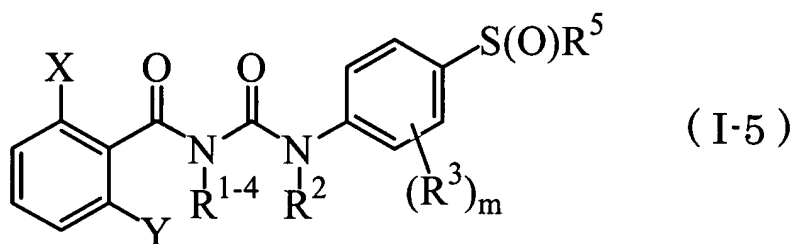
Quando um reagente que é líquido sob a condição de reação é usado, a quantidade em excesso de cada reagente pode ser usada em termos da quantidade dos reagentes usados para a reação, porém geralmente, o composto representado pela fórmula (XII) é usado com uma taxa de 1 a 4 moles e a base é usada com uma taxa de 1 a 4 moles com relação a um mol do composto representado pela fórmula (I-2).

A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 150°C, e o tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 100 horas.

Após o término da reação, o composto representado pela fórmula (I-4) pode ser isolado submetendo-se a mistura reacional às operações pós-tratamento tal como adicionando a mistura reacional à água, extraíndo com um solvente orgânico, secando a camada orgânica, concentrando o extrato e similares. O composto isolado representado pela fórmula (I-4) pode ser também purificado por recristalização, cromatografia de coluna e similares.

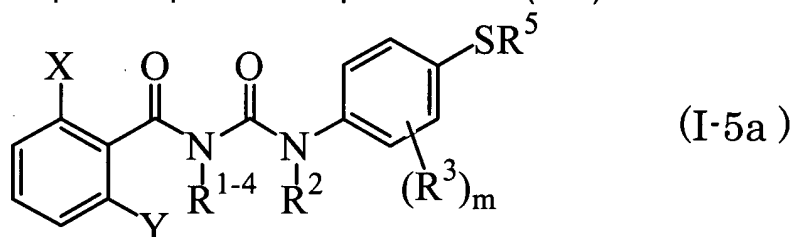
20 (Processo de Produção 6)

Entre o composto (I), o composto representado pela fórmula (I-5):



em que, X, Y, R², R³, R⁵ e m são como definidos acima, R¹⁻⁴ representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior, um grupo alquinila inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou

mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanoila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4, e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila ou um grupo alcóxicarbonila inferior, pode ser produzido submetendo-se um composto representado pela fórmula (I-5a):



em que, X, Y, R¹⁻⁴, R², R³, R⁵ e m são como definidos acima, a uma reação
15 de oxidação.

A reação é geralmente realizada em um solvente sob a presença de um agente de oxidação.

Exemplos do solvente usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água e uma mistura destes.

Exemplos do agente de oxidação usado para a reação incluem

peróxidos tais como ácido meta-cloroperbenzóico, peróxido de hidrogênio e similares.

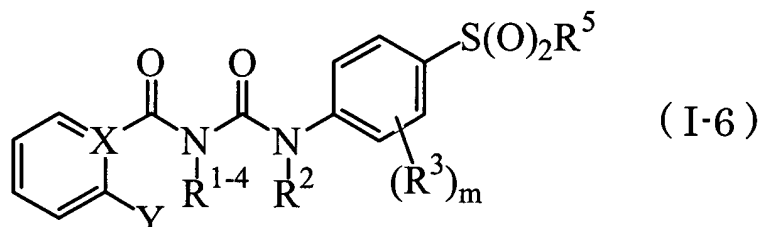
A quantidade do agente de oxidação usado para a reação é geralmente em uma taxa de 1 a 2 moles com relação a um mol do composto representado pela fórmula (I-5a).

A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 150°C, e o tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 100 horas.

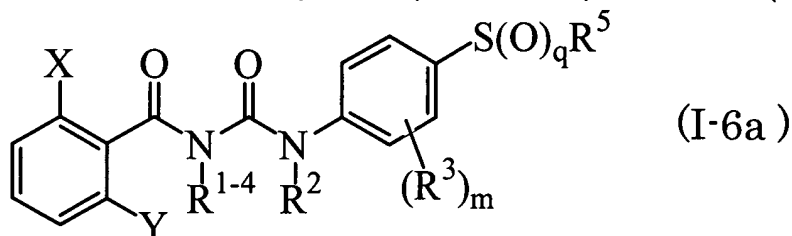
Após o término da reação, o composto representado pela fórmula (I-5) pode ser isolado submetendo-se a mistura reacional às operações pós-tratamento tal como adicionando a mistura reacional à água, extraindo com um solvente orgânico, secando a camada orgânica, concentrando o extrato e similares. O composto isolado representado pela fórmula (I-5) pode ser também purificado por recristalização, cromatografia de coluna e similares.

(Processo de Produção 7)

Entre o composto (I), um composto representado pela fórmula (I-6):



em que, X, Y, R¹⁻⁴, R², R³, R⁵ e m são como definidos acima, pode ser produzido submetendo-se um composto representado pela fórmula (I-6a):



em que, X, Y, R¹⁻⁴, R², R³, R⁵ e m são como definidos acima e q representa um número inteiro de 0 ou 1, a uma reação de oxidação.

A reação é geralmente realizada em um solvente sob a presença de um agente de oxidação.

Exemplos do solvente usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofuran, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água e uma
5
10 mistura destes.

Exemplos do agente de oxidação usado para a reação incluem peróxidos tais como ácido meta-cloroperbenzóico, peróxido de hidrogênio e similares.

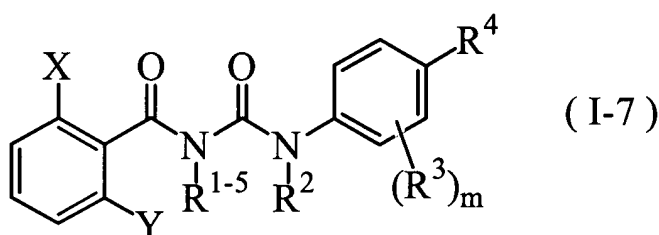
A quantidade do agente de oxidação usado para a reação é geralmente em uma taxa de 2 a 10 moles com relação a um mol do composto representado pela fórmula (I-6a).
15

A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 150°C, e o tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 100 horas.

20 Após o término da reação, o composto representado pela fórmula (I-6) pode ser isolado submetendo-se a mistura reacional às operações pós-tratamento tal como adicionando a mistura reacional à água, extraíndo com um solvente orgânico, secando a camada orgânica, concentrando o extrato e similares. O composto isolado representado pela fórmula (I-6) pode
25 ser também purificado por recristalização, cromatografia de coluna e similares.

(Processo de Produção 8)

Entre o composto (I), um composto representado pela fórmula (I-7):



em que, X, Y, R^2 e m são como definidos acima,

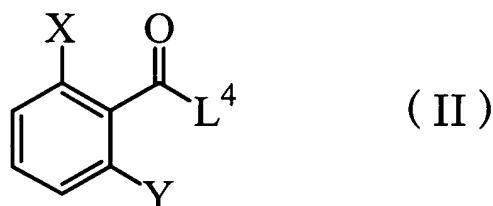
R^{1-5} representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alcanoilóxi inferior alquila inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior,

um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo aril alcóxi inferior carbonila, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoíla, um grupo alcanoíla inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo formila, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo cicloalquila inferior, ou um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um anel heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4 e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcoxicarbonila inferior ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,

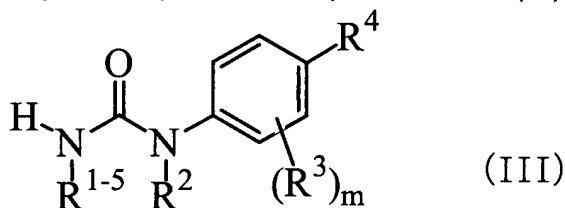
R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e

R^4 representa um grupo alcoxicarbonila inferior ou um grupo representado

por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior ou opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, pode ser produzido reagindo-se um composto representado pela fórmula (II):



em que, X e Y são como definidos acima, e L^4 representa um átomo de halogênio, com um composto representado pela fórmula (III):



em que, R^{1-5} , R^2 , R^3 , R^4 e m são como definidos acima.

A reação é realizada em um solvente orgânico sob a presença de uma base.

Exemplos do solvente orgânico usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água e uma mistura destes, e preferivelmente incluem hidrocarbonetos aromáticos tais como tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorobenzeno e similares, ou amidas tal como N,N-dimetilformamida e similares, e mais preferivelmente incluem tolue-

no, xileno, e clorobenzeno.

Exemplos da base usada para a reação incluem hidróxidos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio e similares, hidretos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidreto de sódio, hidreto de potássio, hidreto de cálcio e similares, carbonatos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como carbonato de sódio, carbonato de potássio e similares, alcoolatos de metal de álcali tais como etilato de sódio, metilato de sódio e similares, reagentes de lítio orgânicos tais como n-butil lítio, diisopropilamida de lítio e similares, bases orgânicas tais como trietilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno e similares, e preferivelmente incluem bases orgânicas tais como diisopropiletilamina, trietilamina, piridina e 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno ou carbonatos de metal tais como carbonato de potássio, e particularmente preferivelmente incluem diisopropiletilamina, trietilamina e similares.

Com respeito à quantidade do reagente usado para a reação, geralmente o composto representado pela fórmula (II) é usado em uma taxa de 1 a 4 moles e a base é usada em uma taxa de 1 a 4 moles com relação a um mol do composto representado pela fórmula (III), e preferivelmente o composto representado pela fórmula (II) é usado em uma taxa de 1,0 a 2,0 moles e a base é usada em uma taxa de 1,0 a 2,0 com relação a um mol do composto representado pela fórmula (III).

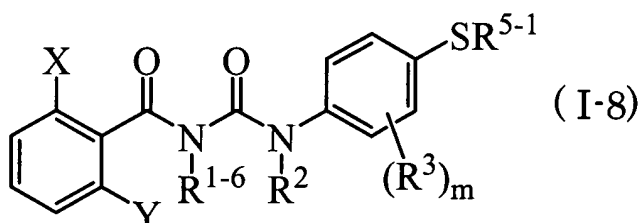
A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 180°C, e preferivelmente em uma faixa de 80 a 150°C, e particularmente preferivelmente em uma faixa de 90 a 120°C. O tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 200 horas, e preferivelmente em uma faixa de 3 a 9 horas.

Após o término da reação, o composto representado pela fórmula (I-7) pode ser isolado submetendo-se a mistura reacional às operações pós-tratamento tal como adicionando a mistura reacional à água, extraíndo com um solvente orgânico, secando a camada orgânica, concentrando o extrato e similares. O composto isolado representado pela fórmula (I-7) pode

ser também purificado por recristalização, cromatografia de coluna e similares.

(Processo de Produção 9)

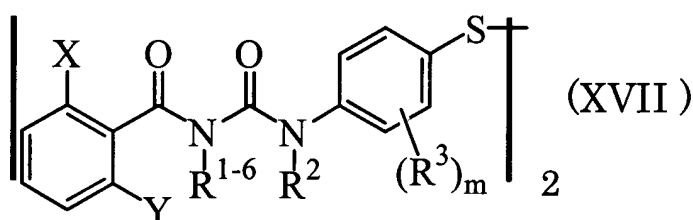
Entre o composto (I), um composto representado pela fórmula (I-8):



em que, X, Y, R^2 , R^3 e m são como definidos acima,

R^{1-6} representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior, um grupo arilóxi alquila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo aril alcóxi inferior carbonila, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanoila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo formila, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, ou um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4 e A representa um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio, e R^{5-1} representa trifluorometila, 1,1,2,2,2-pentafluoroetila, 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propila, ou triclorometila,

pode ser produzido reagindo-se um composto representado pela fórmula (XVII):



em que X, Y, R^{1-6} , R^2 , R^3 e m são como definidos acima, com um composto representado pela fórmula (XVIII):



em que R^{5-1} é como definido acima, e m representa sódio ou potássio.

A reação é geralmente realizada em um solvente.

Exemplos do solvente usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água e uma mistura destes.

Quando um reagente que é líquido sob a condição de reação é usado, a quantidade em excesso de cada reagente pode ser usada em termos da quantidade dos reagentes usados para a reação, porém geralmente, o composto representado pela fórmula (XVIII) é usado com uma taxa de 1 a 10 moles com relação a um mol do composto representado pela fórmula (XVII).

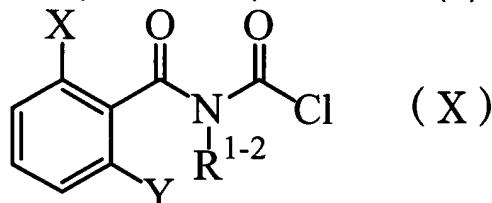
A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 150°C , e o tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 100 horas.

Após o término da reação, o composto representado pela fórmula (I-8) pode ser isolado realizando-se operações pós-tratamento tal como secagem, concentração, e similares após filtração da mistura de reação. O composto isolado representado pela fórmula (I-8) pode ser também purifica-

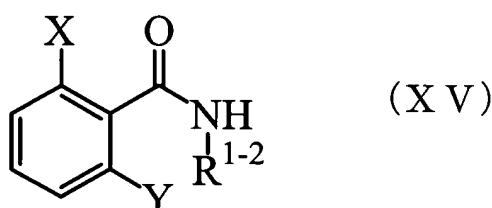
do por recristalização, cromatografia de coluna e similares.

(Processo de Produção de Referência 1)

O composto representado pela fórmula (X):



em que, X, Y, e R¹⁻² são como definidos acima, pode ser produzido reagindo-se um composto representado pela fórmula (XV):



em que, X, Y e R¹⁻² são como definidos acima, composto de triálquilclorossilano e reagente de clorocarbonilação.

A reação é geralmente realizada em um solvente sob a presença de uma base.

Exemplos do solvente usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofuran, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água e uma mistura destes.

Exemplos da base usada para a reação incluem hidróxidos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio e similares, hidretos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidreto de sódio, hidreto de potássio, hidreto de cálcio e similares, carbonatos de metal de álcali ou metal alcalino-

terroso tais como carbonato de sódio, carbonato de potássio e similares, alcoolatos de metal de álcali tais como etilato de sódio, metilato de sódio e similares, reagentes de lítio orgânicos tais como n-butil lítio, diisopropilamida de lítio e similares, bases orgânicas tais como trietilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno e similares.

Exemplos do composto de trialquilclorossilano usado para a reação incluem trimetilclorossilano e trietilclorossilano.

Exemplos do reagente de clorocarbonilação usado para a reação incluem fosgênio, cloroformato de triclorometila, bis(triclorometil) carbonato e similares.

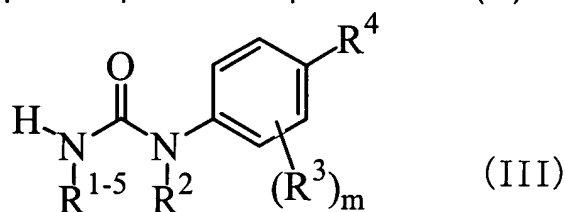
Com respeito à quantidade do reagente usado na reação, trialquilclorossilano é geralmente usado em uma taxa de 1 a 4 moles, reagente de clorocarbonilação é geralmente usado em uma taxa de 1 a 4 moles e a base é geralmente usada em uma taxa de 1 a 4 moles com respeito a um mol do composto representado pela fórmula (XV).

A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 150°C, e o tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 200 horas.

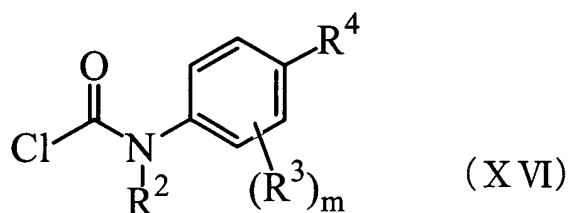
Após o término da reação, o composto representado pela fórmula (X) pode ser isolado submetendo-se a mistura reacional às operações pós-tratamento tal como concentração da mistura de reação no estado em que ela encontra-se. O composto isolado representado pela fórmula (X) pode ser usado para a próxima etapa sem purificação.

(Processo de Produção de Referência 2)

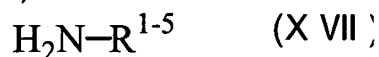
O composto representado pela fórmula (III):



em que, R^{1-5} , R^2 , R^3 , R^4 e m são como definidos acima, pode ser produzido reagindo-se um composto representado pela fórmula (XVI):



em que, R^2 , R^3 , R^4 , e m são como definidos acima, e um composto representado pela fórmula (XVII):



em que, R^{1-5} é como definido acima.

A reação é geralmente realizada em um solvente sob a presença
5 de uma base.

Exemplos do solvente usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água e uma
10 mistura destes.

Exemplos da base usada para a reação incluem hidróxidos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio e similares, hidretos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidreto de sódio, hidreto de potássio, hidreto de cálcio e similares, carbonatos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como carbonato de sódio, carbonato de potássio e similares, alcoolatos de metal de álcali tais como etilato de sódio, metilato de sódio e similares, reagentes de lítio orgânicos tais como n-butil lítio, diisopropilamida de lítio e similares, bases orgânicas tais como trietilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno e similares. Alternativamente, a quantidade
20 em excesso de (XVII) pode ser usada como base.

Com respeito à quantidade do reagente usada na reação, o

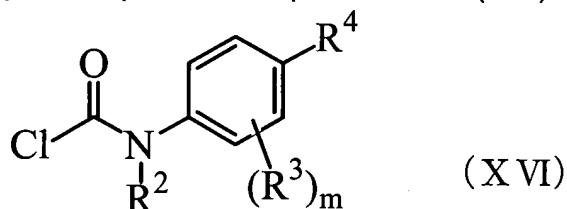
composto representado pela fórmula (XVII) é geralmente em uma taxa de 1 a 6 moles e a base é geralmente em uma taxa de 1 a 6 moles com respeito a um mol do composto representado pela fórmula (XVI).

A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 150°C, e o tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 200 horas.

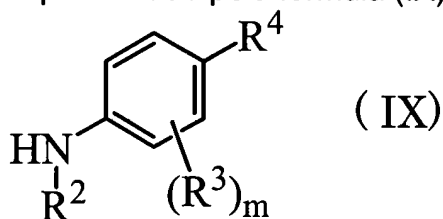
Após o término da reação, o composto representado pela fórmula (III-1) pode ser isolado submetendo-se a mistura reacional às operações pós-tratamento tal como adicionando a mistura reacional à água, extraíndo com um solvente orgânico, secando a camada orgânica, concentrando o extrato e similares. O composto isolado representado pela fórmula (III-1) pode ser também purificado por recristalização, cromatografia de coluna e similares. Além disso, o composto representado pela fórmula (III-1) pode ser usado na próxima etapa sem purificação.

(Processo de Produção de Referência 3)

O composto representado pela fórmula (XVI):



em que, R^2 , R^3 , R^4 , e m são como definidos acima, pode ser produzido reagindo-se um composto representado pela fórmula (IX):



em que, R^2 , R^3 , R^4 e m são como definidos acima, com um reagente de clorocarbonilação.

A reação é geralmente realizada em um solvente sob a presença de uma base.

Exemplos do solvente usado para a reação incluem cetonas tais como acetona, metil etil cetona e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais

como benzeno, tolueno, xileno e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como hexano, heptano e similares, éteres tais como éter dietílico, tetraidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio, clorobenzeno, diclorobenzeno e similares, nitrilas tais como acetonitrila e similares, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetilsulfóxido e similares, água e uma mistura destes.

Exemplos da base usada para a reação incluem hidróxidos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio e similares, hidretos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como hidreto de sódio, hidreto de potássio, hidreto de cálcio e similares, carbonatos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso tais como carbonato de sódio, carbonato de potássio e similares, alcoolatos de metal de álcali tais como etilato de sódio, metilato de sódio e similares, reagentes de lítio orgânicos tais como n-butil lítio, diisopropilamida de lítio e similares, base orgânica tal como trietilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno e similares.

Exemplos do reagente de clorocarbonilação usado para a reação incluem fosgênio, cloroformato de triclorometila, bis(triclorometil) carbonato e similares.

Com respeito à quantidade do reagente usada na reação, o reagente de clorocarbonilação é geralmente usado em uma taxa de 1 a 4 moles e a base é geralmente usada em uma taxa de 1 a 4 moles com respeito a um mol do composto representado pela fórmula (IX).

A temperatura reacional da reação é geralmente em uma faixa de -78 a 150°C, e o tempo de reação é geralmente em uma faixa de 0,1 a 200 horas.

Após o término da reação, o composto representado pela fórmula (XVI) pode ser isolado submetendo-se a mistura reacional às operações pós-tratamento tal como adicionando a mistura reacional à água, extraíndo com um solvente orgânico, secando a camada orgânica, concentrando o

extrato e similares. O composto isolado representado pela fórmula (XVI) pode ser também purificado por recristalização, cromatografia de coluna e similares. Além disso, após o término da reação, o composto representado pela fórmula (XVI) pode ser isolado por operação pós-tratamentos tal como concentração da mistura de reação no estado em que ela encontra-se. O composto isolado representado pela fórmula (XVI) pode ser usado na próxima etapa sem purificação.

O composto representado pelas fórmulas (IV), (VI) e (VIII) pode ser produzido de acordo com um método para produção descrito em, por exemplo, Journal of Agricultural e Food Chemistry (1973) Vol. 21, (Nº.3), pp.348-354, ou um método análogo a ele.

O composto representado pela fórmula (IX) pode ser produzido de acordo com um método para produção descrito em, por exemplo, Journal of Pesticide Science 23(3) (1998) P250-254 ou Journal of the Chemical Society Chemical Communication (1984) pp.1334-1335, ou um método análogo a ele.

O composto representado pela fórmula (XV) pode ser produzido de acordo com um método para produção descrito em, por exemplo, Journal of the Chemical Society Perkin Transactions 1 (1985) pp.1381-1385, ou um método análogo a ele.

Além disso, submetendo-se o composto produzido pelo método mencionado acima para produção e similares a uma reação conhecida por si própria, por exemplo, alquilação, alquênilação, alquinilação, acilação, aminação, sulfidação, sulfinilação, sulfonação, oxidação, redução, halogenação, nitração e similares, seu substituinte pode ser convertido em outro substituinte desejado.

O composto obtido pelos Processos de Produção 1 a 8 mencionados acima e Processos de Produção de Referência 1 a 3 podem ser purificados por métodos tais como recristalização, cromatografia de coluna, cromatografia líquida de desempenho elevado, cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média, cromatografia de coluna de resina de desmineralização, reprecipitação e similares.

Um sal preferido dos compostos (I) é um sal em que o átomo de nitrogênio básico na molécula e grupo básico tal como grupo dialquil amino e similares no substituinte forma um sal de adição ácido agroquimicamente aceitável com um ácido inorgânico, ácido orgânico ou similar.

- 5 Exemplos do sal de adição ácido inorgânico incluem sal com ácido clorídrico, ácido bromídrico, ácido iodídrico, ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido fosfórico e ácido perclórico, e exemplos do sal de adição ácido orgânico incluem um sal com ácido fórmico, ácido acético, ácido propiônico, ácido oxálico, ácido succínico, ácido benzóico, ácido paratoluenossulfônico, 10 ácido metanossulfônico e ácido trifluoroacético.

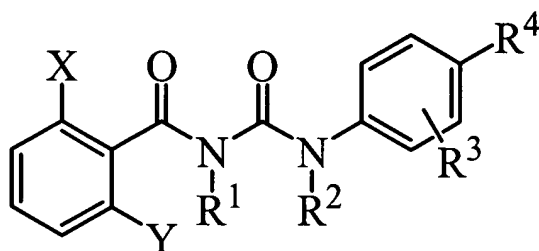
Quando R^1 do composto (I) é um átomo de hidrogênio, um ânion gerado por dissociação do átomo de hidrogênio e um cátion de metal pode formar um sal agroquimicamente aceitável.

- 15 Por exemplo, um sal com metal de álcali (sódio, potássio e similares) e metal alcalino-terroso (cálcio e similares) são exemplificados. Além disso, quando R^1 do composto (I) é um átomo de hidrogênio, o composto (I) e uma base inorgânica ou base orgânica podem formar um sal de adição agroquimicamente aceitável.

- 20 Exemplos da base inorgânica incluem um sal com amônia, e exemplos da base orgânica incluem um sal com dimetilamina, trietilamina, N,N-dimetilanilina, piperazina, pirrolidina, piperidina, piridina, 2-feniletilamina, benzilamina, etanolamina, dietanolamina e 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undeceno e similares.

- 25 O sal do composto (I) pode ser obtido misturando-se o composto (I) e um ácido ou uma base.

A seguir, os compostos da presente invenção serão mostrados especificamente.



em que, X, Y, R^1 , R^2 , R^3 e R^4 são qualquer uma das combinações dos subs-

tituintes mostrados na Tabela 1.

Tabela 1

Nº	X	Y	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
I-1	Cl	F	H	Me	H	SCF ₃
I-2	Cl	Cl	H	Me	H	SCF ₃
I-3	Cl	F	H	Me	2-Cl	SCF ₃
I-4	Cl	Cl	H	Me	2-Cl	SCF ₃
I-5	Cl	F	H	Me	2-Me	SCF ₃
I-6	Cl	Cl	H	Me	2-Me	SCF ₃
I-7	Cl	F	H	Me	2,3-Me ₂	SCF ₃
I-8	Cl	Cl	H	Me	2,3-Me ₂	SCF ₃
I-9	Cl	F	Me	Me	H	SCF ₃
I-10	Cl	Cl	Me	Me	H	SCF ₃
I-11	Cl	F	Me	Me	2-Cl	SCF ₃
I-12	Cl	Cl	Me	Me	2-Cl	SCF ₃
I-13	Cl	F	Me	Me	2-Me	SCF ₃
I-14	Cl	Cl	Me	Me	2-Me	SCF ₃
I-15	Cl	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SCF ₃
I-16	Cl	Cl	Me	Me	2,3-Me ₂	SCF ₃
I-17	F	F	H	Et	H	SCF ₃
I-18	Cl	F	H	Et	H	SCF ₃
I-19	Cl	Cl	H	Et	H	SCF ₃
I-20	Cl	F	H	Et	2-F	SCF ₃
I-21	Cl	Cl	H	Et	2-F	SCF ₃
I-22	F	F	H	Et	2-Cl	SCF ₃
I-23	Cl	F	H	Et	2-Cl	SCF ₃
I-24	Cl	Cl	H	Et	2-Cl	SCF ₃
I-25	F	F	H	Et	2-Me	SCF ₃
I-26	Cl	F	H	Et	2-Me	SCF ₃
I-27	Cl	Cl	H	Et	2-Me	SCF ₃

I-28	F	F	H	Et	2,3-Me ₂	SCF ₃
I-29	Cl	F	H	Et	2,3-Me ₂	SCF ₃
I-30	Cl	Cl	H	Et	2,3-Me ₂	SCF ₃
I-31	F	F	Me	Et	H	SCF ₃
I-32	Cl	F	Me	Et	H	SCF ₃
I-33	Cl	Cl	Me	Et	H	SCF ₃
I-34	Cl	F	Me	Et	2-F	SCF ₃
I-35	Cl	Cl	Me	Et	2-F	SCF ₃
I-36	F	F	Me	Et	2-Cl	SCF ₃
I-37	Cl	F	Me	Et	2-Cl	SCF ₃
I-38	Cl	Cl	Me	Et	2-Cl	SCF ₃
I-39	F	F	Me	Et	2-Me	SCF ₃
I-40	Cl	F	Me	Et	2-Me	SCF ₃
I-41	Cl	Cl	Me	Et	2-Me	SCF ₃
I-42	F	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SCF ₃
I-43	Cl	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SCF ₃
I-44	Cl	Cl	Me	Et	2,3-Me ₂	SCF ₃
I-45	F	F	H	Me	H	SO CF ₃
I-46	Cl	F	H	Me	H	SO CF ₃
I-47	Cl	Cl	H	Me	H	SO CF ₃
I-48	Cl	F	H	Me	2-F	SO CF ₃
I-49	Cl	Cl	H	Me	2-F	SO CF ₃
I-50	F	F	H	Me	2-Cl	SO CF ₃
I-51	Cl	F	H	Me	2-Cl	SO CF ₃
I-52	Cl	Cl	H	Me	2-Cl	SO CF ₃
I-53	F	F	H	Me	2-Me	SO CF ₃
I-54	Cl	F	H	Me	2-Me	SO CF ₃
I-55	Cl	Cl	H	Me	2-Me	SO CF ₃
I-56	F	F	H	Me	2,3-Me ₂	SO CF ₃
I-57	Cl	F	H	Me	2,3-Me ₂	SO CF ₃

I-58	Cl	Cl	H	Me	2,3-Me ₂	SOCF ₃
I-59	F	F	Me	Me	H	SOCF ₃
I-60	Cl	F	Me	Me	H	SOCF ₃
I-61	Cl	Cl	Me	Me	H	SOCF ₃
I-62	F	F	Me	Me	2-F	SOCF ₃
I-63	Cl	F	Me	Me	2-F	SOCF ₃
I-64	Cl	Cl	Me	Me	2-F	SOCF ₃
I-65	F	F	Me	Me	2-Cl	SOCF ₃
I-66	Cl	F	Me	Me	2-Cl	SOCF ₃
I-67	Cl	Cl	Me	Me	2-Cl	SOCF ₃
I-68	F	F	Me	Me	2-Me	SOCF ₃
I-69	Cl	F	Me	Me	2-Me	SOCF ₃
I-70	Cl	Cl	Me	Me	2-Me	SOCF ₃
I-71	F	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SOCF ₃
I-72	Cl	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SOCF ₃
I-73	Cl	Cl	Me	Me	2,3-Me ₂	SOCF ₃
I-74	F	F	H	Et	H	SOCF ₃
I-75	Cl	F	H	Et	H	SOCF ₃
I-76	Cl	Cl	H	Et	H	SOCF ₃
I-77	F	F	H	Et	2-F	SOCF ₃
I-78	Cl	F	H	Et	2-F	SOCF ₃
I-79	Cl	Cl	H	Et	2-F	SOCF ₃
I-80	F	F	H	Et	2-Cl	SOCF ₃
I-81	Cl	F	H	Et	2-Cl	SOCF ₃
I-82	Cl	Cl	H	Et	2-Cl	SOCF ₃
I-83	F	F	H	Et	2-Me	SOCF ₃
I-84	Cl	F	H	Et	2-Me	SOCF ₃
I-85	Cl	Cl	H	Et	2-Me	SOCF ₃
I-86	F	F	H	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₃
I-87	Cl	F	H	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₃

I-88	Cl	Cl	H	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₃
I-89	F	F	Me	Et	H	SOCF ₃
I-90	Cl	F	Me	Et	H	SOCF ₃
I-91	Cl	Cl	Me	Et	H	SOCF ₃
I-92	F	F	Me	Et	2-F	SOCF ₃
I-93	Cl	F	Me	Et	2-F	SOCF ₃
I-94	Cl	Cl	Me	Et	2-F	SOCF ₃
I-95	F	F	Me	Et	2-Cl	SOCF ₃
I-96	Cl	F	Me	Et	2-Cl	SOCF ₃
I-97	Cl	Cl	Me	Et	2-Cl	SOCF ₃
I-98	F	F	Me	Et	2-Me	SOCF ₃
I-99	Cl	F	Me	Et	2-Me	SOCF ₃
I-100	Cl	Cl	Me	Et	2-Me	SOCF ₃
I-101	F	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₃
I-102	Cl	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₃
I-103	Cl	Cl	Me	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₃
I-104	F	F	H	Me	H	SO ₂ CF ₃
I-105	Cl	F	H	Me	H	SO ₂ CF ₃
I-106	Cl	Cl	H	Me	H	SO ₂ CF ₃
I-107	Cl	F	H	Me	2-F	SO ₂ CF ₃
I-108	Cl	Cl	H	Me	2-F	SO ₂ CF ₃
I-109	F	F	H	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-110	Cl	F	H	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-111	Cl	Cl	H	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-112	F	F	H	Me	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-113	Cl	F	H	Me	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-114	Cl	Cl	H	Me	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-115	F	F	H	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃
I-116	Cl	F	H	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃
I-117	Cl	Cl	H	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃

I-118	F	F	Me	Me	H	SO ₂ CF ₃
I-119	Cl	F	Me	Me	H	SO ₂ CF ₃
I-120	Cl	Cl	Me	Me	H	SO ₂ CF ₃
I-121	Cl	F	Me	Me	2-F	SO ₂ CF ₃
I-122	Cl	Cl	Me	Me	2-F	SO ₂ CF ₃
I-123	F	F	Me	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-124	Cl	F	Me	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-125	Cl	Cl	Me	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-126	F	F	Me	Me	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-127	Cl	F	Me	Me	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-128	Cl	Cl	Me	Me	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-129	F	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃
I-130	Cl	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃
I-131	Cl	Cl	Me	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃
I-132	F	F	H	Et	H	SO ₂ CF ₃
I-133	Cl	F	H	Et	H	SO ₂ CF ₃
I-134	Cl	Cl	H	Et	H	SO ₂ CF ₃
I-135	F	F	H	Et	2-F	SO ₂ CF ₃
I-136	Cl	F	H	Et	2-F	SO ₂ CF ₃
I-137	Cl	Cl	H	Et	2-F	SO ₂ CF ₃
I-138	F	F	H	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-139	Cl	F	H	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-140	Cl	Cl	H	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-141	F	F	H	Et	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-142	Cl	F	H	Et	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-143	Cl	Cl	H	Et	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-144	F	F	H	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃
I-145	Cl	F	H	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃
I-146	Cl	Cl	H	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃
I-147	F	F	Me	Et	H	SO ₂ CF ₃

I-148	Cl	F	Me	Et	H	SO ₂ CF ₃
I-149	Cl	Cl	Me	Et	H	SO ₂ CF ₃
I-150	F	F	Me	Et	2-F	SO ₂ CF ₃
I-151	Cl	F	Me	Et	2-F	SO ₂ CF ₃
I-152	Cl	Cl	Me	Et	2-F	SO ₂ CF ₃
I-153	F	F	Me	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-154	Cl	F	Me	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-155	Cl	Cl	Me	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₃
I-156	F	F	Me	Et	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-157	Cl	F	Me	Et	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-158	Cl	Cl	Me	Et	2-Me	SO ₂ CF ₃
I-159	F	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃
I-160	Cl	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃
I-161	Cl	Cl	Me	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₃
I-162	F	F	H	Me	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-163	Cl	F	H	Me	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-164	Cl	Cl	H	Me	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-165	Cl	Cl	H	Me	2-F	SCF ₂ CF ₂ H
I-166	Cl	F	H	Me	2-Cl	SCF ₂ CF ₂ H
I-167	Cl	Cl	H	Me	2-Cl	SCF ₂ CF ₂ H
I-168	Cl	F	H	Me	2-Me	SCF ₂ CF ₂ H
I-169	Cl	Cl	H	Me	2-Me	SCF ₂ CF ₂ H
I-170	Cl	F	H	Me	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₂ H
I-171	Cl	Cl	H	Me	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₂ H
I-172	F	F	Me	Me	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-173	Cl	F	Me	Me	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-174	Cl	Cl	Me	Me	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-175	Cl	Cl	Me	Me	2-F	SCF ₂ CF ₂ H
I-176	Cl	F	Me	Me	2-Cl	SCF ₂ CF ₂ H
I-177	Cl	Cl	Me	Me	2-Cl	SCF ₂ CF ₂ H

I-178	Cl	F	Me	Me	2-Me	SCF ₂ CF ₂ H
I-179	Cl	Cl	Me	Me	2-Me	SCF ₂ CF ₂ H
I-180	Cl	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₂ H
I-181	Cl	Cl	Me	Me	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₂ H
I-182	F	F	H	Et	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-183	Cl	F	H	Et	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-184	Cl	Cl	H	Et	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-185	F	F	H	Et	2-F	SCF ₂ CF ₂ H
I-186	Cl	F	H	Et	2-F	SCF ₂ CF ₂ H
I-187	Cl	Cl	H	Et	2-F	SCF ₂ CF ₂ H
I-188	F	F	H	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₂ H
I-189	Cl	F	H	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₂ H
I-190	Cl	Cl	H	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₂ H
I-191	F	F	H	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₂ H
I-192	Cl	F	H	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₂ H
I-193	Cl	Cl	H	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₂ H
I-194	F	F	H	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₂ H
I-195	Cl	F	H	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₂ H
I-196	Cl	Cl	H	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₂ H
I-197	F	F	Me	Et	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-198	Cl	F	Me	Et	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-199	Cl	Cl	Me	Et	H	SCF ₂ CF ₂ H
I-200	F	F	Me	Et	2-F	SCF ₂ CF ₂ H
I-201	Cl	F	Me	Et	2-F	SCF ₂ CF ₂ H
I-202	Cl	Cl	Me	Et	2-F	SCF ₂ CF ₂ H
I-203	F	F	Me	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₂ H
I-204	Cl	F	Me	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₂ H
I-205	Cl	Cl	Me	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₂ H
I-206	F	F	Me	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₂ H
I-207	Cl	F	Me	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₂ H

I-208	Cl	Cl	Me	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₂ H
I-209	F	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₂ H
I-210	Cl	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₂ H
I-211	Cl	Cl	Me	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₂ H
I-212	F	F	H	Me	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-213	Cl	F	H	Me	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-214	Cl	Cl	H	Me	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-215	Cl	F	H	Me	2-F	SOCF ₂ CF ₂ H
I-216	Cl	Cl	H	Me	2-F	SOCF ₂ CF ₂ H
I-217	F	F	H	Me	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-218	Cl	F	H	Me	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-219	Cl	Cl	H	Me	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-220	F	F	H	Me	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-221	Cl	F	H	Me	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-222	Cl	Cl	H	Me	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-223	F	F	H	Me	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₂ H
I-224	Cl	F	H	Me	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₂ H
I-225	Cl	Cl	H	Me	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₂ H
I-226	F	F	Me	Me	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-227	Cl	F	Me	Me	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-228	Cl	Cl	Me	Me	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-229	Cl	F	Me	Me	2-F	SOCF ₂ CF ₂ H
I-230	Cl	Cl	Me	Me	2-F	SOCF ₂ CF ₂ H
I-231	F	F	Me	Me	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-232	Cl	F	Me	Me	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-233	Cl	Cl	Me	Me	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-234	F	F	Me	Me	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-235	Cl	F	Me	Me	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-236	Cl	Cl	Me	Me	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-237	F	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₂ H

I-238	Cl	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₂ H
I-239	Cl	Cl	Me	Me	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₂ H
I-240	F	F	H	Et	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-241	Cl	F	H	Et	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-242	Cl	Cl	H	Et	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-243	F	F	H	Et	2-F	SOCF ₂ CF ₂ H
I-244	Cl	F	H	Et	2-F	SOCF ₂ CF ₂ H
I-245	Cl	Cl	H	Et	2-F	SOCF ₂ CF ₂ H
I-246	F	F	H	Et	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-247	Cl	F	H	Et	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-248	Cl	Cl	H	Et	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-249	F	F	H	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-250	Cl	F	H	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-251	Cl	Cl	H	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-252	F	F	H	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₂ H
I-253	Cl	F	H	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₂ H
I-254	Cl	Cl	H	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₂ H
I-255	F	F	Me	Et	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-256	Cl	F	Me	Et	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-257	Cl	Cl	Me	Et	H	SOCF ₂ CF ₂ H
I-258	F	F	Me	Et	2-F	SOCF ₂ CF ₂ H
I-259	Cl	F	Me	Et	2-F	SOCF ₂ CF ₂ H
I-260	Cl	Cl	Me	Et	2-F	SOCF ₂ CF ₂ H
I-261	F	F	Me	Et	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-262	Cl	F	Me	Et	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-263	Cl	Cl	Me	Et	2-Cl	SOCF ₂ CF ₂ H
I-264	F	F	Me	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-265	Cl	F	Me	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-266	Cl	Cl	Me	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₂ H
I-267	F	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₂ H

I-268	Cl	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-269	Cl	Cl	Me	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-270	F	F	H	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-271	Cl	F	H	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-272	Cl	Cl	H	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-273	Cl	F	H	Me	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-274	Cl	Cl	H	Me	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-275	F	F	H	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-276	Cl	F	H	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-277	Cl	Cl	H	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-278	F	F	H	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-279	Cl	F	H	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-280	Cl	Cl	H	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-281	F	F	H	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-282	Cl	F	H	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-283	Cl	Cl	H	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-284	F	F	Me	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-285	Cl	F	Me	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-286	Cl	Cl	Me	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-287	Cl	F	Me	Me	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-288	Cl	Cl	Me	Me	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-289	F	F	Me	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-290	Cl	F	Me	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-291	Cl	Cl	Me	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-292	F	F	Me	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-293	Cl	F	Me	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-294	Cl	Cl	Me	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-295	F	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-296	Cl	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-297	Cl	Cl	Me	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H

I-298	F	F	H	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-299	Cl	F	H	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-300	Cl	Cl	H	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-301	F	F	H	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-302	Cl	F	H	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-303	Cl	Cl	H	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-304	F	F	H	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-305	Cl	F	H	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-306	Cl	Cl	H	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-307	F	F	H	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-308	Cl	F	H	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-309	Cl	Cl	H	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-310	F	F	H	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-311	Cl	F	H	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-312	Cl	Cl	H	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-313	F	F	Me	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-314	Cl	F	Me	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-315	Cl	Cl	Me	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-316	F	F	Me	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-317	Cl	F	Me	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-318	Cl	Cl	Me	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-319	F	F	Me	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-320	Cl	F	Me	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-321	Cl	Cl	Me	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-322	F	F	Me	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-323	Cl	F	Me	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-324	Cl	Cl	Me	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-325	F	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-326	Cl	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H
I-327	Cl	Cl	Me	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₂ H

I-328	F	F	H	Me	H	SCF ₂ CF ₃
I-329	Cl	F	H	Me	H	SCF ₂ CF ₃
I-330	Cl	Cl	H	Me	H	SCF ₂ CF ₃
I-331	Cl	F	H	Me	2-F	SCF ₂ CF ₃
I-332	Cl	Cl	H	Me	2-F	SCF ₂ CF ₃
I-333	Cl	F	H	Me	2-Cl	SCF ₂ CF ₃
I-334	Cl	Cl	H	Me	2-Cl	SCF ₂ CF ₃
I-335	Cl	F	H	Me	2-Me	SCF ₂ CF ₃
I-336	Cl	Cl	H	Me	2-Me	SCF ₂ CF ₃
I-337	Cl	F	H	Me	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₃
I-338	Cl	Cl	H	Me	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₃
I-339	F	F	Me	Me	H	SCF ₂ CF ₃
I-340	Cl	F	Me	Me	H	SCF ₂ CF ₃
I-341	Cl	Cl	Me	Me	H	SCF ₂ CF ₃
I-342	Cl	F	Me	Me	2-F	SCF ₂ CF ₃
I-343	Cl	Cl	Me	Me	2-F	SCF ₂ CF ₃
I-344	Cl	F	Me	Me	2-Cl	SCF ₂ CF ₃
I-345	Cl	Cl	Me	Me	2-Cl	SCF ₂ CF ₃
I-346	Cl	F	Me	Me	2-Me	SCF ₂ CF ₃
I-347	Cl	Cl	Me	Me	2-Me	SCF ₂ CF ₃
I-348	Cl	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₃
I-349	Cl	Cl	Me	Me	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₃
I-350	F	F	H	Et	H	SCF ₂ CF ₃
I-351	Cl	F	H	Et	H	SCF ₂ CF ₃
I-352	Cl	Cl	H	Et	H	SCF ₂ CF ₃
I-353	F	F	H	Et	2-F	SCF ₂ CF ₃
I-354	Cl	F	H	Et	2-F	SCF ₂ CF ₃
I-355	Cl	Cl	H	Et	2-F	SCF ₂ CF ₃
I-356	F	F	H	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₃
I-357	Cl	F	H	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₃

I-358	Cl	Cl	H	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₃
I-359	F	F	H	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₃
I-360	Cl	F	H	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₃
I-361	Cl	Cl	H	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₃
I-362	F	F	H	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₃
I-363	Cl	F	H	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₃
I-364	Cl	Cl	H	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₃
I-365	F	F	Me	Et	H	SCF ₂ CF ₃
I-366	Cl	F	Me	Et	H	SCF ₂ CF ₃
I-367	Cl	Cl	Me	Et	H	SCF ₂ CF ₃
I-368	F	F	Me	Et	2-F	SCF ₂ CF ₃
I-369	Cl	F	Me	Et	2-F	SCF ₂ CF ₃
I-370	Cl	Cl	Me	Et	2-F	SCF ₂ CF ₃
I-371	F	F	Me	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₃
I-372	Cl	F	Me	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₃
I-373	Cl	Cl	Me	Et	2-Cl	SCF ₂ CF ₃
I-374	F	F	Me	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₃
I-375	Cl	F	Me	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₃
I-376	Cl	Cl	Me	Et	2-Me	SCF ₂ CF ₃
I-377	F	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₃
I-378	Cl	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₃
I-379	Cl	Cl	Me	Et	2,3-Me ₂	SCF ₂ CF ₃
I-380	F	F	H	Me	H	SOCF ₂ CF ₃
I-381	Cl	F	H	Me	H	SOCF ₂ CF ₃
I-382	Cl	Cl	H	Me	H	SOCF ₂ CF ₃
I-383	F	F	H	Me	2-F	SOCF ₂ CF ₃
I-384	Cl	F	H	Me	2-F	SOCF ₂ CF ₃
I-385	Cl	Cl	H	Me	2-F	SOCF ₂ CF ₃
I-386	F	F	H	Me	2-Cl	SOCF ₂ CF ₃
I-387	Cl	F	H	Me	2-Cl	SOCF ₂ CF ₃

I-388	Cl	Cl	H	Me	2-Cl	SOCF_2CF_3
I-389	F	F	H	Me	2-Me	SOCF_2CF_3
I-390	Cl	F	H	Me	2-Me	SOCF_2CF_3
I-391	Cl	Cl	H	Me	2-Me	SOCF_2CF_3
I-392	F	F	H	Me	2,3-Me ₂	SOCF_2CF_3
I-393	Cl	F	H	Me	2,3-Me ₂	SOCF_2CF_3
I-394	Cl	Cl	H	Me	2,3-Me ₂	SOCF_2CF_3
I-395	F	F	Me	Me	H	SOCF_2CF_3
I-396	Cl	F	Me	Me	H	SOCF_2CF_3
I-397	Cl	Cl	Me	Me	H	SOCF_2CF_3
I-398	F	F	Me	Me	2-F	SOCF_2CF_3
I-399	Cl	F	Me	Me	2-F	SOCF_2CF_3
I-400	Cl	Cl	Me	Me	2-F	SOCF_2CF_3
I-401	F	F	Me	Me	2-Cl	SOCF_2CF_3
I-402	Cl	F	Me	Me	2-Cl	SOCF_2CF_3
I-403	Cl	Cl	Me	Me	2-Cl	SOCF_2CF_3
I-404	F	F	Me	Me	2-Me	SOCF_2CF_3
I-405	Cl	F	Me	Me	2-Me	SOCF_2CF_3
I-406	Cl	Cl	Me	Me	2-Me	SOCF_2CF_3
I-407	F	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SOCF_2CF_3
I-408	Cl	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SOCF_2CF_3
I-409	Cl	Cl	Me	Me	2,3-Me ₂	SOCF_2CF_3
I-410	F	F	H	Et	H	SOCF_2CF_3
I-411	Cl	F	H	Et	H	SOCF_2CF_3
I-412	Cl	Cl	H	Et	H	SOCF_2CF_3
I-413	F	F	H	Et	2-F	SOCF_2CF_3
I-414	Cl	F	H	Et	2-F	SOCF_2CF_3
I-415	Cl	Cl	H	Et	2-F	SOCF_2CF_3
I-416	F	F	H	Et	2-Cl	SOCF_2CF_3
I-417	Cl	F	H	Et	2-Cl	SOCF_2CF_3

I-418	Cl	Cl	H	Et	2-Cl	SOCF ₂ CF ₃
I-419	F	F	H	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₃
I-420	Cl	F	H	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₃
I-421	Cl	Cl	H	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₃
I-422	F	F	H	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₃
I-423	Cl	F	H	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₃
I-424	Cl	Cl	H	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₃
I-425	F	F	Me	Et	H	SOCF ₂ CF ₃
I-426	Cl	F	Me	Et	H	SOCF ₂ CF ₃
I-427	Cl	Cl	Me	Et	H	SOCF ₂ CF ₃
I-428	F	F	Me	Et	2-F	SOCF ₂ CF ₃
I-429	Cl	F	Me	Et	2-F	SOCF ₂ CF ₃
I-430	Cl	Cl	Me	Et	2-F	SOCF ₂ CF ₃
I-431	F	F	Me	Et	2-Cl	SOCF ₂ CF ₃
I-432	Cl	F	Me	Et	2-Cl	SOCF ₂ CF ₃
I-433	Cl	Cl	Me	Et	2-Cl	SOCF ₂ CF ₃
I-434	F	F	Me	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₃
I-435	Cl	F	Me	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₃
I-436	Cl	Cl	Me	Et	2-Me	SOCF ₂ CF ₃
I-437	F	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₃
I-438	Cl	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₃
I-439	Cl	Cl	Me	Et	2,3-Me ₂	SOCF ₂ CF ₃
I-440	F	F	H	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-441	Cl	F	H	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-442	Cl	Cl	H	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-443	F	F	H	Me	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-444	Cl	F	H	Me	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-445	Cl	Cl	H	Me	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-446	F	F	H	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-447	Cl	F	H	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃

I-448	Cl	Cl	H	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-449	F	F	H	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-450	Cl	F	H	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-451	Cl	Cl	H	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-452	F	F	H	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-453	Cl	F	H	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-454	Cl	Cl	H	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-455	F	F	Me	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-456	Cl	F	Me	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-457	Cl	Cl	Me	Me	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-458	F	F	Me	Me	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-459	Cl	F	Me	Me	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-460	Cl	Cl	Me	Me	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-461	F	F	Me	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-462	Cl	F	Me	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-463	Cl	Cl	Me	Me	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-464	F	F	Me	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-465	Cl	F	Me	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-466	Cl	Cl	Me	Me	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-467	F	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-468	Cl	F	Me	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-469	Cl	Cl	Me	Me	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-470	F	F	H	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-471	Cl	F	H	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-472	Cl	Cl	H	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-473	F	F	H	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-474	Cl	F	H	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-475	Cl	Cl	H	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-476	F	F	H	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-477	Cl	F	H	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃

I-478	Cl	Cl	H	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-479	F	F	H	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-480	Cl	F	H	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-481	Cl	Cl	H	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-482	F	F	H	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-483	Cl	F	H	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-484	Cl	Cl	H	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-485	F	F	Me	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-486	Cl	F	Me	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-487	Cl	Cl	Me	Et	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-488	F	F	Me	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-489	Cl	F	Me	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-490	Cl	Cl	Me	Et	2-F	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-491	F	F	Me	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-492	Cl	F	Me	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-493	Cl	Cl	Me	Et	2-Cl	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-494	F	F	Me	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-495	Cl	F	Me	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-496	Cl	Cl	Me	Et	2-Me	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-497	F	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-498	Cl	F	Me	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃
I-499	Cl	Cl	Me	Et	2,3-Me ₂	SO ₂ CF ₂ CF ₃

O pesticida da presente invenção pode ser o composto (I) ou um sal deste propriamente dito, porém é geralmente preparado, se necessário, por adição de um tensoativo ou outro agente auxiliar para preparação, como uma emulsão, uma solução, uma microemulsão, uma formulação fluível, uma solução oleosa, um pó umectável, um pó solúvel em água, uma formulação de solução, um pó, um grânulo, um grânulo fino, um agente de revestimento de semente, uma formulação de revestimento de imersão, um agente de fumegação, um aerosol, um comprimido, uma microcápsula, uma for-

mulação *spray*, um agente EW, um unguento, uma isca de veneno, uma cápsula, uma pélete, uma formulação de revestimento de película, uma formulação de pintura, um injetável, uma preparação de xampu ou similar, que contém o composto (I) ou um sal deste e veículos inertes tais como um veículo sólido, um veículo líquido e um veículo gasoso.

Exemplos do veículo líquido usado para preparação incluem água, álcoois (por exemplo, álcool metílico, álcool etílico, álcool n-propílico, álcool isopropílico, etileno glicol e similares), cetonas (por exemplo, acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, cicloexanona e similares), éteres (por exemplo, tetraidrofurano, monometil éter de etileno glicol, monometil éter de dietileno glicol, monometil éter de propileno glicol e similares), hidrocarbonetos alifáticos (por exemplo, querosene, óleo combustível, óleo de máquina e similares), hidrocarbonetos aromáticos (por exemplo, tolueno, xileno, nafta solvente, naftaleno de metila e similares), hidrocarbonetos halogenados (por exemplo, diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono e similares), amidas ácidas (por exemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, N-metilpirrolidona e similares), ésteres (por exemplo, acetato de etila, acetato de butila, éster de glicerina graxo, γ -butilolactona e similares), e nitrilas (por exemplo, acetonitrila, propionitrila e similares).

Exemplos do veículo sólido incluem pó vegetal (por exemplo, pó de soja, pó de tabaco, pó de trigo, pó de madeira e similares), pó mineral (por exemplo, argilas tais como caulim, bentonita, argila ácida e similares, talcos tais como pó de talco, pó de agalmatolita e similares, sílicas tais como terra diatomácea, pó de mica e similares), alumina, pó de enxofre, carbono ativado, carbonato de cálcio, sulfato de amônio, hidrogenocarbonato de sódio, lactose e ureia.

Além disso, exemplos da base de unguento incluem polietileno glicol; pectina; éster de álcool poliídrico de ácido graxo maior tal como éster de glicerina de ácido monoesteárico e similares; derivados de celulose tais como metilcelulose e similares; alginato de sódio; bentonita; álcool maior; álcool poliídrico tal como glicerina e similares; vaselina; vaselina branca; parafina líquida; banha de porco; vários óleos vegetais; lanolina; lanolina desi-

dratada; óleo endurecido; resinas e uma mistura destes e um tensoativo.

Exemplos do tensoativo incluem tensoativos não-iônicos e aniônicos tais como sabões, alquil aril éteres de polioxietileno [por exemplo, Neugen (nome comercial), E · A142 (nome comercial); fabricado por Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd., Nonal (nome comercial); fabricado por Toho Chemical Industries Co., Ltd.], sais de sulfato de alquila [por exemplo, Emar 10 (nome comercial), Emar 40 (nome comercial); fabricado por Kao Corporation], sais de ácido sulfônico de alquilbenzeno [por exemplo, Neogen (nome comercial), Neogen T (nome comercial); fabricado por Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd., Neoperex; fabricado por Kao Corporation], éteres de polietileno glicol [por exemplo, Nonipol 85 (nome comercial), Nonipol 100 (nome comercial), Nonipol 160 (nome comercial); fabricado por Sanyo Chemical Industries, Ltd.], ésteres de álcool poliídrico [por exemplo, Tween 20 (nome comercial), Tween 80 (nome comercial); fabricado por Kao Corporation], sais de ácido alquilsulfossuccínico [por exemplo, Sanmolin OT20 (nome comercial); fabricado por Sanyo Chemical Industries, Ltd.], sais de ácido sulfônico de alquilnaftaleno [por exemplo, Newcalgen EX70 (nome comercial); fabricado por Takemoto Oil & Fat Co., Ltd.], sais de ácido sulfônico de alquenila [por exemplo, Solpol 5115 (nome comercial); fabricado por Toho Chemical Industries Co., Ltd.] e similares.

A taxa de Composto (I) ou um sal deste contida na preparação do pesticida da presente invenção é geralmente 0,1 a 80% em peso, preferivelmente 1 a 20% em peso com relação à quantidade total de pesticida da presente invenção. Especificamente, quando o composto for usado como uma emulsão, uma solução, um pó umectável ou similar, geralmente cerca de 1 a 80% em peso, preferivelmente cerca de 1 a 20% em peso será adequado. Quando usado como uma solução oleosa ou um pó, geralmente cerca de 0,1 a 50% em peso, preferivelmente cerca de 0,1 a 20% em peso será adequado. Quando usado em um grânulo, geralmente cerca de 5 a 50% em peso, preferivelmente cerca de 1 a 20% em peso será adequado.

O pesticida da presente invenção pode ser usado em mistura com outros inseticidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, herbicidas, regu-

ladores de desenvolvimento de planta, sinérgicos, atraentes, repelentes, protetores, pigmentos, fertilizantes e similares.

Exemplos Representativos dos fungicidas, reguladores de desenvolvimento de planta e herbicidas que podem ser usados misturando-se com o pesticida da presente invenção, e o pesticida e similares tais como inseticidas, acaricidas e nematocidas são mostrados abaixo.

Ingredientes ativos do inseticida incluem, por exemplo,

(1) Compostos fosforosos orgânicos

Acefato, Fosfeto de alumínio, butatiofos, cadusafos, Cloretoxifos, corfenvinfos, Clorpirifos, Clorpirifos-metila, cianofos (CYAP), diazinon, DCIP (éter diclorodiisopropílico), diclofention (ECP), diclorvos (DDVP), dimetoato, dimetilvinfos, dissulfoton, EPN, etion, etoprofos, etrimfos, fention (MPP), fenitrotrion (MEP), fostiazato, formotion, Fosfeto de hidrogênio, isofenfos, isoxatation, malation, mesulfenfos, metidation (DMTP), monocrotofos, naled (BRP), oxidoprofos (ESP), paration, fosadona, fosmet (PMP), pirimifos-metila, piridafention, quinalfos, fentoato (PAP), profenofos, propafos, protiofos, piraclorfos, salition, sulprofos, tebupirinfos, temefos, tetraclorvinfos, terbufos, tiometon, triclorfon (DEP), vamidotion e similares;

(2) Compostos de carbamato

Alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, BPMC, carbaril, carbofuran, carbossulfan, cloetocarb, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxicarb, furatiocarb, isoprocarb (MIPC), metolcarb, metomil, metiocarb, NAC, oxamil, pirimicarb, propoxur (PHC), XMC, tiodicarb, xililcarb e similares;

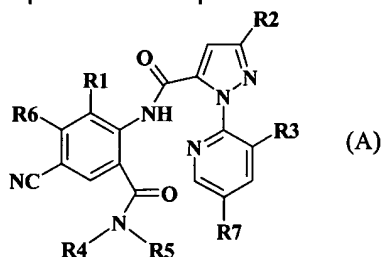
(3) Compostos de piretróide sintéticos

Acrinatrina, aletrina, benflutrina, beta-ciflutrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, permetrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigma-cipermetrina, silafluofen, teflutrina, tralometrina, transflutrina, 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)benzila (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanecarboxilato, 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metilbenzila (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanecarboxilato,

- 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)benzila (1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)ciclopropanocarboxilato e similares;
- (4) Compostos de nereistoxina
Cartap, bensultap, tiociclam, monossultap, bissultap e similares;
- 5 (5) Compostos de neonicotinóide
Imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiametoxam, tiacloprid, dinotefurano, clotianidin e similares;
- (6) Compostos de benzoilureia
Clorfluazuron, bistrifluron, diafentiuron, diflubenzuron, fluazuron,
- 10 flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron e similares;
- (7) Compostos de fenilpirazol
Acetoprol, etiprol, fipronil, vaniliprol, piriprol, pirafluprol e similares;
- 15 (8) Toxinas Bt
Esporos vivos e toxinas cristais produzidas derivadas de *bacillus thuringiensis*, e uma mistura destes;
- (9) Compostos de hidrazina
Cromafenozida, halofenozida, metoxifenoazida, tebufenozida e
- 20 similares;
- (10) Compostos de cloro orgânicos
Aldrina, dieldrina, dienoclor, endossulfan, metoxiclor e similares;
- (11) Inseticidas naturais
Óleo de máquina, sulfato de nicotina e similares;
- 25 (12) Outros inseticidas
Avermectina-B, bromopropilato, buprofezin, Clorfenapir, ciromazina, D-D (1,3-Dicloropropeno), benzoato de emamectina, fenazaquina, flupirazofos, hidropreno, indoxacarb, metoxadiazona, milbemicina-A, pimetozina, piridalila, piriproxifeno, *spinosad*, sulfluramid, tolfenpirad, triazamato, flubendiamida, SI-0009, ciflumetofeno, ácido arsênico, benclotiaz, cianamida cálcica,
- 30 polissulfeto de cálcio, Clordano, DDT, DSP, flufenerim, flonicamid, flurimfen, formetanato, metam-amônio, metam-sódio, brometo de metila, nidinote-

furano, oleato de potássio, protrifenbuto, espiromesifen, enxofre, metaflumizona, espirotetramat, NNI-0101, Clorantraniliprol

O composto representado pela fórmula abaixo:



em que,

- 5 R^1 representa um grupo metila, um átomo de cloro, um átomo de bromo, ou um átomo de flúor,
 R^2 representa um átomo de flúor, um átomo de cloro, um átomo de bromo, um grupo C1-C4 haloalquila ou um grupo C1-C4 haloalcóxi,
 R^3 representa um átomo de flúor, um átomo de cloro, ou um átomo de bromo,
 10 R^4 representa um átomo de hidrogênio, um grupo ciano, um grupo metiltio, um grupo metilsulfonila, um grupo metilsulfonila, ou um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com pelo menos um grupo selecionado do grupo consistindo em grupo metóxi, grupo C3-C4 alquenila, um grupo C3-C4 alquini-
 15 nila e C3-C5 cicloalquila,
 R^5 representa um átomo de hidrogênio, ou um grupo metila,
 R^6 representa um átomo de hidrogênio, um átomo de flúor, ou um átomo de cloro,
 R^7 representa um átomo de hidrogênio, um átomo de flúor, ou um átomo de cloro;
 20 cloro; e similares.

Ingredientes ativos dos acaricidas incluem, por exemplo, acequinocil, amitraz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionato, clorobenzilato, CPCBS (Clorfenson), clofentezina, ciflumetofeno, keltane (dicofol), etoxazol, óxido de fenbutatin, fenotiocarb, fenpiroximato, fluacripirim,
 25 fluproxifeno, hexitiazox, propargita (BPPS), polinactinas, piridabeno, Pirimidifeno, tebufenpirad, tetradifon, espiroclorfen, amido-flumet e similares.

Ingredientes ativos dos nematocidas incluem, por exemplo, DCIP, fostiazato, levamisol, metiisotiocianato, tartarato de morantel e simila-

res.

Ingredientes ativos dos fungicidas incluem, por exemplo, acibenzolar-S-metila, amobam, ampropilfos, anilazina, azoxistrobin, benalaxil, benodanil, benomil, bentiavalicarb, bentiazol, betoxazin, bitertanol, blasticidin-S, mistura de Bordeaux, boscalid, bromuconazol, butiobato, hipoclorito de cálcio, polissulfeto de cálcio, captano, carbendazol, carboxin, carpropamid, clobentiazona, cloroneb, cloropicrin, clorotalonil (TPN), Clortiofos, Cinamaldeído, clozilacon, CNA (2,6-Dicloro-4-nitroanilina), hidróxido de cobre, sulfato de cobre, ciazofamid, ciflufenamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, ciprofuram, dazomet, debacarb, diclofluanid, D-D (1,3-Dicloropropeno), diclocimet, diclomezina, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimefluazol, dimetirimol, dimetomorf, diniconazol-M, dinocap, edifenfos, epoxiconazol, dimetilditiocarbamato de níquel, etaconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, Fendazosulam, fenhexamid, fenoxanil, fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorf, fentiazon, hidróxido de fentin, ferinzona, fluazinam, fludioxonil, flumetover, flumorf, fluoroimida, flutrimazol, fluoxastrobin, fluquinconazol, flusilazol, flussulfamida, flutolanil, flutriafol, fosetil-Al, ftalida, fuberidazol, furalaxil, furametpir, furcarbanil, furconazol-cis, hexaconazol, himexazol, IBP, imazalil, imibenconazol, iminoctadinalbesilato, iminoctadina-triacetato, iodocarb, ipconazol, iprodiona, iprovalicarb, isoprotiolano, casugamicina, cresoxim-metila, mancozeb, maneb, mepanipirim, mepronil, metalaxil, metalaxil-M, metam-sódico, metassulfocarb, brometo de metila, metconazol, metfuroxam, metominostrobin, metrafenona, metsulfovax, mildiomicina, milneb, miclobutanil, miclozolin, nabam, ou isastrobin, ofurace, oxadixila, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxin, oxitetraciclina, pefurazoato, penconazol, pencicuron, picoxistrobin, policarbamato, polioxin, hidrogenocarbonato de potássio, probenazol, procloraz, procimidon, propamocarb-hidrocloreto, propiconazol, propineb, proquinazid, protiocarb, protioconazol, piracarbolid, piraclostrobin, pirazofos, piributicarb, pirifenox, pirimetanil, piroquilon, quinoxifeno, quintozeno(PCNB), siltiofam, simeconazol, sipconazol, bicarbonato de sódio, hipoclorito de sódio, espiroxamina, ((E)-2[2-(2,5-dimetilfenoximetil)fenil]-2-metoxiimino-N-metilacetamida),

estreptomicina, enxofre, tebuconazol, tecloftalam, tetraconazol, tiabendazol, tiadinila, tiram (TMTD), tifluzamida, tiofanato-metila, tolclofos-metila, TPN, triadimefon, triadimenol, triazóxido, triclâmida, triciclazol, tridemorf, triflumi-
 5 zol, trifloxistrobin, triforina, triticonazol, validamicina, vinclozolin, viniconazol, zineb, ziram e zoxamida.

Ingredientes ativos dos herbicidas e reguladores de desenvolvi-
 mento de planta incluem, por exemplo, ácido abscísico, acetoclor, acifluor-
 fen-sódico, alaclor, aloxidim, ametrin, amicarbazona, amidossulfuron, amino-
 etoxivinilglicina, aminopiraldil, AC94, 377, amiprofos-metila, ancimidol, asu-
 10 lam, atrazina, aviglicina, azinsulfuron, beflubutamid, benfluralin, benfuresato,
 bensulfuron-metila, bensulida (SAP), bentazona, bentiocarb, benzamizol,
 benzfendizona, benzobiciclôn, benzofenap, adenina de benzila, benzilami-
 nopurina, bialafos, bifenox, brassinólida, bromacil, bromobutida, butaclor,
 butafenacil, butamifos, butilato, cafenstrol, carbonato de cálcio, peróxido de
 15 cálcio, carbaril, clometoxinil, cloridazon, clorimuron-etila, clorftalim, clorpro-
 fam, clorsulfuron, clortal-dimetila, clortiamid (DCBN), cloreto de colina, cini-
 don-etila, cinmetilin, cinossulfuron, cletodim, clomeprop, cloxifonac-sódico,
 cloreto de cloromequat, 4-CPA (ácido 4-clorofenoxiacético), cliprop, clofencet,
 cumiluron, cianazina, ciclânilda, ciclossulfamron, cihalofop-butila, sais de
 20 ácido 2,4-diclorofenoxiacético, diclorprop (2,4-DP), daimuron, dalapon
 (DPA), dimetenamid-P, daminozida, dazomet, álcool n-decílico, dicamba-
 sódico (MDBA), diclobenil (DBN), diflufenican, dicegulac, dimepiperato, di-
 metametrina, dimetenamid, diquat, ditiopir, diuron, endotal, epocoleona, es-
 procarb, etefon, etidimuron, etoxissulfuron, eticlozato, etobenzanid, fenari-
 25 mol, fenoxaprop-etila, fentrazamida, flazasulfuron, florassulam, fluazifop-
 butila, fluazolato, flucarbazona, flufenacet, flufenpir, flumetralina), flumioxa-
 zin, flupropanato-sódico, flupirsulfuron-metil-sódico, flurprimidol, flutiacet-
 metila, foransulfuron, forclorfenuron, formesafen, gibberellin, glufosinato, gli-
 fosato, halossulfuron-metila, hexazinona, imazamox, imazapic, imazapir, i-
 30 mazaquin, imazossulfuron, inabenfida, ácido acético de indol (IAA), ácido
 butírico de indol, iodossulfuron, ioxinil-octanoato, isouron, isoxaclortol, isoxa-
 difen, carbutilato, lactofeno, lenacil, linuron, LGC-42153, hidrazida maleica,

mecoprop (MCP), sais de ácido 2-metil-4-clorofenoxiacético, MCPA-tioetila, éster etílico de ácido 2-metil-4-clorofenoxibutanóico, mefenacet, mefluidida, mepiquat, mesossulfuron, mesotriona, metil daimuron, metamifop, metolaclor, metribuzin, metsulfuron-metila, molinato, ácido naftilacético, 1-naftalenoacetamida, naproanilida, napropamida, álcool n-decílico, nicossulfuron, ácido n-fenilftalâmico, ou bencarb, oxadiazon, oxaziclomefona, oxinasulfato, paclobutrazol, paraquat, ácido pelargônico, pendimetalin, penoxsulam, pentoxazona, petoxamida, fenmedifam, picloram, picolinafen, butóxido de piperonila, piperofos, pretilaclor, primissulfuron-metila, procarbazona, prodiamina, profluazol, profoxidim, proexadiona-cálcio, proidrojasmon, prometrina, propanil, propoxicarbazona, propizamida, piraclonil, piraflufen-etila, pirazolato, pirazossulfuron-etila, pirazoxifeno, piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, piriftalid, piriminobac-metila, piritiobac, quiclorac, quinoclamina, quizalofop-etila, rinsulfuron, setoxidim, siduron, simazina, simetrina, clorato de sódio, sulfossulfuron, swep (MCC), tebutiuron, tepraloxidim, terbacil, terbucarb (MBPMC), tenilclor, tiazafluron, tidiazuron, tifensulfuron-metila, triaziflam, tribufos, triclopir, tridifano, trifloxissulfuron, trifluralin, trinexapacetila, tritossulfuron, uniconazol-P e vemolato (PPTC).

O pesticida da presente invenção pode também ser usado em mistura com um sinérgico tal como butóxido de piperonil, sesamex, N-(2-etilexil)-8,9,10-trinorborn-5-en-2,3-dicarboxiimida (MGK 264), antirresistente ao WARF e dietilmaleato, e além disso, pode ser usado em mistura com um protetor tal como benoxacor, cloquintocet-mexila, ciometrinila, daimuron, diclormid, fenclorazol-etila, fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, mefenpirdietila, MG191, anidrido naftálico e oxabetrinila.

Exemplos da peste contra a qual o composto (I) ou um sal deste tem uma atividade, incluem artrópodos tais como pestes de inseto, pestes acarinas e similares, e pestes de nematódeos. Exemplos específicos são listados abaixo:

Hemiptera: Delphacidae tal como *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Sogatella furcifera* e similares; *Deltocephalidae* tal como *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix virescens* e similares; *Aphididae* tal como

Aphis gossypii, *Myzus persicae*, *Brevicoryne brassicae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Aulacorthum solani*, *Rhopalosiphum padi*, *Toxoptera citricidus* e similares; *Pentatomidae* tal como *Nezara antennata*, *Riptortus clavetus*, *Leptocoris chinensis*, *Eysarcoris parvus*, *Halyomorfa mista* e similares; *Aleyrodidae* tal como *Trialeurodes vaporariorum*, *Bemisia argentifolii* e similares; *Coccidae* tal como *Aonidiella aurantii*, *Comstockaspis perniciosa*, *Unaspis citri*, *Ceroplastes rubens*, *Icerya purchasi* e similares; *Tingidae*, *Psyllidae*, e similares.

Lepidoptera: *Piraliidae* tal como *Chilo suppressalis*, *Tryporyza incertulas*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Notarcha derogata*, *Plodia interpunctella*, *Ostrinia furnacalis*, *Hellula undalis*, *Pediasia teterrellus* e similares; *Noctuidae* tal como *Spodoptera litura*, *Spodoptera exigua*, *Pseudaletia separata*, *Mamestra brassicae*, *Agrotis ipsilon*, *Plusia nigrisigna*, *Thoricoplusia spp.*, *Heliothis spp.*, *Helicoverpa spp.*, e similares; *Pieridae* tal como *Pieris rapae* e similares; *Tortricidae* tal como *Adoxophyes spp.*, *Grapholita molesta*, *Leguminivora glycinivorella*, *Matsumuraeses azukivora*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Adoxophyes sp.*, *Homona magnanima*, *Archips fuscocupreanus*, *Cydia pomonella* e similares; *Gracillariidae* tal como *Caloptilia theivora*, *Phyllonorycter ringoneella* e similares; *Carposinidae* tal como *Carposina niponensis* e similares; *Lyonetiidae* tal como *Lyonetia spp.* e similares; *Lymantriidae* tal como *Lymantria spp.*, *Euproctis spp.*, e similares; *Yponomeutidae* tal como *Plutella xylostella* e similares; *Gelechiidae* tal como *Pectinophora gossypiella*, *Fthorimaea operculella* e similares; *Arctiidae* tal como *Hyphantria cunea* e similares; *Tineidae* tal como *Tinea translucens*, *Tineola bisselliella* e similares.

Thysanoptera: *Thripidae* tal como *Frankliniella occidentalis*, *Thrips parvi*, *Scirtothrips dorsalis*, *Thrips tabaci*, *Frankliniella intonsa* e similares.

Diptera: *Musca domestica*, *Culex popiens palens*, *Tabanus trigonus*, *Hylemya antiqua*, *Hylemya platura*, *Anopheles sinensis*, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Clorops oryzae*, *Dacus cucurbitae*, *Ceratitis capitata*, *Liriomyza trifolii* e similares.

Coleoptera: *Epilachna vigintioctopunctata*, *Aulacophora femoralis*, *Phyllotreta striolata*, *Oulema oryzae*, *Echinocnemus squameus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Anthonomus grandis*, *Callosobruchus chinensis*, *Sphenophorus venatus*, *Popillia japonica*, *Anomala cuprea*, *Diabrotica* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Agriotes* spp., *Lasioderma serricorne*, *Anthrenus verbasci*, *Tribolium castaneum*, *Lyctus brunneus*, *Anoplophora malasiaca*, *Tomiscus piniperda* e similares.

Orthoptera: *Locusta migratoria*, *Grillotalpa africana*, *Oxia yezoensis*, *Oxia japonica* e similares.

10 Hymenoptera: *Athalia rosae*, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp. e similares.

Nematódeo: *Afelenchoides besseyi*, *Nothotylenchus acris* e similares.

15 Blattodea: *Blattella germanica*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Blatta orientalis* e similares.

Acarina: Tetranychidae tal como *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri*, *Oligonychus* spp., e similares; Eriophyidae tal como *Aculops pelekassi* e similares; Tarsonemidae tal como *Polyphagotarsonemus latus* e similares; Tenuipalpidae; Tuckerellidae; Ixodidae tal como *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Dermacentor taiwanicus*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus sanguineus* e similares; Acaridae tal como *Tyrophagus putrescentiae* e similares; Epidermoptidae tal como *Dermatophagoides farinae*, *Dermatophagoides pteromyssus* e similares; Cheyletidae tal como *Cheyletus eruditus*, *Cheyletus malaccensis*, *Cheyletus moorei* e similares; e Dermatyssidae e similares.

30 Isoptera: Mastotermitidae, Termopsidae [*Zootermopsis*, *Archotermopsis*, *Hodotermopsis*, *Porotermes*, *Stolotermes*], Kalotermitidae [*Kalotermes*, *Neotermes*, *Cryptotermes*, *Incisternus*, *Glyptotermes*], Hodotermitidae [*Hodotermes*, *Microhodotermes*, *Anacanthotermes*], Rhinotermitidae [*Reticulitermes*, *Heterotermes*, *Coptotermes*, *Schedolinotermes*], Serritermitidae, Termitidae (*Amitermes*, *Drepanotermes*, *Hopitalitermes*, *Trinervitermes*, *Macrotermes*, *Odontotermes*, *Microtermes*, *Nasutitermes*, *Pericapritermes*).

mes, *Anoplotermes*);

Especificamente, por exemplo, *Reticulitermes speratus*, *Coptotermes formosanus*, *Incisitermes minor*, *Cryptotermes domesticus*, *Odontotermes formosanus*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes satsumensis*,
 5 *Glyptotermes nakajimai*, *Glyptotermes fuscus*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes kushimensis*, *Hodotermopsis japonica*, *Coptotermes guangzhouensis*, *Reticulitermes miyatakei*, *Reticulitermes flaviceps amamianus*, *Reticulitermes sp.*, *Nasutitermes takasagoensis*, *Pericapritermes nitobei*, *Sinocapritermes mushae*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes tibialis*, *Heterotermes aureus*, *Zootermopsis nevadensis* e similares;

Beetles: *Lyctidae*, *Bostrychidae*, *Anobiidae*, *Cerambycidae* e similares.

O método para controlar pestes da presente invenção é realizado aplicando-se o composto (I) ou um sal deste às pestes diretamente, ou
 15 nos *habitats* das pestes.

No método para controlar pestes da presente invenção, o composto (I) ou um sal deste pode ser usado no estado em que se encontra, porém geralmente, uma preparação de composto (I) ou um sal deste, ou
 20 uma diluição aquosa da preparação é usada.

Exemplos do *habitat* das pestes na presente invenção incluem campos alagados, campos de arroz seco, campos, plantações de chá, ou
 acelgas, campos não cultivados, residências, bandejas de cultivo de muda, caixas sementeiras, meios de cultivo de muda, esteiras de cultivo de muda,
 25 meios de cultura em água para cultivo hidropônico, e similares.

Como um método para aplicação, por exemplo, um tratamento por *spray*, um tratamento de solo, um tratamento de semente e um tratamento de solução hidropônica são exemplificados.

O tratamento por *spray* na presente invenção é um método de
 30 tratamento para expressar um efeito no controle contra pestes por tratamento da superfície da planta ou da peste propriamente dita com um ingrediente ativo (composto (I) ou um sal deste), especificamente por exemplo, aplica-

ção a folhagem, vaporização ao tronco da árvore e similares. O tratamento do solo é um método de tratamento para proteger colheitas de danos por pestes, por tratamento dos solos, meios de cultivo, soluções de irrigação ou similar com um ingrediente ativo a fim de penetrar e translocar da porção de

5 raiz e similares no interior da planta de uma colheita a ser protegida de danos tal como alimentação e similares por pestes, e especificamente, por exemplo, um tratamento do buraco de plantação (vaporização do buraco de plantação, incorporação de terra após o tratamento do buraco de plantação), um tratamento do pé da planta (vaporização do pé da planta, incorporação

10 de terra no pé da planta, irrigação no pé da planta, tratamento do pé da planta na última metade do período de semeadura do cultivo), tratamento do sulco de plantação (vaporização do sulco de plantação, incorporação de terra ao sulco de plantação), tratamento da sequencia de plantação (vaporização da sequencia de plantação, incorporação de terra na sequencia de plan-

15 tação, vaporização da sequencia de plantação em período de desenvolvimento), tratamento da sequencia de plantação em semeadura (vaporização da sequencia de plantação em semeadura, incorporação de terra na sequencia de plantação em semeadura), tratamento geral (vaporização geral, incorporação de terra total), outro tratamento por vaporização (vaporização

20 de grânulo folhear em período de crescimento, vaporização sob a coroa da árvore ou em torno do tronco principal, vaporização da superfície do solo, incorporação da superfície do solo, vaporização do buraco de semeadura, vaporização sobre o solo com nervação, vaporização inter-planta), outro tratamento de irrigação (irrigação no solo, irrigação durante o crescimento da

25 semente, tratamento por injeção de solução pesticida, irrigação no pé da planta, irrigação por gotejamento de solução pesticida, chemigação), tratamento de caixa sementeira (vaporização caixa sementeira, irrigação de caixa sementeira), tratamento de bandeja sementeira (vaporização de bandeja sementeira, irrigação de bandeja sementeira), tratamento de leito sementeiro

30 (vaporização de leito sementeiro, irrigação de leito sementeiro, vaporização de leito sementeiro em campo alagado, imersão de planta sementeira), tratamento de incorporação de terra de leito de semente (incorporação de terra

de leito de semente, incorporação de terra de leito de semente antes da semeadura), outro tratamento (incorporação de meios de crescimento, arado, incorporação de terra de superfície, incorporação de terra em gotejamento de chuva, tratamento no sítio de plantação, vaporização de grânulo no cacho da flor, mistura fertilizante em pasta), e similares são exemplificados. O tratamento da semente é um método de tratamento para expressar um efeito no controle contra pestes por tratamento das sementes, tubérculos de semente, bulbos ou similares de uma colheita a ser protegida de danos tais como alimentação e similares por pestes diretamente, ou vizinhança desta, com um ingrediente ativo, e especificamente, por exemplo, tratamento por sopro, tratamento por pintura, tratamento por imersão, tratamento por impregnação, tratamento por aplicação, revestimento de película e um tratamento de revestimento de pélete são exemplificados. O tratamento da solução hidropônica é um método de tratamento para proteger as colheitas de danos por pestes, tratando a solução hidropônica ou similar com um ingrediente ativo a fim de penetrar e translocar da porção de raiz e similares para o interior da planta de uma colheita a ser protegida de danos tais como alimentação e similares por pestes, e especificamente, por exemplo, incorporação de solução hidropônica, mistura de solução hidropônica, e similares são exemplificados.

A quantidade de aplicação do composto (I) ou um sal deste no método para controlar pestes na presente invenção pode ser alterada dependendo do tempo de aplicação, local de aplicação, método de aplicação e similares, porém em geral, é em uma taxa de 0,3 a 3000 g, preferivelmente em uma taxa de 50 a 3000 g como uma quantidade do ingrediente ativo (composto (I) ou um sal destes) por hectare. Além disso, quando o pesticida da presente invenção for um pó umectável ou similar, ele pode ser diluído com água para uso de modo que a concentração final do ingrediente ativo atinja a faixa de cerca de 0,1 a 1.000 ppm, preferivelmente cerca de 10 a 500 ppm.

A seguir, a presente invenção será também ilustrada pelos seguintes Exemplos de Produção, Exemplos, Exemplos de Preparação, Exem-

plos Teste e similares, entretanto, a presente invenção não está limitada a estes exemplos.

A eluição na cromatografia de coluna para Exemplos de Produção, Exemplos e Exemplos de Produção de Referência foi realizada sob a observação por TLC (Cromatografia de Camada Fina). Na observação por TLC, kieselgel 60F₂₅₄ fabricado por Merck & Co., Inc. foi usado como placa de TLC; o solvente usado como um solvente de eluição em cromatografia de coluna foi usado como solvente de desenvolvimento; e um detector de UV foi usado para detecção. Kieselgel 60 (70 a 230 malhas) fabricado por Merck & Co., Inc. foi usado como sílica-gel para cromatografia de coluna. Como uma cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média, Ultrapack fabricado por Yamazen, Co., Ltd. (carga: sílica-gel) tem sido usado. Quando um solvente misto foi usado como um solvente de desenvolvimento, o valor numérico em parênteses mostrou uma relação de mistura de solventes por volume. Espectros de RMN foram RMN de próton, e foram determinados com espectrômetro JEOL AL-400 (400 MHz) e espectrômetro AVANCE 400 (400 MHz) empregando-se tetrametilsilano como padrão interno. Todos os valores delta foram mostrados em ppm. A temperatura de medição é 25°C a menos que de outra maneira mencionado, e a temperatura de medição foi indicada para o repouso.

Além disso, as abreviações usadas nos seguintes Exemplos de Produção e Exemplos têm os seguintes significados:

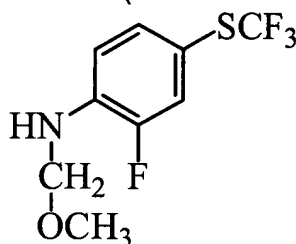
s: singleto, br: amplo, brs: singleto amplo, d: dubleto, t: tripleto, q: quarteto, Me: grupo metila, Et: grupo etila, Ph: grupo fenila, Pr-n (ou n-Pr): n-propila, Pr-i (ou i-Pr ou ¹Pr): isopropila, Pr-ciclo (ou ciclo-Pr): ciclopropila, Bu-n (ou n-Bu): n-butila, Bu-i (ou i-Bu): isobutila, Bu-s (ou s-Bu): sec-butila, Bu-t (ou t-Bu): terc-butila. Além disso, a temperatura ambiente significa cerca de 15 a 25°C.

Exemplo de Produção 1

2-Flúor-4-(trifluorometiltio)anilina (20,0 g), uma solução de metilato de sódio-metanol a 28% (91,0 g) e metanol (50 mL) foram misturados, e suspensão de metanol (100 mL) de paraformaldeído (4,0 g) (conteúdo: 90%

em peso) foi adicionada a eles, e agitada durante 6 horas em temperatura ambiente. A mistura reacional foi vertida em água gelada (300 mL), e filtrada sob pressão reduzida. O sólido branco obtido foi secado sob pressão reduzida para fornecer 21,1 g de 2-flúor-N-metoximetil-4-(trifluorometiltio)anilina.

5 2-Flúor-N-metoximetil-4-(trifluorometiltio)anilina

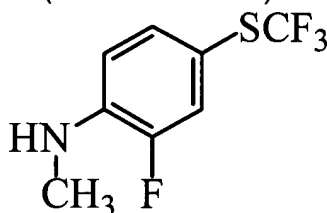


^1H -RMN (CDCl_3) δ : 3,33 (3H, s), 4,69 - 4,71 (2H, m), 5,10 - 5,25 (1H, br), 6,94 - 6,96 (1H, m), 7,26 - 7,32 (2H, m)

Exemplo de Produção 2

2-Flúor-N-metoximetil-4-(trifluorometiltio)anilina (2,00 g) foi dissolvido em etanol (35 mL), e boroidreto de sódio (0,70 g) (conteúdo; 90% em peso) foi adicionado a ele, e aquecido sob refluxo durante 30 minutos. A mistura reacional resfriada para a temperatura ambiente foi concentrada sob pressão reduzida, e água (50 mL) e hexano (50 mL) foram adicionados a ela e separadas as camadas. A camada orgânica foi lavada com água (50 mL), secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 1,58 g de 2-flúor-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina.

2-Flúor-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina



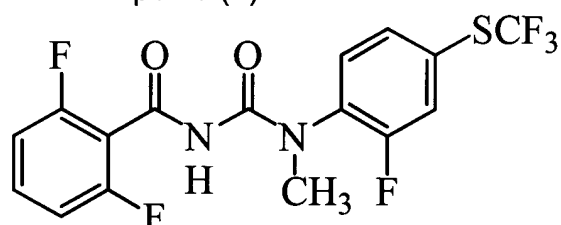
^1H -RMN(CDCl_3) δ (ppm): 2,91 (3H,m), 4,27 (1H,br), 6,62 - 6,67 (1H, m), 7,23 - 7,33 (2H, m).

20 Exemplo 1

Uma solução na qual 0,83 g de 2,6-difluorobenzoilisocianato foi dissolvido em 1,0 mL de éter dietílico sob resfriamento foi adicionada a uma solução de 1,02 g de 2-flúor-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina em 4,0 mL de éter dietílico a 3°C, e agitada durante 2 horas em temperatura ambiente. A

uma mistura reacional foi adicionado hexano (10 mL), filtrada, e a massa filtrante foi secada para fornecer 1,58 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (1)).

5 O presente composto (1)



^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,23 (3H,s), 7,10 - 7,14 (2H, m), 7,48 - 7,62 (3H,m), 7,75 - 7,77 (1H, m), 10,90 (1H, brs)

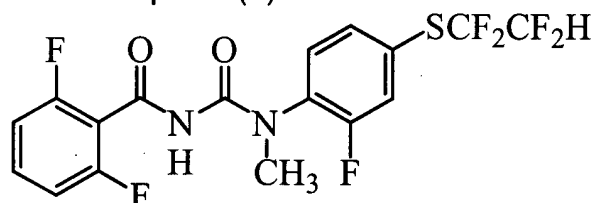
Exemplos 2 e 3

Da mesma maneira como no Exemplo 1, os seguintes compostos foram produzidos.

Exemplo 2

3-(2,6-Difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (2)).

O presente composto (2)

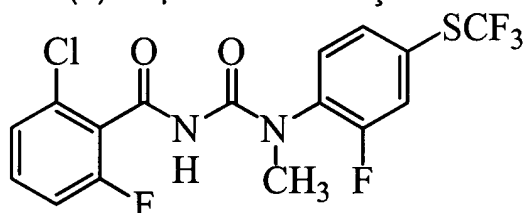


15 ^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,23 (3H,s), 6,57 - 6,85 (1H, m), 7,09 - 7,15 (2H, m), 7,46 - 7,56 (3H,m), 7,65 - 7,68 (1H, m), 10,86 (1H, brs).

Exemplo 3

3-(2-Cloro-6-fluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o composto (3) da presente invenção).

20 O composto (3) da presente invenção

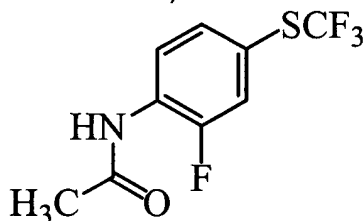


^1H -RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,23 (3H,s), 7,26 - 7,28 (1H, m), 7,32 - 7,34 (1H, m), 7,42 - 7,46 (1H, m), 7,57 - 7,61 (2H, m), 7,76 - 7,78 (1H, m), 10,92 (1H, brs).

Exemplo de Produção 3

- 5 A uma solução de 2-flúor-4-(trifluorometiltio)anilina (5,00 g) em piridina (20 mL) foi adicionado gota a gota cloreto de acetila (2,0 mL) sob resfriamento, e agitado a 3 °C durante 30 minutos. A uma mistura reacional foram adicionados água (50 mL) e acetato de etila (50 mL), e as camadas separadas. A camada orgânica foi lavada sequencialmente com ácido clorídrico a 7% (50 mL), água (50 mL) e uma solução salina saturada (50 mL),
10 secada sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi recristalizado de acetato de etila-hexano para fornecer 3,27 g de 2-flúor-4-(trifluorometiltio)acetanilida.

2-Flúor-4-(trifluorometiltio)acetanilida



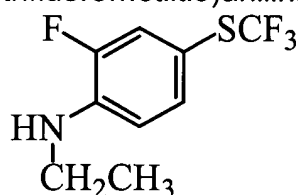
- 15 ^1H -RMN(CDCl_3) δ (ppm): 2,14 (3H,s), 7,51 - 7,53 (1H, m), 7,66 - 7,69 (1H, m), 8,17 - 8,22 (1H, m), 10,02 (1H, brs)

Exemplo de Produção 4

- A uma solução de 2-flúor-4-(trifluorometiltio)acetanilida (1,50 g) em dimetilsulfóxido (30 mL) foi adicionado 0,35 g de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitado em temperatura ambiente durante 30 minutos. A ela 0,98 mL de iodoetano foi adicionado, e a mistura foi agitada durante 30 minutos. A mistura reacional foi vertida em 50 mL de água gelada e em seguida extraída com 50 mL de acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com 50 mL de solução de salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi dissolvido em 40 mL de metanol, e a ele 20 mL de ácido clorídrico a 35% foram adicionados. A mistura foi aquecida em refluxo durante 8 horas. A mistura reacional foi deixada resfriar para a temperatura ambiente,

vertida em uma mistura de uma solução aquosa de hidróxido de sódio a 20% em peso e 50 g de gelo, e em seguida extraída com 100 mL de clorofórmio. A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila:hexano = 1:5) para fornecer 1,13 g de N-etil-2-flúor-4-(trifluorometiltio)anilina.

N-etil-2-flúor-4-(trifluorometiltio)anilina

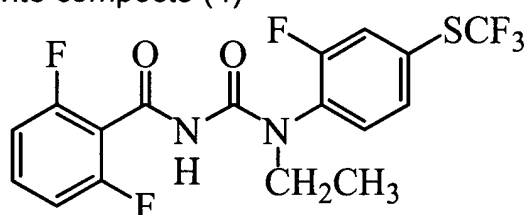


^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 1,27 (3H, t, $J = 8,0$ Hz), 1,60 (1H, br), 3,20 (2H, q, $J = 8,0$ Hz), 6,61 - 6,66 (1H, m), 7,20 - 7,28 (2H, m).

Exemplo 4

Uma solução de 0,86 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 1,0 mL de éter dietílico preparada sob resfriamento foi adicionada a 3°C a uma solução de 1,13 g de N-etil-2-flúor-4-(trifluorometiltio)anilina em 9,0 mL de éter dietílico, e em seguida agitada em temperatura ambiente durante duas horas. A mistura reacional foi filtrada, e a massa filtrante foi secada para fornecer 1,67 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-etil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia (a seguir, referido como o presente composto (4)).

O presente composto (4)



^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 1,04 (3H, t, $J = 6,8$ Hz), 3,67 (2H, q, $J = 6,8$ Hz), 7,08 - 7,13 (2H, m), 7,45 - 7,55 (2H, m), 7,60 - 7,62 (1H, m), 7,75 - 7,77 (1H, m), 10,81 (1H, brs).

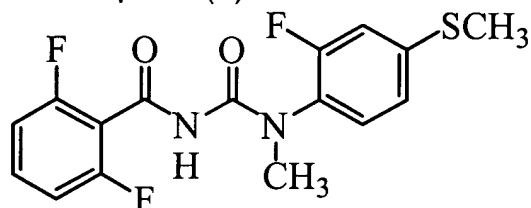
Exemplos 5-9

Da mesma maneira como no Exemplo 4, os seguintes compostos foram produzidos.

Exemplo 5

3-(2,6-Difluorobenzoil)-1-(2-flúor-4-metiltiofenil)-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (5)).

O presente composto (5)

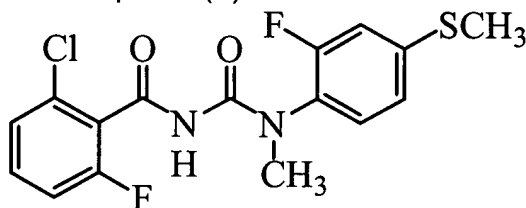


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 2,52 (3H,s), 3,20 (3H,s), 6,91 - 6,98 (2H, m), 7,07 - 7,12 (2H, m), 7,19 - 7,26 (1H, m), 7,34 - 7,43 (1H, m), 7,59 (1H, brs).

Exemplo 6

3-(2-Cloro-6-fluorobenzoil)-1-(2-flúor-4-metiltiofenil)-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (6)).

O presente composto (6)

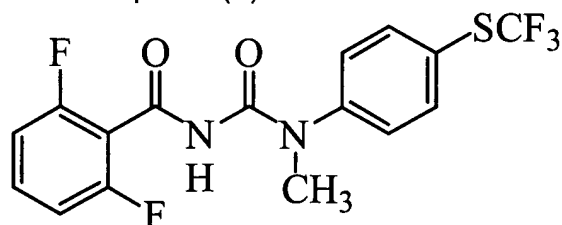


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 2,53 (3H,s), 3,19 (3H,s), 7,02 - 7,13 (3H,m), 7,19 - 7,25 (2H, m), 7,29 - 7,37 (1H, m), 7,60 (1H, brs).

Exemplo 7

3-(2,6-Difluorobenzoil)-1-[4-(trifluorometiltio) fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (7)).

O presente composto (7)

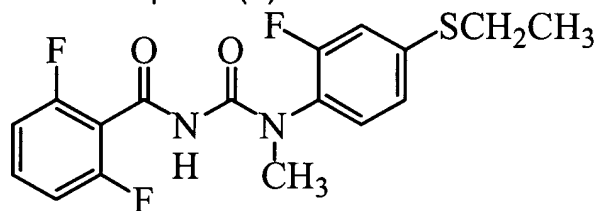


¹H-RMN (DMSO-d₆) δ (ppm): 3,22 (3H,s), 7,13 - 7,18 (2H, m), 7,43 - 7,55 (3H,m), 7,73 - 7,76 (2H, m), 10,84 (1H, brs).

Exemplo 8

3-(2,6-Difluorobenzoil)-1-(2-flúor-4-etiltiofenil)-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (8)).

O presente composto (8)

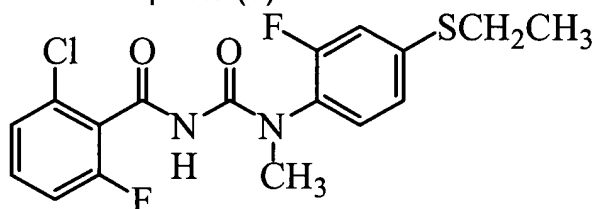


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 1,27 (3H, t, J = 7,2 Hz), 3,01 (2H, q, J = 7,2 Hz), 3,17 (3H,s), 7,03 - 7,11 (2H, m), 7,12 - 7,16 (1H, m), 7,19 - 7,23 (1H, m), 7,24 - 7,30 (1H, m), 7,42 - 7,51 (1H, m), 10,35 (1H, brs).

Exemplo 9

3-(2-Cloro-6-fluorobenzoyl)-1-(2-fluor-4-etiltiofenil)-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (9)).

O presente composto (9)



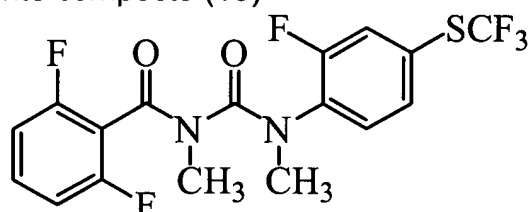
¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 1,27 (3H, t, J = 7,3 Hz), 3,01 (2H, q, J = 7,3 Hz), 3,16 (3H,s), 7,11 - 7,16 (1H, m), 7,16 - 7,23 (2H, m), 7,25 - 7,30 (2H, m), 7,38 - 7,45 (2H, m), 10,37 (1H, brs).

Exemplo 10

A uma solução de 0,50 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-fluor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 5,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 59 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo) a 3°C. A mistura foi agitada a 3°C durante 30 minutos, e a ela 0,18 mL de iodeto de metila foi adicionado a 4°C. A mistura reacional foi agitada em temperatura ambiente durante quatro horas, e a ela uma mistura de 5 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 5 mL de água foi adicionada sob resfriamento. A mistura foi em seguida extraída com 10 mL de acetato de etila três vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução salina saturada três vezes, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho ele-

vado preparativa de pressão média (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 15: 15: 70) para fornecer 0,41 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (10)).

5 O presente composto (10)



^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,07 (3H, brs), 3,26 (3H, brs), 7,12 - 7,16 (2H, m), 7,30 - 7,78 (4H,m).

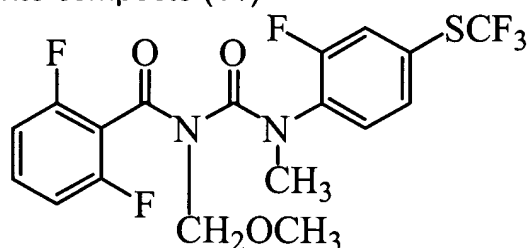
Exemplos 11-15

Da mesma maneira como no Exemplo 10, os seguintes compostos foram produzidos.

Exemplo 11

1-(2,6-Difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(metoximetil)-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (11)).

15 O presente composto (11)

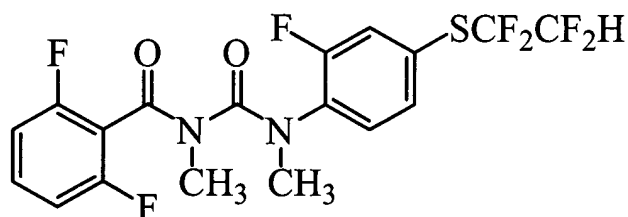


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,38 (6H,m), 4,87 (2H,br), 6,84 - 6,88 (2H, m), 7,31 - 7,52 (4H,m).

Exemplo 12

1-(2,6-Difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (12)).

O presente composto (12)

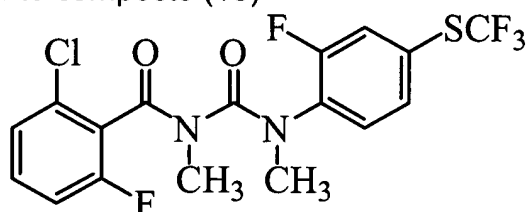


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,09 (3H,s), 3,34 (3H,br), 5,67 - 5,94 (1H, m), 6,8 - 6,9(2H, m), 7,34 - 7,37 (1H, m), 7,42 - 7,48 (3H,m).

Exemplo 13

- 1-(2-Cloro-6-difluorobenzoyl)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-
5 1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (13)).

O presente composto (13)

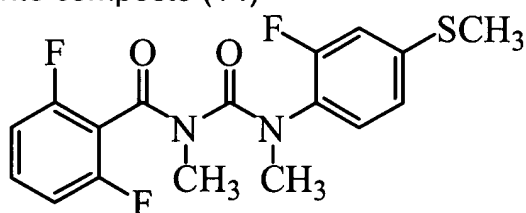


^1H -RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 3,00 (3H,br), 3,05 (3H,s), 7,20 - 7,24 (1H, m), 7,31 - 7,34 (1H, m), 7,45 - 7,58 (3H,m), 7,67 - 7,70 (1H, m).

Exemplo 14

- 10 1-(2,6-Difluorobenzoyl)-3-(2-flúor-4-metiltiofenil)-1,3-dimetilureia
(a seguir, referido como o presente composto (14)).

O presente composto (14)

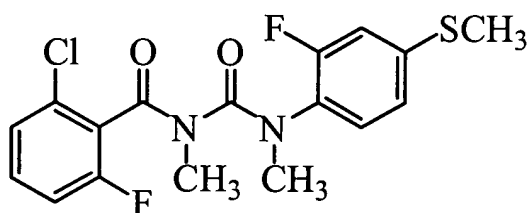


^1H -RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,48 (3H,s), 3,04 (3H,s), 3,26 (3H, brs), 6,77 - 7,24 (5H,m), 7,29 - 7,41 (1H, m).

15 Exemplo 15

- 1-(2-Cloro-6-fluorobenzoyl)-3-(2-flúor-4-metiltiofenil)-1,3-
dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (15)).

O presente composto (15)

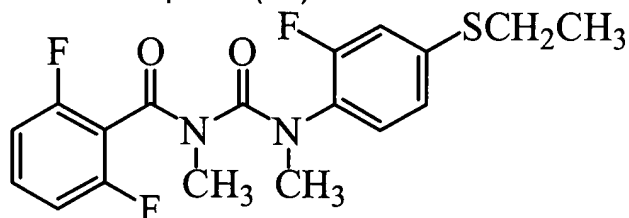


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 2,49 (3H,s), 2,95 (3H, brs), 3,23 (3H,s), 7,08 - 7,13 (1H, m), 7,17 - 7,35 (4H,m), 7,43 - 7,51 (1H, m).

Exemplo 16

- 5 1-(2,6-Difluorobenzoyl)-3-(2-flúor-4-etiltiofenil)-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (16)).

O presente composto (16)

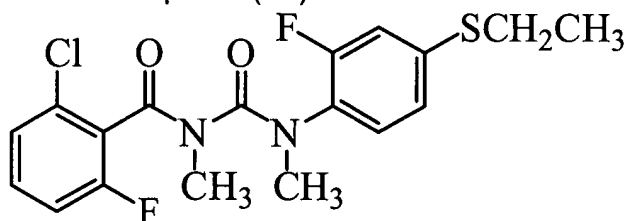


- ^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 1,26 (3H, t, J = 7,4 Hz), 3,01 (2H, q, J = 7,4 Hz), 3,02 (3H,s), 3,20 (3H,s), 7,06 - 7,17 (4H,m), 7,19 - 7,25 (1H, m), 7,47 - 7,56 (1H, m).
- 10

Exemplo 17

1-(2-Cloro-6-fluorobenzoyl)-3-(2-flúor-4-etiltiofenil)-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (17)).

O presente composto (17)



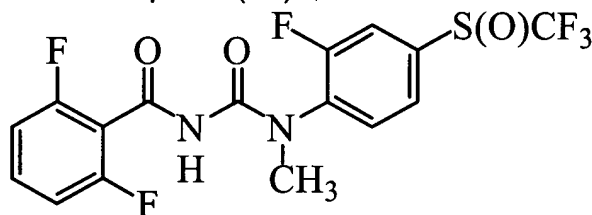
- 15 ^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 1,27 (3H, t, J = 7,3 Hz), 2,96 (3H, brs), 3,01 (2H, q, J = 7,3Hz), 3,24 (3H,s), 7,11 - 7,16 (1H, m), 7,19 - 7,29 (3H,m), 7,31 (1H,d, J = 8,2 Hz), 7,43 - 7,50 (1H, m).

Exemplo 18

- A uma solução de 1,0 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 10 mL de clorofórmio foi adicionado
- 20

0,65 g de ácido meta-cloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso) sob resfriamento, agitada durante uma hora sob resfriamento, e em seguida deixada em temperatura ambiente durante 72 horas. A uma mistura reacional foram adicionados 10 mL de clorofórmio, e a mistura foi lavada três vezes com 20 mL de um hidrogenocarbonato de sódio saturado. As camadas orgânicas foram combinadas, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 33: 67) para fornecer 0,44 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometilsulfinil)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (18)).

O presente composto (18)



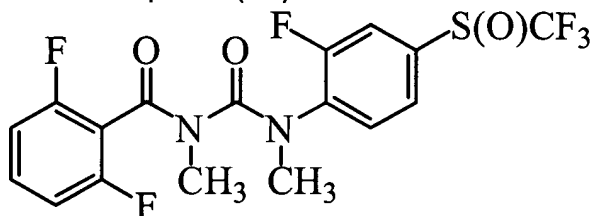
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,31 (3H,s), 6,92 - 6,96 (2H, m), 7,38 - 7,41 (1H, m), 7,61 - 7,71 (3H,m), 8,00 - 8,30 (1H, m).

Exemplo 19

Da mesma maneira como no Exemplo 18, o seguinte composto foi produzido.

1-(2,6-Difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometilsulfinil)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (19)).

O presente composto (19)



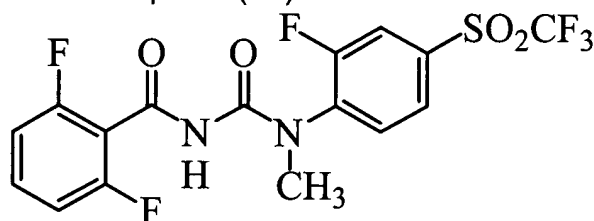
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,12 (3H,s), 3,40 (3H,br), 6,80 - 6,90 (2H,br), 7,33 - 7,37 (1H, m), 7,53 - 7,54 (2H, m), 7,65 - 7,67 (1H, m).

Exemplo 20

A uma solução de 1,0 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-

(trifluorometilsulfinil)fenil]-1-metilureia em 20 mL de clorofórmio foi adicionado 1,6 g de ácido meta-cloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso) sob resfriamento, agitada durante uma hora sob resfriamento, e em seguida deixada em temperatura ambiente durante 72 horas. A uma mistura reacional foram adicionados 20 mL de clorofórmio, e a mistura lavada três vezes com 40 mL de uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturado. As camadas orgânicas foram combinadas, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 33: 67) para fornecer 0,55 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometilsulfinil)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (20)).

O presente composto (20)



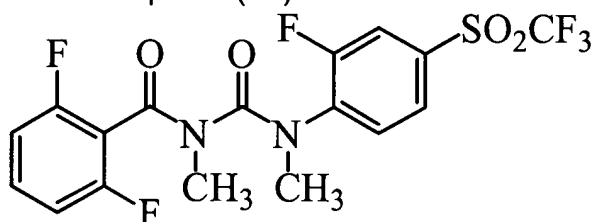
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,35 (3H,s), 6,92 - 6,96 (2H, m), 7,37 - 7,44 (1H, m), 7,64 - 7,68 (3H,m), 8,51 (1H,br).

Exemplo 21

Da mesma maneira como no Exemplo 20, o seguinte composto foi produzido.

1-(2,6-Difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometilsulfinil)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (21)).

O presente composto (21)

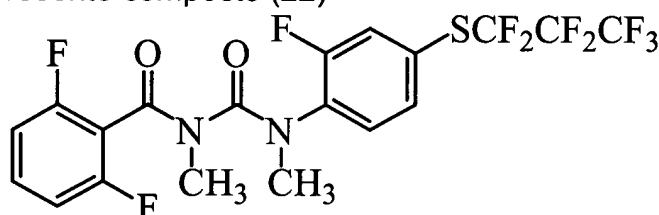


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,14 (3H,s), 3,42 (3H,s), 6,85 - 6,89 (2H, m), 7,32 - 7,40 (1H, m), 7,50 - 7,70 (1H,br), 7,82 - 7,84 (2H, m).

Exemplo 22

A uma solução de 1,5 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)fenil]ureia em 15 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolizinona foi adicionado iodeto de metila a 0°C, e em seguida foram adicionadas 331 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo), e a mistura foi agitada a 4°C durante 3 horas. A uma mistura reacional foram adicionados 20 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e em seguida agitada durante 30 minutos. À mistura foram adicionados 50 mL de acetato de etila, e as camadas separadas. A camada orgânica foi sequencialmente lavada com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (hexano: acetato de etila = 3: 1) para fornecer 400 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (22)).

O presente composto (22)

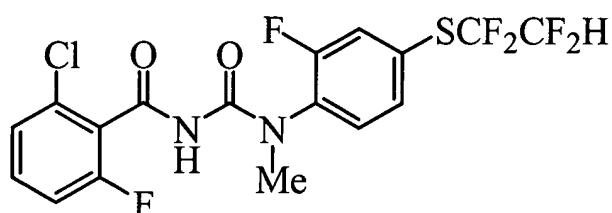


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,09 (3H,s), 3,35 (3H, brs), 6,80 - 6,93 (2H, m), 7,20 - 7,52 (4H,m).

Exemplo 23

A uma solução de 1,92 g de 2-flúor-N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)anilina em 8,0 mL de éter dietílico foi adicionada uma solução de 1,49 g de isocianato de 2-cloro-6-fluorobenzoíla em 2,0 mL de éter dietílico sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante duas horas. Hexano foi adicionado pouco a pouco à solução reacional colocada sob resfriamento, e em seguida um pó branco depositou-se. O pó foi coletado por filtração para fornecer 3,09 g de 3-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (23)).

O presente composto (23)

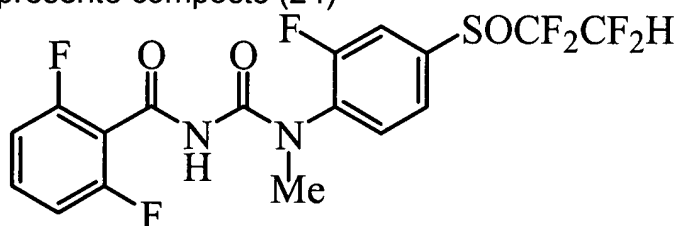


^1H -RMN (DMSO-d_6) δ (ppm): 3,23 (3H,s), 6,60 - 6,86 (1H, m), 7,26 - 7,28 (1H, m), 7,32 - 7,34 (1H, m), 7,44 - 7,46 (1H, m), 7,54 - 7,55 (2H, m), 7,66 - 7,68 (1H, m), 10,88 (1H, brs).

Exemplo 24

5 A uma solução de 1,0 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de clorofórmio foi adicionado 0,60 g de ácido meta-cloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso) sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante 65 horas. A uma mistura reacional foram adicionados 10 mL de clorofórmio. A mistura foi
 10 lavada três vezes com 20 mL de uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 34: 66) para fornecer 0,58 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-
 15 1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfinil)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (24)).

O presente composto (24)



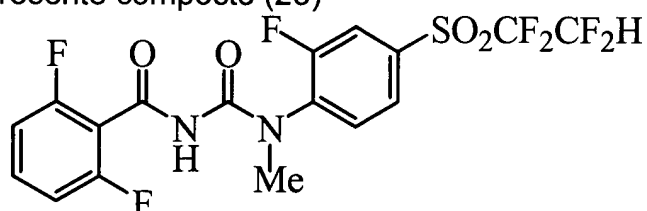
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,31 (3H,s), 6,05 - 6,33 (1H, m), 6,92 - 6,96 (2H, m), 7,37 - 7,41 (1H, m), 7,59 - 7,66 (3H,m), 8,17 (1H, brs).

20 Exemplo 25

A uma solução de 1,0 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1-metilureia em 20,0 mL de clorofórmio foram adicionados 1,33 g de ácido meta-cloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso) sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante 65 horas.
 25 A uma mistura reacional foram adicionados 20 mL de clorofórmio. A mistura

foi lavada três vezes com 40 mL de uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 34: 66) para fornecer 0,50 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetanossulfonil)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (25)).

O presente composto (25)

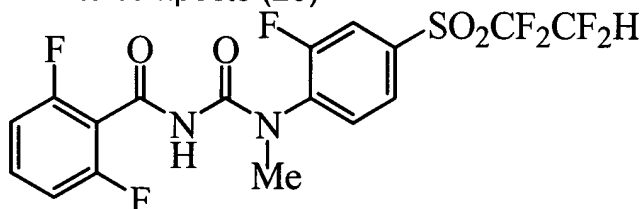


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,31 (3H,s), 6,05 - 6,33 (1H, m), 6,92 - 6,96 (2H, m), 7,37 - 7,41 (1H, m), 7,59 - 7,66 (3H,m), 8,17 (1H, brs).

Exemplo 26

A uma solução de 0,32 g de 2-flúor-N-metil-4-(2,2,2-trifluoroetil)anilina em 1,2 mL de éter dietílico foi adicionada uma solução de 0,25 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 0,3 mL de éter dietílico sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante duas horas. Hexano foi adicionado em porções à solução reacional sob resfriamento, e em seguida um pó branco depositou-se. O pó foi coletado por filtração por sucção para fornecer 0,53 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2,2,2-trifluoroetil)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (26)).

O presente composto (26)



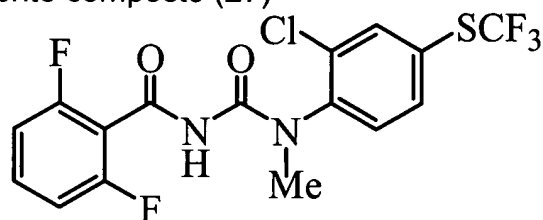
^1H -RMN (DMSO-d_6) δ (ppm): 3,17 (3H, s), 4,10 - 4,17 (2H, m), 7,11 - 7,15 (2H, m), 7,33 - 7,35 (2H, m), 7,48 - 7,54 (2H, m), 10,75 (1H, brs).

Exemplo 27

A uma solução de 1,02 g de 2-cloro-N-metil-4-

(trifluorometiltio)anilina em 4,1 mL de éter dietílico foi adicionada uma solução de 0,77 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 1,0 mL de éter dietílico sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante 0,5 hora. Imediatamente após a agitação, um pó branco depositou-se. O pó foi coletado por filtração para fornecer 1,50 g de 1-[2-cloro-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (27)).

O presente composto (27)

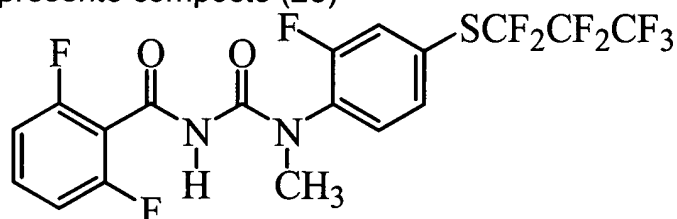


^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,19 (3H, brs), 7,10 - 7,14 (2H, m), 7,46 - 7,53 (1H, m), 7,59 - 7,61 (1H, m), 7,75 - 7,78 (1H, m), 7,96 - 7,97 (1H, m), 10,78 (1H, brs).

Exemplo 28

Uma solução de 173 mg de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 1,0 mL de acetato de etila foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 308 mg de 2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)-N-metilanilina em 10 mL de acetato de etila, e agitada durante uma hora. A mistura reacional foi sequencialmente lavada com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido (sólido) foi lavado com um solvente de mistura de hexano: éter terc-butilmetílico = 3: 1, e secado sob pressão reduzida para fornecer 320 mg de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (28)).

O presente composto (28)



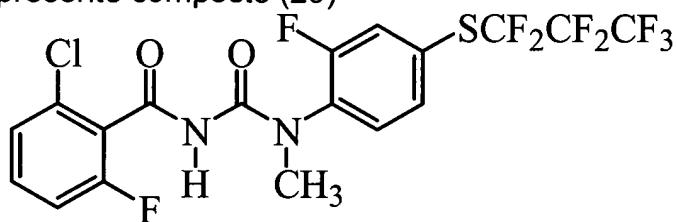
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,25 (3H, s), 7,05 (1H, t, $J = 8,6$ Hz), 7,22 (1H, d, J

= 8,2 Hz), 7,30 - 7,37 (1H, m), 7,38 - 7,44 (1H, m), 7,50 - 7,57 (2H, m), 8,03 (1H, br s).

Exemplo 29

Uma solução de 462 mg de isocianato de 2-cloro-6-fluorobenzoíla em 2,0 mL de acetato de etila foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 752 mg de 2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)-N-metilanilina em 10 mL de acetato de etila, e agitada durante uma hora. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida. O sólido obtido foi lavado com um solvente de mistura de hexano: éter terc-butilmetílico = 3: 1, e secado sob pressão reduzida para fornecer 990 mg de 3-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (29)).

O presente composto (29)

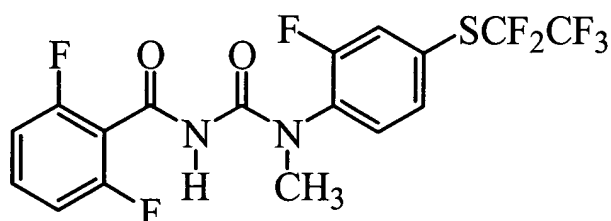


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 3,25 (3H, s), 7,05 (1H, t, J = 8,6 Hz), 7,22 (1H, d, J = 8,2 Hz), 7,30 - 7,37 (1H, m), 7,38 - 7,44 (1H, m), 7,50 - 7,57 (2H, m), 8,03 (1H, br s).

Exemplo 30

Uma solução de 732 mg de isocianato de 2,6-fluorobenzoíla em 2,0 mL de acetato de etila foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 1,1 g de 2-flúor-N-metil-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)anilina em 20 mL de acetato de etila, e agitada durante cinco minutos. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila:hexano = 25:75) para fornecer 1,6 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (30)).

O presente composto (30)

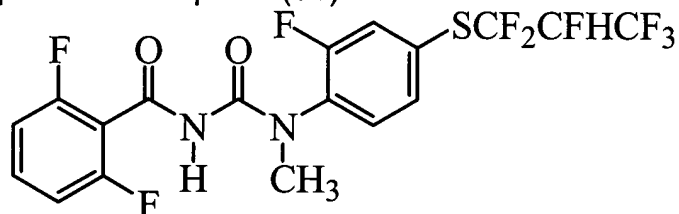


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,27 (3H, s), 6,88 - 7,00 (2H, m), 7,35 - 7,45 (2H, m), 7,50 - 7,60 (2H, m), 7,80 (1H, br s).

Exemplo 31

Uma solução de 628 mg de isocianato de 2,6-fluorobenzoíla em 2,0 mL de éter terc-butilmetílico foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 1,04 g de 2-flúor-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiltio)-N-metilanilina em 8,0 mL de éter terc-butilmetílico, e agitada durante 30 minutos. A uma mistura reacional foram adicionados 20 mL de hexano, a mistura foi filtrada. A massa filtrante foi secada para fornecer 1,63 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (31)).

O presente composto (31)

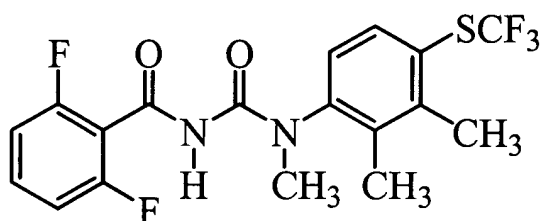


^1H -RMN (DMSO-d_6) δ (ppm): 3,24 (3H, s), 6,14 - 6,38 (1H, m), 7,08 - 7,17 (2H, m), 7,46 - 7,58 (3H, m), 7,64 - 7,70 (1H, m), 10,86 (1H, br s).

Exemplo 32

Uma solução de 638 mg de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 2,0 mL de éter terc-butilmetílico foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 820 mg de 2,3-dimetil-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina em 10 mL de éter terc-butilmetílico, e agitada durante 30 minutos. A uma mistura reacional foram adicionados 20 mL de hexano, e a mistura foi filtrada. A massa filtrante foi secada para fornecer 1,37 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2,3-dimetil-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (32)).

O presente composto (32)

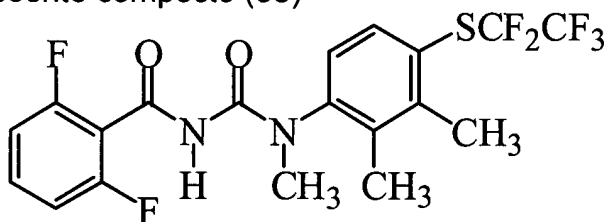


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,27 (3H, s), 2,58 (3H, s), 3,17 (3H, s), 6,94 (2H, t, $J = 8,3$ Hz), 7,16 (1H, d, $J = 8,3$ Hz), 7,33 - 7,50 (2H, m), 7,69 (1H, d, $J = 8,3$ Hz).

Exemplo 33

- 5 Uma solução de 487 mg de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 1,0 mL de éter terc-butilmetílico foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 820 mg de 2,3-dimetil-N-metil-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)anilina em 10 mL de éter terc-butilmetílico, e agitada durante 30 minutos. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida. O
- 10 resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 25: 75) para fornecer 1,37 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2,3-dimetil-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (33)).

- 15 O presente composto (33)



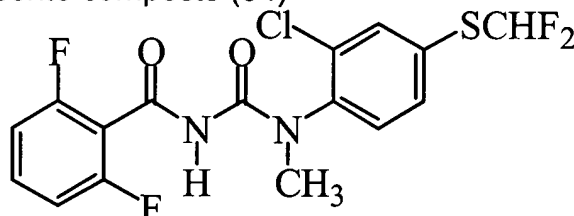
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,28 (3H, s), 2,59 (3H, s), 3,18 (3H, s), 6,94 (2H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,17 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 7,32 - 7,43 (2H, m), 7,68 (1H, d, $J = 8,2$ Hz).

Exemplo 34

- 20 Uma solução de 819 mg de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 2,0 mL de éter terc-butilmetílico foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 1,00 g de 2-cloro-4-(difluorometiltio)-N-metilanilina em 10 mL de éter terc-butilmetílico, e agitada durante 30 minutos. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por
- 25 cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média

(acetato de etila: hexano = 25: 75) para fornecer 1,74 g de 1-[2-cloro-4-(difluorometiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (34)).

O presente composto (34)

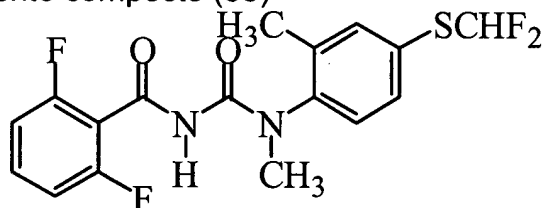


- 5 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,21 (3H, s), 6,91 (1H, t, $J = 56,1$ Hz), 6,94 (2H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,34 - 7,45 (2H, m), 7,52 (1H, br s), 7,60 (1H, dd, $J = 8,2, 2,0$ Hz), 7,78 (1H, d, $J = 2,0$ Hz).

Exemplo 35

- 10 Uma solução de 964 mg de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 2,0 mL de éter terc-butilmetílico foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 1,07 g de 4-(difluorometiltio)-N-metil-2-metilanilina em 10 mL de éter terc-butilmetílico, e agitada durante 30 minutos. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida para fornecer 2,14 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[4-(difluorometiltio)-2-metilfenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (35)).

O presente composto (35)



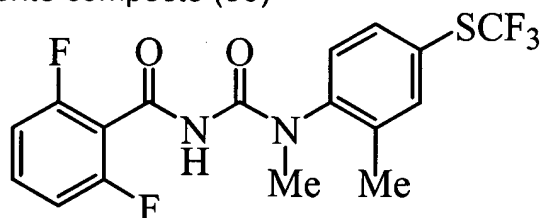
- 15 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,33 (3H, s), 3,18 (3H, s), 6,90 (1H, t, $J = 56,3$ Hz), 6,94 (2H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,26 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 7,34 - 7,46 (2H, m), 7,54 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 7,59 (1H, br s).

20 Exemplo 36

- Uma solução de 0,53 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 0,5 mL de éter dietílico preparada sob resfriamento foi adicionada a 3°C a uma solução de 0,64 g de N-metil-2-metil-4-(trifluorometiltio)anilina em 2,5 mL de éter dietílico, agitada em temperatura ambiente durante duas horas. A
- 25 uma mistura reacional foram adicionados 6 mL de hexano, e a mistura foi

filtrada. A massa filtrante foi secada para fornecer 1,58 g de 3-(2,6-difluorobenzil)-1-metil-1-[2-metil-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia (a seguir, referido como o presente composto (36)).

O presente composto (36)

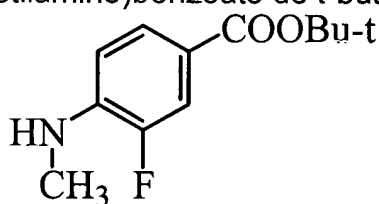


- 5 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,35 (3H,s), 3,19 (3H,s), 6,93 - 6,97 (2H, m), 7,30 - 7,43 (3H,m), 7,62 - 7,67 (2H, m).

Exemplo de Produção 5

A uma mistura de 1,00 g de (4-amino-3-flúor)benzoato de t-butila e 0,21 g de paraformaldeído (conteúdo; 90% em peso) em 5 mL de metanol
 10 foi adicionada uma mistura de 4,50 g de uma solução de metilato de sódio-metanol a 28% e 2 mL de metanol, e agitada em temperatura ambiente durante 18 horas. A mistura reacional foi vertida em 15 mL de água gelada, e em seguida extraída com 20 mL de clorofórmio. A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão redu-
 15 zida para obter um resíduo. O resíduo foi dissolvido em 20 mL de etanol, e a ele 0,40 g de boroidreto de sódio (conteúdo; 90% em peso) foi adicionado. A mistura foi aquecida em refluxo durante 30 minutos. A mistura reacional foi deixada resfriar para a temperatura ambiente, e em seguida concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foram adicionados 20 mL de água e 20 mL
 20 de clorofórmio, e em seguida as camadas separadas. A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: hexano = 1: 5) para fornecer 0,51 g de (3-flúor-4-metilamino)benzoato de t-butila.

- 25 (3-Flúor-4-metilamino)benzoato de t-butila

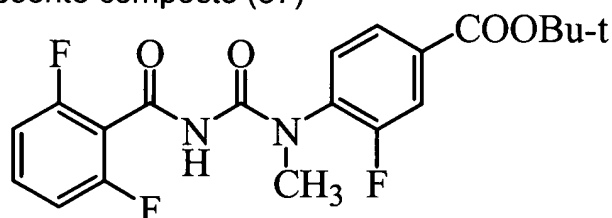


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 1,57 (9H,s), 2,92 (3H,d, $J = 5,3\text{Hz}$), 4,33 (1H,br), 6,59 - 6,64 (1H, m), 7,54 - 7,58 (1H, m), 7,69 - 7,72 (1H, m).

Exemplo 37

Uma solução de 0,42 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 0,5 mL de éter dietílico preparada sob resfriamento foi adicionada a 3°C a uma solução de 0,51 g de (3-flúor-4-metilamino)benzoato de t-butila em 2,5 mL de éter dietílico, e agitada em temperatura ambiente durante duas horas. A mistura reacional foi filtrada, e a massa filtrante foi secada para fornecer 0,76 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(t-butoxicarbonil)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (37)).

O presente composto (37)



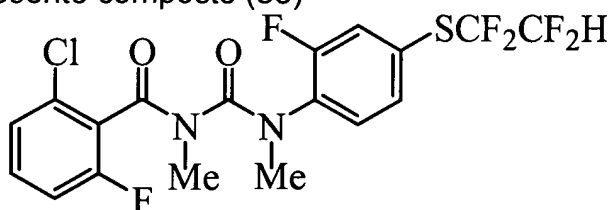
^1H -RMN (DMSO-d_6) δ (ppm): 1,55 (9H,s), 3,22 (3H,s), 7,12 - 7,16 (2H, m), 7,49 - 7,54 (2H, m), 7,69 - 7,77 (2H, m), 10,82 (1H, brs).

Exemplo 38

A uma solução de 1,01 g de 3-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 105 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida 0,33 mL de iodeto de metila foi adicionado a ela a 2°C, e a mistura foi agitada a 2-3°C durante três horas. A uma mistura reacional foi adicionada uma mistura de 10,0 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10,0 mL de água sob resfriamento, e a mistura foi extraída com 20 mL de acetato de etila três vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução salina saturada três vezes, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,48 g de 1-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente

composto (38)).

O presente composto (38)

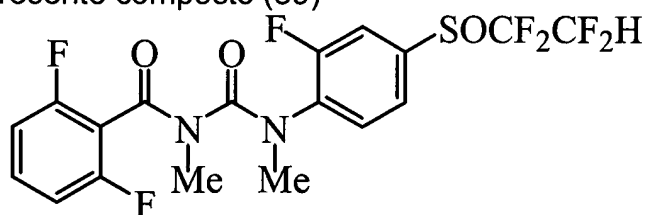


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,03 (3H,s), 3,42 (3H, brs), 5,69 - 5,96 (1H, m), 6,9 - 7,2 (2H, m), 7,27 (1H, m), 7,46 - 7,48 (3H,m).

5 Exemplo 39

A uma solução de 1,01 g de 1-(2,6-difluorobenzoyl)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 10,0 mL de clorofórmio foi adicionado 0,58 g de ácido meta-cloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso) sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante 72 horas. A
 10 uma mistura reacional foram adicionados 10 mL de clorofórmio. A mistura foi lavada três vezes com 20 mL de uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 34: 66) para fornecer 0,71 g de 1-(2,6-difluorobenzoyl)-
 15 3-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfinil)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (39)).

O presente composto (39)



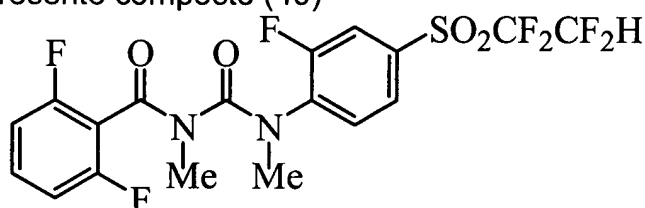
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,12 (3H,s), 3,39 (3H, brs), 6,04 - 6,31 (1H, m),
 20 6,88 (2H, m), 7,34 - 7,37 (1H, m), 7,50 - 7,51 (2H, m), 7,61 - 7,63 (1H, m).

Exemplo 40

A uma solução de 1,01 g de 1-(2,6-difluorobenzoyl)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 20,0 mL de clorofórmio foi adicionado 1,28 g de ácido meta-cloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso)
 25 sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante 72 horas. A

uma mistura reacional foram adicionados 20 mL de clorofórmio. A mistura foi lavada três vezes com 40 mL de uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 34: 66) para fornecer 0,97 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetanossulfonil)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (40)).

O presente composto (40)

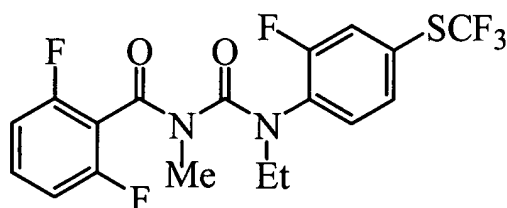


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 3,14 (3H,s), 3,42 (3H,s), 6,14 - 6,40 (1H, m), 6,86 - 6,90 (2H, m), 7,35 - 7,37 (1H, m), 7,52 - 7,54 (1H, m), 7,78 - 7,81 (2H, m).

Exemplo 41

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-etil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionadas 114 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C sob resfriamento, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,35 mL de iodeto de metila foi adicionado a ela, e a mistura obtida foi agitada durante 4 horas sob resfriamento. A uma mistura reacional foi adicionada uma mistura de 10 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10 mL de água sob resfriamento, e a mistura foi extraída com 20 mL de acetato de etila três vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução salina saturada três vezes, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,37 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-etil-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (41)).

O presente composto (41)

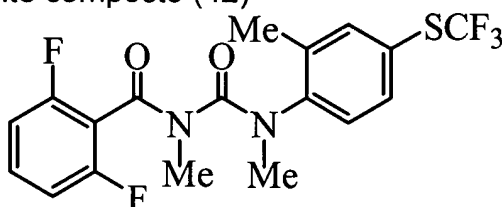


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 1,07 (3H, t, $J = 7,2$ Hz), 3,00 (3H, s), 3,69 (2H, q, $J = 7,2\text{Hz}$), 7,05 - 7,10 (2H, m), 7,37 - 7,39 (1H, m), 7,50 - 7,56 (2H, m), 7,67 - 7,70 (1H, m).

Exemplo 42

5 A uma solução de 0,75 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-metil-1-[2-metil-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia em 7,5 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionadas 89 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C , e agitada durante 30 minutos. Em seguida 0,28 mL de iodeto de metila foi adicionado a ela a 1°C , e a mistura foi agitada em temperatura ambiente
10 durante três horas. A uma mistura reacional foi adicionada uma mistura de 7,5 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 7,5 mL de água sob resfriamento. A mistura foi extraída com 15 mL de acetato de etila três vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução salina saturada três vezes, secadas sobre sulfato de magnésio anidro-
15 so, e em seguida concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,53 g de 1-(2,6-difluorobenzoyl)-1,3-dimetil-3-[2-metil-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia (a seguir, referido como o presente composto (42)).

20 O presente composto (42)



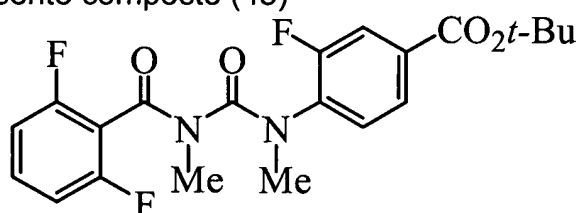
^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 3,05 (3H, s), 3,23 (3H, s), 7,10 - 7,14 (2H, m), 7,29 - 7,31 (1H, m), 7,51 - 7,56 (2H, m), 7,62 (1H, m).

Exemplo 43

25 A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-flúor-4-

(*t*-butoxicarbonil)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 118 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida 0,37 mL de iodeto de metila foi adicionado a ela a 1°C, e a mistura foi agitada em temperatura ambiente durante 3 horas. A uma mistura reacional foi adicionada uma mistura de 10,0 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10,0 mL de água sob resfriamento, e a mistura foi extraída com 20 mL de acetato de etila três vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e em seguida concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,67 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(*t*-butoxicarbonil)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (43)).

O presente composto (43)



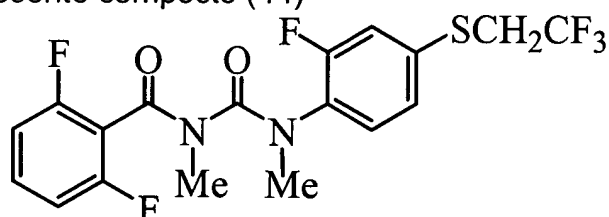
¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 1,55 (9H, s), 3,05 (3H, s), 3,24 (3H, s), 7,09 - 7,14 (2H, m), 7,32 - 7,37 (1H, m), 7,49 - 7,57 (1H, m), 7,66 - 7,73 (2H, m).

Exemplo 44

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2,2,2-trifluoroetiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 114 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida 0,35 mL de iodeto de metila foi adicionado a ela a 1,5°C, e a mistura foi agitada a 2-3°C durante 3 horas. A uma mistura reacional foi adicionada uma mistura de 10,0 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10,0 mL de água sob resfriamento, e a mistura foi extraída com 20 mL de acetato de etila três vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e em

seguida concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,86 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(2,2,2-trifluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente com-
5 posto (44)).

O presente composto (44)

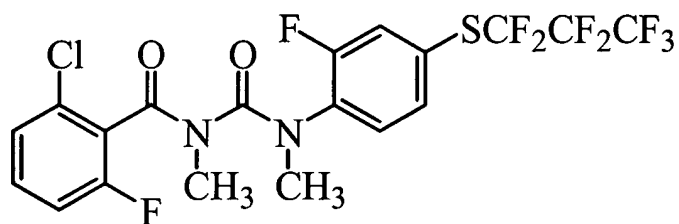


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 3,02 (3H, s), 3,21 (3H, s), 3,97 - 4,07 (2H, m), 7,08 - 7,12 (2H, m), 7,20 - 7,22 (1H, m), 7,29 - 7,32 (1H, m), 7,44 - 7,54 (2H, m).

10 Exemplo 45

A uma solução de 740 mg de 3-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolizinona foram adicionados 200 mg de iodeto de metila a 0°C, e em seguida 74 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em
15 óleo), e agitada a 4°C durante duas horas. A uma mistura reacional foram adicionados 20 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada, e agitada durante 30 minutos. À mistura foram adicionados 50 mL de acetato de etila, e em seguida as camadas separadas. A camada orgânica foi se-
20 quencialmente lavada com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 25: 75) para fornecer 550 mg de 1-(2-cloro-6-fluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o pre-
25 sente composto (45)).

O presente composto (45)



^1H -RMN((DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 3,01 (3H, br s), 3,31 (3H, s), 7,20 (1H, t, $J = 8,8$ Hz), 7,32 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 7,44 - 7,61 (3H, m), 7,68 (1H, d, $J = 10,9$ Hz).

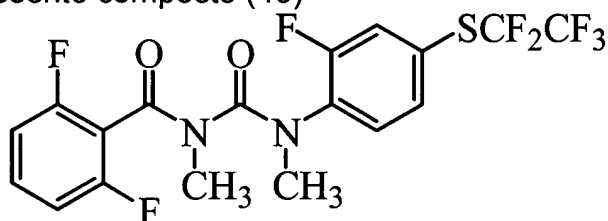
Exemplo 46

5 A uma solução de 1,1 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)fenil]-1-metilureia em 7 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolizina foram adicionados 700 mg de iodeto de metila e em seguida 118 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A uma mistura reacional foram adi-

10 cionados 20 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada, e agitada durante 30 minutos. À mistura foi adicionada 50 mL de acetato de etila, e em seguida as camadas separadas. A camada orgânica foi sequencialmente lavada com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resí-

15 duo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 25: 75) para fornecer 900 mg de 1-(2,6-difluorobenzoyl)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (46)).

20 O presente composto (46)



^1H -RMN((DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 3,07 (3H, s), 3,27 (3H, s), 7,02 - 7,18 (2H, m), 7,39 - 7,60 (3H, m), 7,66 (1H, d, $J = 10,0$ Hz).

Exemplo 47

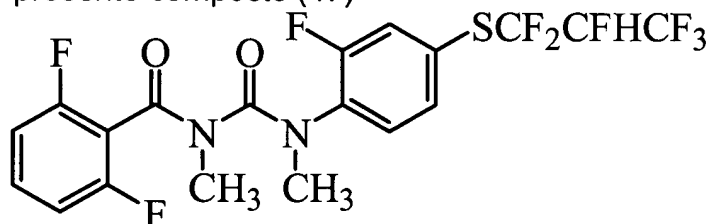
25 A uma solução de 1,12 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-flúor-4-

(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiltio)fenil]-1-metilureia em 10 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolizina foram adicionadas 300 mg de iodeto de metila e em seguida 101 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A uma mistura reacional foram

5 adicionados 20 mL de água e 50 mL de acetato de etila, e em seguida as camadas separadas. A camada orgânica foi sequencialmente lavada com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão

10 média (acetato de etila: hexano = 25: 75) para fornecer 900 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (47)).

O presente composto (47)



¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 3,05 (3H, s),

15 3,26 (3H, s), 6,03 - 6,25 (1H, m), 7,09 (2H, t, J = 8,3 Hz), 7,36 - 7,43 (1H, m), 7,47 - 7,62 (3H, m).

Exemplo 48

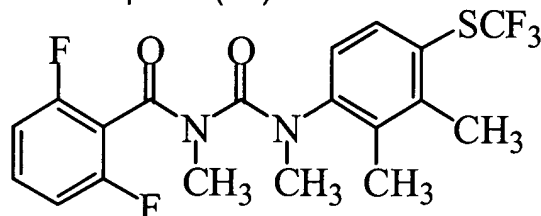
A uma solução de 860 mg de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2,3-dimetil-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 10 mL de 1,3-dimetil-2-

20 imidazolidinona foram adicionados 581 mg de iodeto de metila e em seguida 90 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante 10 horas. A uma mistura reacional foram adicionados 20 mL de água e 50 mL de acetato de etila, e em seguida as ca-

25 madas separadas. A camada orgânica foi sequencialmente lavada com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 20: 80) para fornecer 820 mg de 1-(2,6-

difluorobenzoil)-3-[2,3-dimetil-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (48)).

O presente composto (48)

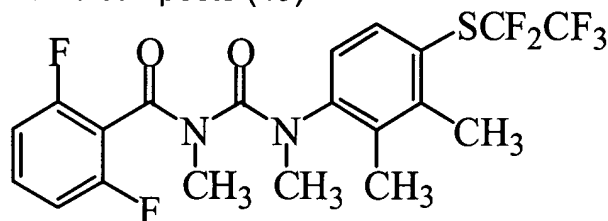


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 2,12 (3H, s),
 5 2,49 (3H, s), 3,04 (3H, s), 3,22 (3H, s), 7,06 - 7,20 (3H, m), 7,47 - 7,64 (2H, m).

Exemplo 49

A uma solução de 870 mg de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2,3-dimetil-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)fenil]-1-metilureia em 7 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionados 394 mg de iodeto de metila e em seguida 82 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante a noite. A uma mistura reacional foram adicionados 10 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10 mL de acetato de etila, e agitada durante 10 minutos. À mistura foram também adicionados 50 mL de acetato de etila, e em seguida as camadas separadas. A camada orgânica foi sequencialmente lavada com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 25: 75) para fornecer 850 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2,3-dimetil-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (49)).

O presente composto (49)



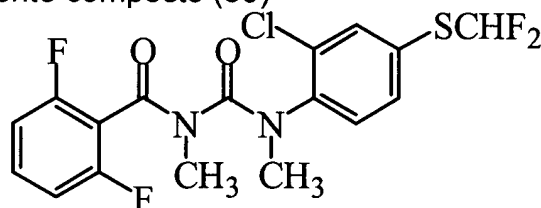
¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 2,12 (3H, s),
 25 2,48 (3H, s), 3,04 (3H, s), 3,21 (3H, s), 7,06 - 7,21 (3H, m), 7,48 - 7,61- (2H,

m).

Exemplo 50

A uma solução de 1,16 g de 1-[2-cloro-4-(difluorometiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metilureia em 10 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionados 608 mg de iodeto de metila e em seguida 125 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante a noite. A uma mistura reacional foram adicionados 20 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 50 mL de éter terc-butilmetílico, e em seguida as camadas separadas. A camada orgânica foi sequencialmente lavada com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 25: 75) para fornecer 1,17 g de 1-[2-cloro-4-(difluorometiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (50)).

O presente composto (50)



^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 3,06 (3H, s), 3,25 (3H, s), 7,11- (2H, t, J = 8,5 Hz), 7,33 - 7,66 (4H, m), 7,74 (1H, d, J = 2,0 Hz).

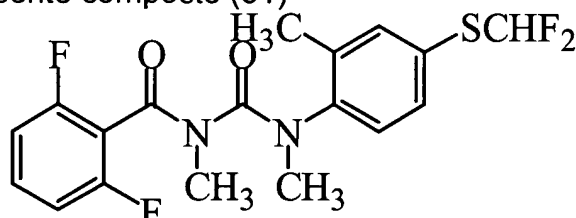
Exemplo 51

A uma solução de 1,40 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[4-(difluorometiltio)-2-metilfenil]-1-metilureia em 15 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionados 773 mg de iodeto de metila e em seguida 159 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante duas horas. A uma mistura reacional foram adicionados 20 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 50 mL de éter terc-butilmetílico, e em seguida as camadas separadas. A camada orgânica foi sequencialmente lavada com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob

pressão reduzida. O sólido obtido foi lavado com um solvente de mistura de hexano: éter metil terc-butilico = 1: 1, e secado sob pressão reduzida para fornecer 1,21 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[4-(difluorometiltio)-2-dimetilfenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (51)).

5

O presente composto (51)



^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,05 (3H, s), 3,22 (3H, s), 7,13 (2H, t, $J = 8,6$ Hz), 7,21 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 7,39 - 7,45 (1H, m), 7,41 (1H, t, $J = 56,3$ Hz), 7,47 - 7,58 (2H, m).

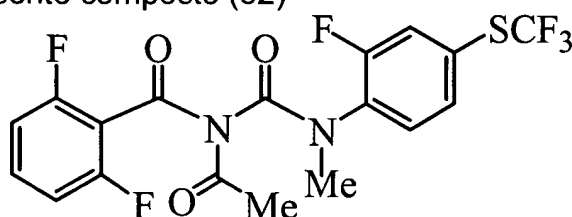
Exemplo 52

10

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 12 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C , e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,21 mL de cloreto de acetila foi adicionado a 1°C a ela. A mistura obtida foi agitada em temperatura ambiente durante 3 horas, vertida em 10 mL de água gelada, e em seguida extraída com 20 mL de acetato de etila três vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer um óleo incolor. O óleo foi também purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 15: 85) para fornecer 0,62 g de 1-acetil-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (52)).

25

O presente composto (52)



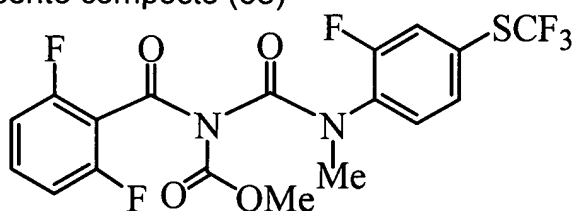
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,37 (3H, brs), 3,45 (3H, brs), 6,70 - 6,90 (2H, brm), 7,32 - 7,45 (3H, m), 7,51 - 7,53 (1H, m).

Exemplo 53

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 12 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,23 mL de clorocarbonato de metila foi adicionado a 2°C a ela. A mistura obtida foi agitada em temperatura ambiente durante 3 horas, vertida em 10 mL de água gelada, e em seguida extraída com 20 mL de acetato de etila três vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com três vezes uma salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer um óleo incolor. O óleo foi também purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 20: 80) para fornecer 0,62 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metoxycarbonil-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (53)).

20

O presente composto (53)



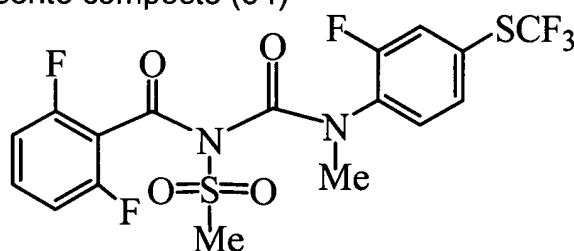
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,46 (3H, brs), 3,76 (3H, brs), 6,78 - 6,83 (2H, m), 7,31 - 7,33 (1H, m), 7,43 - 7,51 (3H, m).

Exemplo 54

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionadas 12 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida 0,23 mL de cloreto de metanossulfonila foi adicionado a 2°C a ela. A mistura obtida foi agitada em temperatura ambiente durante 5 horas, vertida em 10 mL de água gelada, e em

seguida extraída com 20 mL de acetato de etila três vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,17 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metanossulfonil-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (54)).

O presente composto (54)

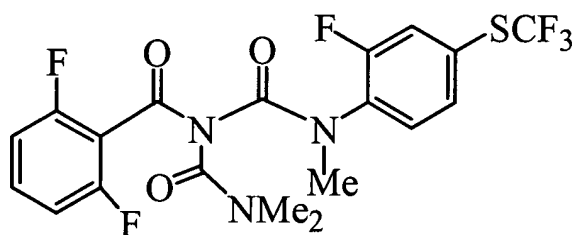


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 3,40 (3H, brs), 3,51 (3H, brs), 7,16 - 7,20 (2H, m), 7,45 - 7,47 (1H, m), 7,61 - 7,63 (2H, m), 7,71 - 7,73 (1H, m).

Exemplo 55

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 118 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,27 mL de cloreto de dime-
 15 tilcarbamoila foi adicionado a 2°C a ela. A mistura obtida foi agitada em temperatura ambiente durante 21,5 horas e Em seguida, a 80°C durante 5 horas. A mistura reacional foi vertida em 10 mL de água gelada, e foi extraída com 20 mL de acetato de etila três vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma salina saturada três vezes, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resí-
 20 duo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,10 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-1-(N,N-dimetilcarbamoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a se-
 25 guir, referido como o presente composto (55)).

O presente composto (55)

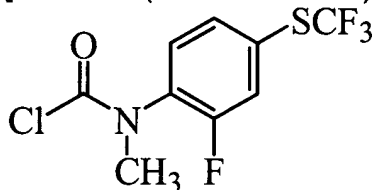


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,71 (6H, brs), 3,28 (3H, s), 6,93 - 6,98 (2H, m), 7,39 - 7,43 (1H, m), 7,48 - 7,58 (3H, m).

Exemplo de Produção 6

A uma solução de 1,00 g de 2-flúor-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina em 10 mL de tolueno foi adicionado 0,60 mL de trietilamina. A ela foi adicionada gota a gota uma solução de 1,35 g de carbonato bis(triclorometil) em 4 mL de tolueno a 1°C a 8°C . A mistura obtida foi agitada durante uma hora, e Em seguida, concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foram adicionados 20 mL de água e 20 mL de clorofórmio, e Em seguida, as camadas separadas. A camada orgânica foi lavada com 20 mL de uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturado, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 1,26 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamóila (pureza de 91%: como determinado por ^1H - RMN).

15 Cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamóila



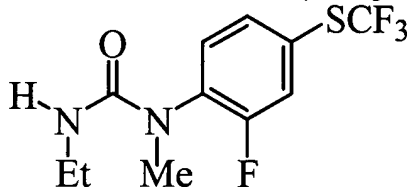
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,36 - 3,49 (3H, m), 7,35 - 7,39 (1H, m), 7,51 - 7,53 (2H, m).

Exemplo de Produção 7

A uma solução de 1,00 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamóila em 10 mL de acetonitrila foi adicionado 1,00 mL de uma solução aquosa de etilamina a 70%. A mistura obtida foi agitada em temperatura ambiente durante 20 minutos e Em seguida, concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foram adicionados 20 mL de água e 20 mL de clorofórmio, e Em seguida, as camadas separadas. A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada

sob pressão reduzida para fornecer 0,80 g de 3-etil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia.

3-Etil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia

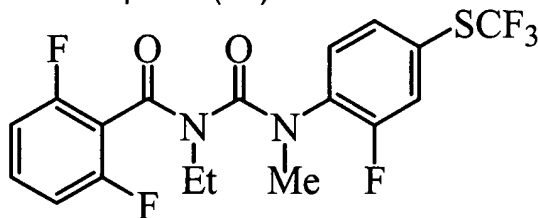


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 1,09 (3H, t, $J = 7,1\text{Hz}$), 3,23 (3H, s), 3,26 (2H, q, $J = 7,1\text{Hz}$), 4,28 (1H, br), 7,35 - 7,39 (1H, m), 7,47 - 7,51 (2H, m).

Exemplo 56

A uma solução de 0,80 g de 3-etil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 4,0 mL de piridina foi adicionado 0,37 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla. A mistura obtida foi agitada em temperatura ambiente durante 6 dias. A mistura reacional foi adicionada a 20 mL de água e 20 mL de acetato de etila, e Em seguida, as camadas separadas. A camada orgânica foi sequencialmente lavada com 20 mL de ácido clorídrico a 7%, 20 mL de água e 20 mL de uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 5) para fornecer 0,90 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-1-etil-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (56)).

O presente composto (56)



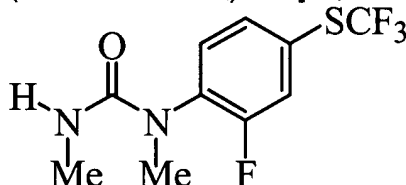
^1H -RMN ($\text{DMSO}-d_6$, Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 3,18 (3H, t, $J = 7,1\text{ Hz}$), 3,26 (3H, s), 3,54 (2H, q, $J = 7,1\text{ Hz}$), 7,09 - 7,13 (2H, m), 7,38 - 7,42 (1H, m), 7,50 - 7,58 (2H, m), 7,65 - 7,68 (1H, m).

Exemplo de Produção 8

A uma solução de 1,00 g de 2-flúor-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina em 10 mL de tolueno foi adicionado 0,60 mL de trieti-

lamina. A ela foi adicionada gota a gota uma solução de 1,30 g de bis(triclorometil)carbonato em 4 mL de tolueno a 1°C a 8°C. A mistura obtida foi agitada durante uma hora e Em seguida, concentrada sob pressão redu-
 zida para obter um resíduo. O resíduo foi dissolvido em 10 mL de acetonitri-
 5 la, e a ela 2,00 mL de uma solução aquosa de metilamina a 40% foram adi-
 cionados. A mistura foi agitada em temperatura ambiente durante 20 minu-
 tos, e Em seguida, concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foram adi-
 cionados 20 mL de água e 20 mL de clorofórmio, e Em seguida, as camadas
 separadas. A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro-
 10 so, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 0,61 g de 1-[2-flúor-4-
 (trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia



¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 2,79 (3H, s), 3,24 (3H, s), 4,23 (1H, br), 7,35 - 7,39
 (1H, m), 7,47 - 7,51 (2H, m).

15 Exemplo 10-(1)

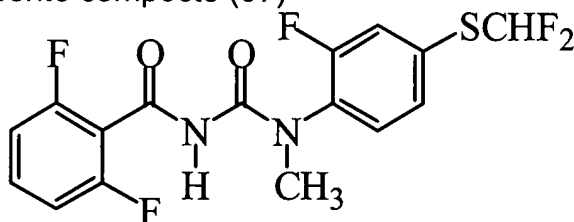
A uma solução de 1,00 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-
 1,3-dimetilureia em 5,0 mL de piridina foi adicionado 0,50 mL de cloreto de
 2,6-difluorobenzoíla. A mistura obtida foi agitada em temperatura ambiente
 durante três dias. A mistura reacional foi adicionada a 20 mL de água e 20
 20 mL de acetato de etila, e Em seguida, as camadas separadas. A camada
 orgânica foi lavada com 20 mL de ácido clorídrico a 7%, lavada sequencial-
 mente com 20 mL de água e 20 mL de uma solução salina saturada, secada
 sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida. O
 resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila:
 25 hexano = 1: 1) para fornecer 0,90 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-
 (trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (o presente composto (10)).

Exemplo 57

Uma solução de 1,85 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em
 2,0 mL de éter terc-butilmetílico foi adicionada a uma solução de 2,09 g de 4-

(difluorometiltio)-2-flúor-N-metilanilina em 10 mL de éter terc-butilmetílico em temperatura ambiente, e agitada durante 30 minutos. Um sólido produzido foi coletado por filtração, e secado sob pressão reduzida para fornecer 3,36 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[4-(difluorometiltio)-2-fluorofenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (57)).

O presente composto (57)

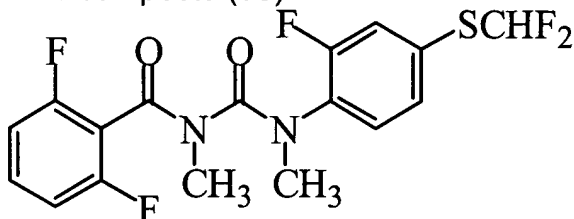


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,24 (3H, s), 6,89 (1H, t, $J = 56,3$ Hz), 6,94 (2H, t, $J = 8,5$ Hz), 7,32 - 7,51 (4H, m), 7,86 (1H, br s).

Exemplo 58

A uma solução de 2,22 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[4-(difluorometiltio)-2-fluorofenil]-1-metilureia em 15 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionados 1,60 g de iodeto de metila e Em seguida, 250 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A uma mistura reacional foram adicionados 20 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 50 mL de éter metil terc-butilico, e Em seguida, as camadas separadas. A camada orgânica foi sequencialmente lavada com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 25: 75) para fornecer 1,15 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[4-(difluorometiltio)]-2-fluorofenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (58)).

O presente composto (58)



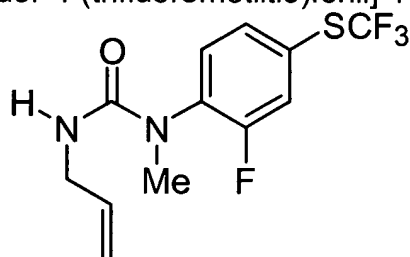
^1H -RMN (DMSO-d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 3,05 (3H, s),

3,25 (3H, s), 7,10 (2H, t, J = 8,3 Hz), 7,30 - 7,37 (1H, m), 7,39 - 7,43 (1H, m), 7,47 - 7,57 (2H, m), 7,48 (1H, t, J = 56,0 Hz).

Exemplo de Produção 9

A uma solução de 150 mg de alilamina em 10 mL de éter terc-butilmetílico foi adicionado 0,36 mL de trietilamina e Em seguida, 500 mg de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante 20 minutos. A solução reacional foi filtrada através de Celita, e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para fornecer 536 mg de 3-alil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia.

3-Alil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia

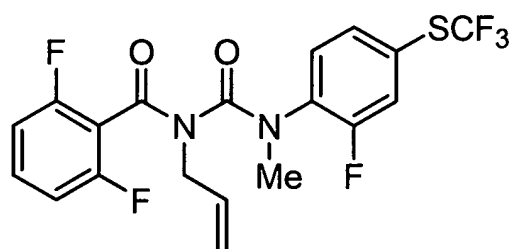


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 3,25 (3H, s), 3,80 - 3,91- (2H, m), 4,34 (1H, br), 5,04 - 5,17 (2H, m), 5,77 - 5,89 (1H, m), 7,35 - 7,42 (1H, m), 7,46 - 7,54 (2H, m).

Exemplo 59

A uma solução de 536 mg de 3-alil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia e 270 mg de diisopropiletilamina em 7 mL de tolueno foram adicionados 338 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura foi lavada sequencialmente com uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturado e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 66: 34) para fornecer 0,59 g de 1-alil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (59)).

O presente composto (59)

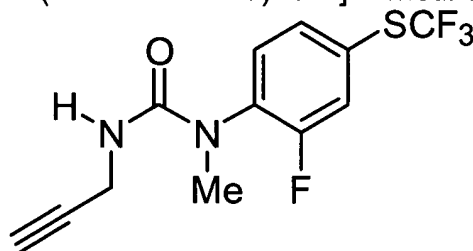


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 3,26 (3H, s), 4,12 (2H, d, $J = 5,8$ Hz), 5,01 - 5,18 (2H, m), 5,76 - 5,89 (1H, m), 7,09 (2H, t, $J = 8,5$ Hz), 7,41 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,49 - 7,59 (2H, m), 7,66 (1H, dd, $J = 10,0, 1,8$ Hz).

5 Exemplo de Produção 10

A uma solução de 300 mg de propargilamina em 10 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,36 mL de trietilamina e Em seguida, 500 mg de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, seca-
da sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 440 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-propargilureia.

15 1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio) fenil]-1-metil-3-propargilureia



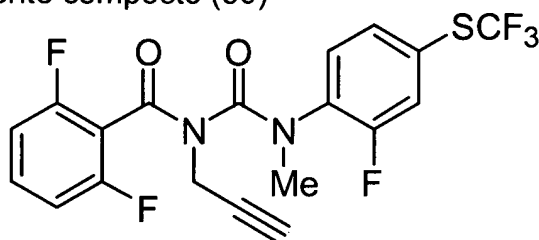
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,20 (1H, t, $J = 2,6$ Hz), 3,26 (3H, s), 4,02 (2H, dd, $J = 5,4, 2,4$ Hz), 4,48 (1H, br), 7,38 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,47 - 7,56 (2H, m).

Exemplo 60

A uma solução de 440 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-propargilureia e 223 mg de diisopropiletilamina em 7 mL de tolueno foram adicionadas 279 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura foi lavada sequencialmente com água, uma so-

lução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 66: 34) para fornecer 0,21 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-propargilureia (a seguir, referido como o presente composto (60)).

O presente composto (60)

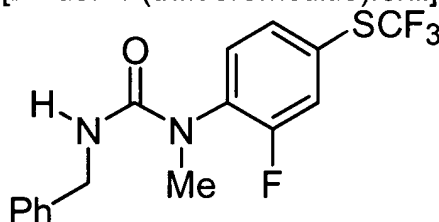


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,12 (1H, t, J = 2,4 Hz), 3,28 (3H, s), 4,36 (2H, d, J = 2,4 Hz), 7,11 - (2H, t, J = 8,3 Hz), 7,43 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,52 - 7,61 (2H, m), 7,64 (1H, dd, J = 10,1, 1,9 Hz).

Exemplo de Produção 11

A uma solução de 559 mg de benzilamina em 15 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,36 mL de trietilamina e Em seguida, 500 mg de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 690 mg de 3-benzil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia.

3-Benzil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia

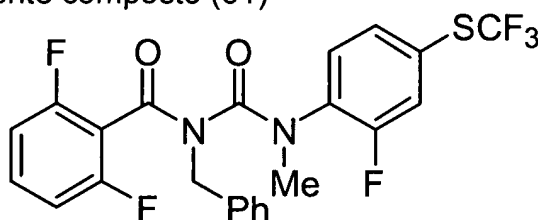


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 3,27 (3H, s), 4,42 (2H, d, J = 5,6 Hz), 4,61 (1H, br), 7,21 - 7,41 (6H, m), 7,43 - 7,53 (2H, m).

Exemplo 61

A uma solução de 690 mg de 3-benzil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia e 0,4 mL de diisopropiletilamina em 10 mL de tolueno foram adicionados 374 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 0,69 g de 1-benzil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (61)).

O presente composto (61)



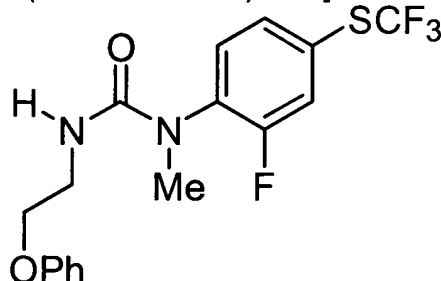
^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,23 (3H, s), 4,76 (2H, s), 7,06 (2H, t, $J = 8,5$ Hz), 7,18 - 7,34 (6H, m), 7,48 - 7,57 (2H, m), 7,64 (1H, dd, $J = 10,2, 2,0$ Hz).

Exemplo de Produção 12

A uma solução de 1,03 g de 2-fenoxietilamina em 15 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,4 mL de trietilamina e Em seguida, 650 mg de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 40: 60) para

fornecer 700 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-fenoxietil)ureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio) fenil]-1-metil-3-(2-fenoxietil)ureia

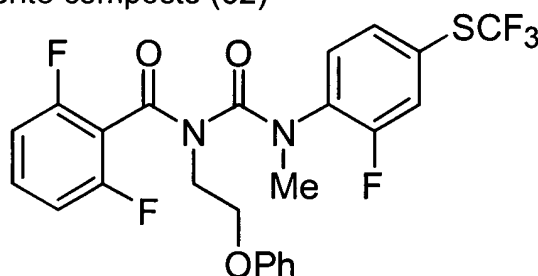


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,24 (3H, s), 3,62 (2H, q, $J = 5,2$ Hz), 4,03 (2H, t, $J = 5,2$ Hz), 4,80 (1H, br), 6,80 (2H, d, $J = 7,8$ Hz), 6,96 (1H, t, $J = 7,4$ Hz), 7,22 - 7,36 (3H, m), 7,41 - 7,51 (2H, m).

Exemplo 62

A uma solução de 690 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-fenoxietil)ureia e 0,4 mL de diisopropiletilamina em 10 mL de tolueno foram adicionadas 376 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoila, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 66: 34) para fornecer 0,67 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(2-fenoxietil)ureia (a seguir, referido como o presente composto (62)).

O presente composto (62)



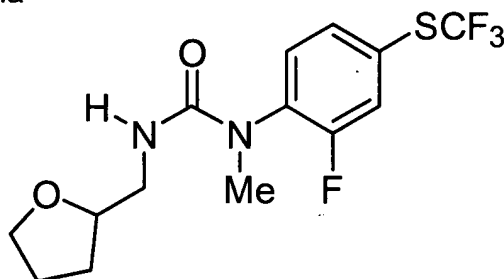
^1H -RMN (DMSO-d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,27 (3H, s),

3,93 (2H, t, J = 5,3 Hz), 4,19 (2H, t, J = 5,3 Hz), 6,87 (2H, d, J = 8,4 Hz), 6,94 (1H, t, J = 8,4 Hz), 7,12 (2H, t, J = 8,7 Hz), 7,27 (2H, t, J = 8,4 Hz), 7,40 (1H, t, J = 8,3 Hz), 7,48 - 7,60 (2H, m), 7,64 (1H, dd, J = 10,0, 1,7 Hz).

Exemplo de Produção 13

5 A uma solução de 738 mg de tetraidrofurfurilamina em 15 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,4 mL de trietilamina e Em seguida, 700 mg de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de
10 hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, seca- da sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho ele- vado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 50: 50) para fornecer 760 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-
15 tetraidrofurilmetil)ureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-
tetraidrofurilmetil)ureia



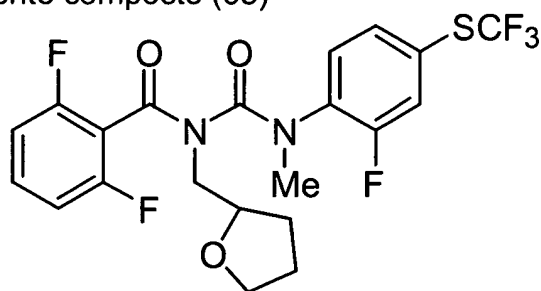
¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 1,49 - 1,62 (1H, m), 1,77 - 2,00 (3H, m), 3,10 - 3,21 (1H, m), 3,24 (3H, s), 3,44 - 3,55 (1H, m), 3,63 - 3,76 (2H, m), 3,88 -
20 3,99 (1H, m), 4,67 (1H, br), 7,37 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,44 - 7,53 (2H, m).

Exemplo 63

A uma solução de 750 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-tetraidrofurilmetil)ureia e 0,44 mL de diisopropiletilamina em 10 mL de tolueno foram adicionados 413 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoila, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacio-
25 nal foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura foi lavada sequencialmente com

água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 66: 34) para fornecer 0,77 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(2-tetraidrofurilmetil)ureia (a seguir, referido como o presente composto (63)).

O presente composto (63)

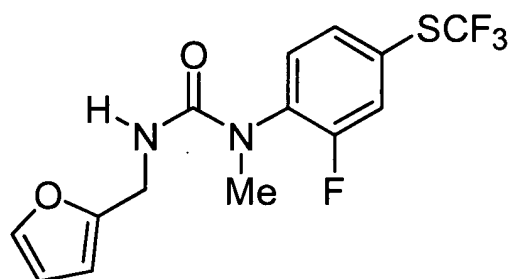


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 1,45 - 1,58 (1H, m), 1,72 - 1,85 (2H, m), 1,87 - 1,99 (1H, m), 3,27 (3H, s), 3,52 - 3,71 (4H, m), 4,07 - 4,20 (1H, m), 7,12 (2H, t, J = 8,5 Hz), 7,43 - 7,60 (3H, m), 7,64 (1H, dd, J = 10,2, 1,9 Hz).

Exemplo de Produção 14

A uma solução de 1,0 g de furfurilamina em 25 mL de éter terci-butilmetílico foi adicionado 0,53 mL de trietilamina e Em seguida, 1,0 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila) para fornecer 830 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2-furilmetil)-1-metilureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2-furilmetil)-1-metilureia

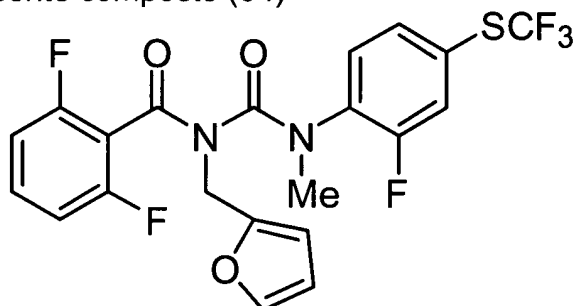


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,25 (3H, s), 4,40 (2H, d, $J = 5,6$ Hz), 4,63 (1H, br), 6,17 - 6,22 (1H, m), 6,27 - 6,32 (1H, m), 7,30 - 7,39 (2H, m), 7,43 - 7,53 (2H, m).

Exemplo 64

5 A uma solução de 700 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2-furilmetil)-1-metilureia e 0,42 mL de diisopropiletilamina em 10 mL de tolueno foram adicionados 390 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura foi lavada sequencialmente com
 10 água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 0,36 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(2-furilmetil)-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (64)).
 15

O presente composto (64)

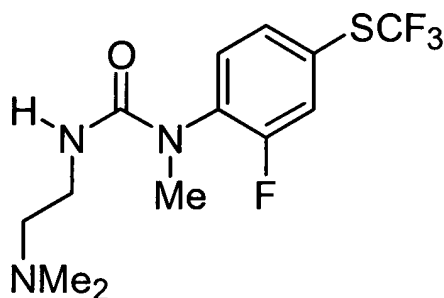


20 ^1H -RMN (DMSO-d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,21 (3H, s), 4,76 (2H, s), 6,24 - 6,31 (1H, m), 6,37 - 6,43 (1H, m), 7,05 - 7,22 (3H, m), 7,45 - 7,69 (4H, m).

Exemplo de Produção 15

A uma solução de 1,38 g de N,N-dimetiletenodiamina em 35 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,87 mL de trietilamina e Em seguida, 1,5 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A
 5 solução reacional foi lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: metanol = 90: 10) para fornecer 1,46 g de 3-(2-dimetilaminoetil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia.

3-(2-Dimetilaminoetil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia



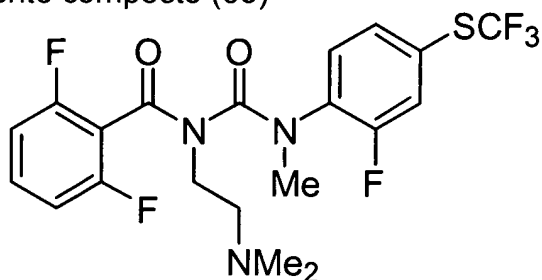
$^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3) δ (ppm): 2,13 (6H, s), 2,34 (2H, t, $J = 6,0$ Hz), 3,22 - 3,32 (5H, m), 5,01 (1H, br), 7,37 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,44 - 7,51- (2H, m).

15 Exemplo 65

A uma solução de 1,2 g de 3-(2-dimetilaminoetil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia e 0,74 mL de diisopropiletilamina em 15 mL de tolueno foram adicionados 687 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoila, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacio-
 20 nal foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 80 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromato-
 25 grafia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (aceta-to de etila) para fornecer 1,46 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-2-(2-dimetilaminoetil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, re-

ferido como o presente composto (65)).

O presente composto (65)

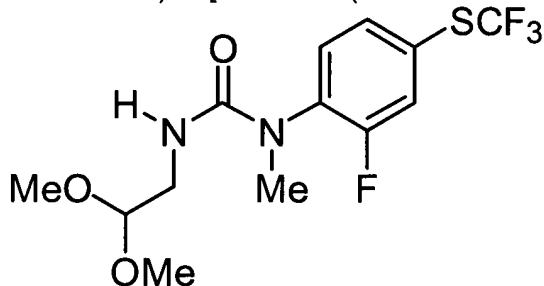


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 2,10 (6H, s), 2,48 (2H, t, $J = 6,4$ Hz), 3,26 (3H, s), 3,61 - (2H, t, $J = 6,4$ Hz), 7,12 (2H, t, $J = 8,5$ Hz), 7,46 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,51 - 7,60 (2H, m), 7,65 (1H, dd, $J = 10,1, 1,7$ Hz).

Exemplo de Produção 16

A uma solução de 2,74 g de dimetilacetal de aminoacetoaldeído em 80 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 3,6 mL de trietilamina e Em seguida, 5,0 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 50: 50) para fornecer 6,18 g de 3-(2,2-dimetoxietil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia.

3-(2,2-Dimetoxietil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia

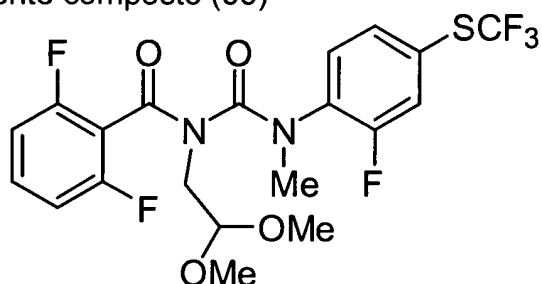


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,24 (3H, s), 3,34 (2H, t, $J = 5,5$ Hz), 3,36 (6H, s), 4,35 (1H, t, $J = 5,5$ Hz), 4,52 (1H, br), 7,37 (1H, t, $J = 8,3$ Hz), 7,45 - 7,53 (2H, m).

Exemplo 66

A uma solução de 6,18 g de 3-(2,2-dimetoxietil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia e 5,4 mL de diisopropiletilamina em 50 mL de tolueno foram adicionados 3,98 g de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional
 5 foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 150 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado
 10 do por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 7,78 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-2-(2,2-dimetoxietil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (66)).

O presente composto (66)



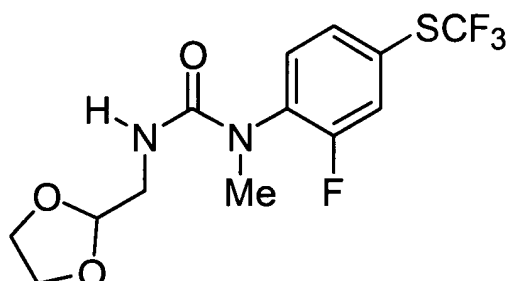
15 ^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação: 80°C) δ (ppm): 3,27 (3H, s), 3,30 (6H, s), 3,61 - (2H, d, J = 5,0 Hz), 4,63 (1H, t, J = 5,0 Hz), 7,12 (2H, t, J = 8,6 Hz), 7,44 (1H, t, J = 8,1 Hz), 7,51 - 7,60 (2H, m), 7,65 (1H, dd, J = 10,1, 1,9 Hz).

Exemplo de Produção 17

20 A uma solução de 660 mg de 2-aminometil-1,-dioxolano em 20 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,33 mL de trietilamina e Em seguida, 614 mg de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob
 25 pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de

etila = 50: 50) para fornecer 600 mg de 3-[(1,3-dioxolan-2-il)metil]-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia.

3-(1,3-Dioxolan-2-il)metil]-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia

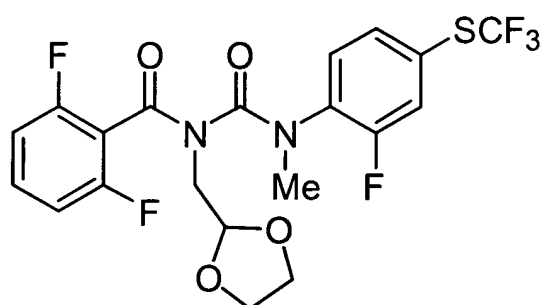


- 5 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,25 (3H, s), 3,45 (2H, dd, $J = 5,9, 3,7$ Hz), 3,82 - 3,92 (4H, m), 4,54 (1H, br), 4,93 (1H, t, $J = 3,7$ Hz), 7,38 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,45 - 7,53 (2H, m).

Exemplo 67

- A uma solução de 450 mg de 3-[(1,3-dioxolan-2-il)metil]-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia e 0,2 mL de diisopropiletilamina em 10 mL de tolueno foram adicionados 247 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 66: 34) para fornecer 390 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-1-[(1,3-dioxolan-2-il)metil]-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (67)).

O presente composto (67)

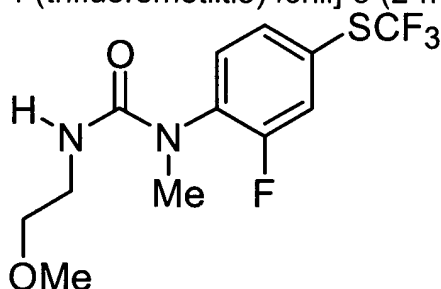


^1H -RMN (DMSO-d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,26 (3H, s), 3,68 (2H, d, $J = 4,2$ Hz), 3,81 (4H, s), 5,14 (1H, t, $J = 4,2$ Hz), 7,13 (2H, t, $J = 8,6$ Hz), 7,45 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,51 - 7,61- (2H, m), 7,66 (1H, dd, $J = 10,4$, 1,9 Hz).

5 Exemplo de Produção 18

A uma solução de 261 mg de 2-metoxietilamina em 25 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,73 mL de trietilamina e Em seguida, 1,0 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 1,06 g de 1-[(2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2-metoxietil)-1-metilureia.

15 1-[(2-Flúor-4-(trifluorometiltio) fenil]-3-(2-metoxietil)-1-metilureia



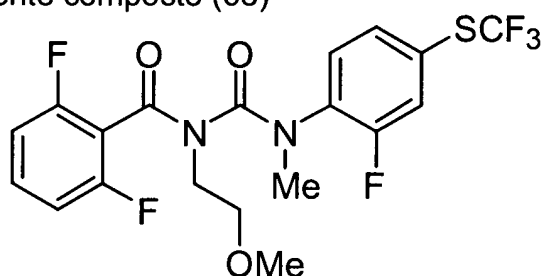
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,24 (3H, s), 3,29 (3H, s), 3,36 - 3,46 (4H, m), 4,70 (1H, br), 7,37 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,45 - 7,53 (2H, m).

Exemplo 68

A uma solução de 840 mg de 1-[(2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2-metoxietil)-1-metilureia e 0,54 mL de diisopropiletilamina em 15 mL de tolueno foram adicionados 500 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi

resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 50 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 1,04 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(2-metoxietil)-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (68)).

10 O presente composto (68)

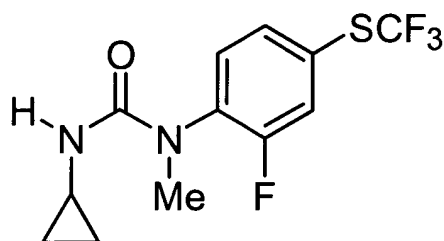


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,22 (3H, s), 3,25 (3H, s), 3,53 (2H, t, J = 5,6 Hz), 3,70 (2H, t, J = 5,6 Hz), 7,11 (2H, t, J = 8,3 Hz), 7,42 (1H, t, J = 8,1 Hz), 7,50 - 7,59 (2H, m), 7,65 (1H, dd, J = 10,1, 1,9 Hz).

15 Exemplo de Produção 19

A uma solução de 600 mg de ciclopropilamina em 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,73 mL de trietilamina e Em seguida, 1,0 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 950 mg de 3-ciclopropil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia.

25 3-Ciclopropil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia

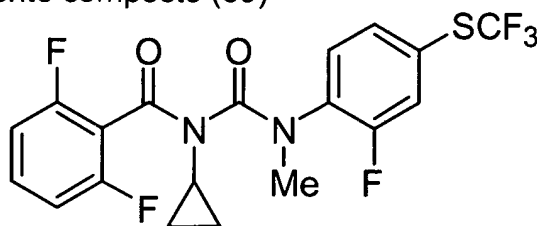


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 0,39 - 0,46 (2H, m), 0,67 - 0,74 (2H, m), 2,57 - 2,66 (1H, m), 3,23 (3H, s), 4,49 (1H, br), 7,33 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,44 - 7,52 (2H, m).

Exemplo 69

5 A uma solução de 750 mg de 3-ciclopropil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia e 0,5 mL de diisopropiletilamina em 15 mL de tolueno foram adicionados 472 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 50 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencial-
10 mente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão
15 média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 930 mg de 1-ciclopropil-1-(2,6-difluorobenzoyl)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (69)).

O presente composto (69)



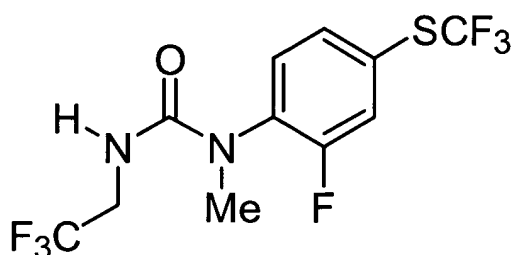
20 ^1H -RMN ($\text{DMSO}-d_6$, Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 0,60 - 0,73 (4H, m), 2,55 - 2,65 (1H, m), 3,30 (3H, s), 7,11 - (2H, t, $J = 8,3$ Hz), 7,46 - 7,63 (3H, m), 7,71 (1H, dd, $J = 10,1, 1,4$ Hz).

Exemplo de Produção 20

A uma solução de 1,03 mg de 2,2,2-trifluoroetilamina em 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,73 mL de trietilamina e Em se-

guida, 1,0 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante 24 horas. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 1,1 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)ureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)ureia

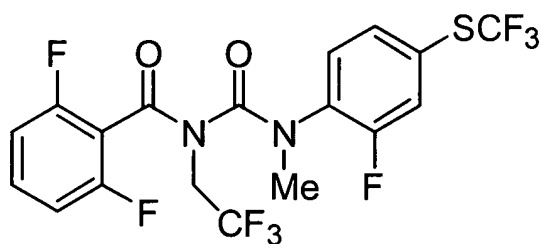


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 3,27 (3H, s), 3,81 - 3,95 (2H, m), 4,56 (1H, br), 7,38 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,48 - 7,59 (2H, m).

Exemplo 70

A uma solução de 893 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)ureia e 0,58 mL de diisopropiletilamina em 15 mL de tolueno foi adicionado 1,5 g de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 26 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 50 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 1,0 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)ureia (a seguir, referido como o presente composto (70)).

O presente composto (70)

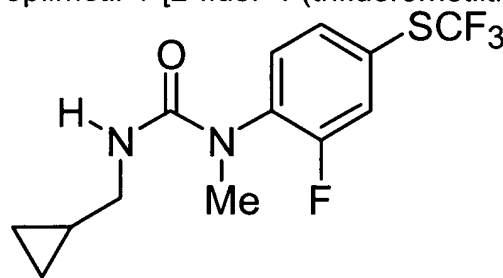


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,25 (3H, s), 4,54 (2H, q, $J = 9,1$ Hz), 7,18 (2H, t, $J = 8,7$ Hz), 7,30 (1H, t, $J = 8,1$ Hz), 7,56 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 7,59 - 7,69 (2H, m).

Exemplo de Produção 21

- 5 A uma solução de 383 mg de ciclopropilmetilamina em 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,73 mL de trietilamina e Em seguida, 1,0 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa
- 10 de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 613 mg de 3-ciclopropilmetil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia.

3-Ciclopropilmetil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia



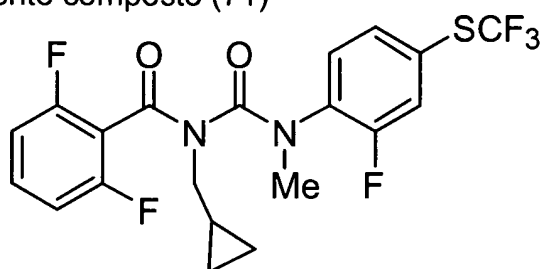
- 15 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 0,09 - 0,16 (2H, m), 0,39 - 0,48 (2H, m), 0,84 - 0,98 (1H, m), 3,09 (2H, dd, $J = 6,8, 5,8$ Hz), 3,24 (3H, s), 4,34 (1H, br), 7,37 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,44 - 7,53 (2H, m).

Exemplo 71

- A uma solução de 500 mg de 3-ciclopropilmetil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia e 0,32 mL de diisopropiletilamina em 10 mL de tolueno foram adicionadas 301 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 50 mL de éter terc-

butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 665 mg de 1-ciclopropilmetil-1-(2,6-difluorobenzil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (71))

O presente composto (71)

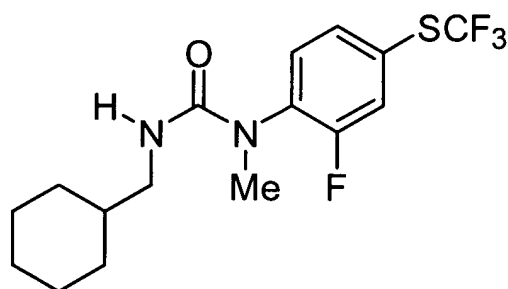


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 0,11 - 0,29 (2H, m), 0,43 - 0,59 (2H, m), 1,01 - 1,19 (1H, m), 3,29 (3H, s), 3,43 (2H, d, J = 6,8 Hz), 7,13 (2H, t, J = 8,4 Hz), 7,44 (1H, t, J = 8,0 Hz), 7,50 - 7,61- (2H, m), 7,67 (1H, dd, J = 10,2, 2,0 Hz).

Exemplo de Produção 22

A uma solução de 590 mg de cicloexilmetilamina em 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,73 mL de trietilamina e Em seguida, 1,0 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 910 mg de 3-cicloexilmetil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia.

3-Cicloexilmetil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia

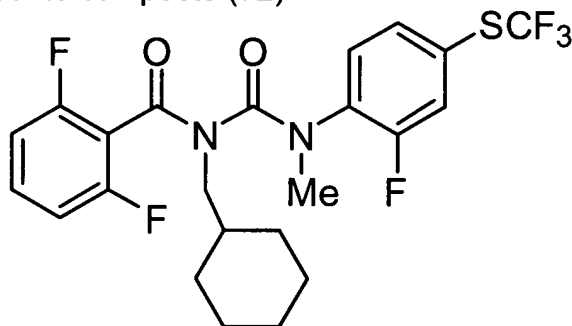


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 0,78 - 0,91 (2H, m), 1,04 - 1,27 (3H, m), 1,36 - 1,48 (1H, m), 1,59 - 1,75 (5H, m), 3,04 (2H, t, $J = 6,4$ Hz), 3,24 (3H, s), 4,31 (1H, br), 7,37 (1H, t, $J = 8,3$ Hz), 7,46 - 7,54 (2H, m).

Exemplo 72

- 5 A uma solução de 700 mg de 3-cicloexilmetil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia e 0,40 mL de diisopropiletilamina em 15 mL de tolueno foram adicionadas 373 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoila, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacio-
- 10 nal foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 50 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão
- 15 média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 690 mg de 1-cicloexilmetil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (72)).

O presente composto (72)



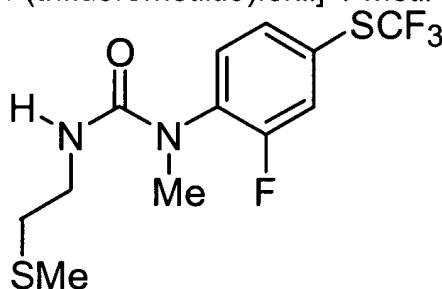
- 20 ^1H -RMN (DMSO-d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 0,81 - 0,98 (2H, m), 1,05 - 1,26 (3H, m), 1,54 - 1,80 (6H, m), 3,26 (3H, s), 3,40 (2H, d, $J = 6,3$ Hz), 7,12 (2H, t, $J = 8,3$ Hz), 7,41 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,49 - 7,62 (2H,

m), 7,69 (1H, dd, J = 10,1, 1,9 Hz).

Exemplo de Produção 23

A uma solução de 2,0 g de 2-metiltioetilamina em 80 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 3,1 mL de trietilamina e Em seguida, 4,2 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, seca-
10 para fornecer 4,5 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-metiltioetil)ureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-metiltioetil)ureia



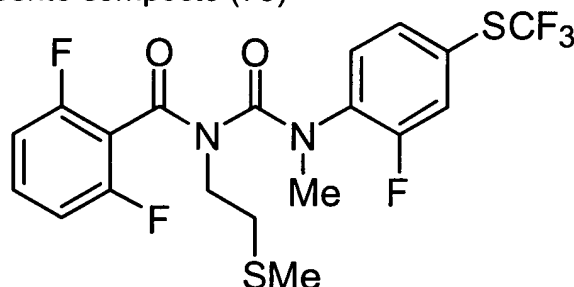
¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 2,05 (3H, s), 2,62 (2H, t, J = 6,3 Hz), 3,25 (3H, s), 3,41 (2H, q, J = 6,3 Hz), 4,76 (1H, br), 7,39 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,46 - 7,54
15 (2H, m)

Exemplo 73

A uma solução de 4,33 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-metiltioetil)ureia e 2,6 mL de diisopropiletilamina em 50 mL de tolueno foram adicionados 2,45 g de cloreto de 2,6-difluorobenzoila, e agitada durante 6 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 100 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 5,58 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-
25

3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-3-(2-metiltioetil)ureia (a seguir, referido como o presente composto (73)).

O presente composto (73)

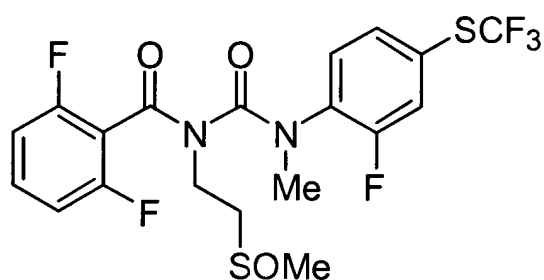


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 1,98 (3H, s),
 5 2,72 (2H, t, J = 7,4 Hz), 3,26 (3H, s), 3,71 - (2H, t, J = 7,4 Hz), 7,13 (2H, t, J = 8,5 Hz), 7,40 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,52 - 7,62 (2H, m), 7,67 (1H, dd, J = 10,1, 1,9 Hz).

Exemplos 74 e 75

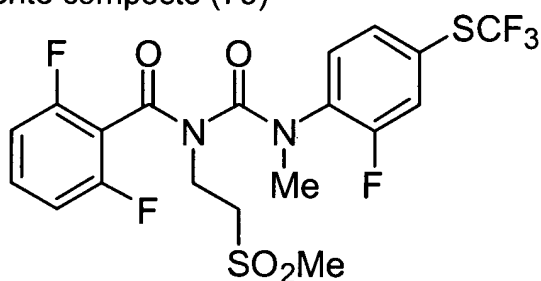
A uma solução de 2,00 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-3-(2-metiltioetil)ureia em 35 mL de clorofórmio
 10 que foi resfriada para 5°C foi adicionado 1,63 g de ácido metacloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso), e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma
 15 solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 50: 50) para fornecer 794 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-3-(2-
 20 metilsulfoniletil)ureia (a seguir, referido como o presente composto (74)) e 1,29 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-3-(2-metilsulfoniletil)ureia (a seguir, referido como o presente composto (75)).

O presente composto (74)



^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 2,57 (3H, s), 2,96 (1H, dt, $J = 13,4, 7,2$ Hz), 3,13 (1H, dt, $J = 13,4, 7,2$ Hz), 3,25 (3H, s), 3,96 (2H, t, $J = 7,2$ Hz), 7,13 (2H, t, $J = 8,3$ Hz), 7,38 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,53 - 7,62 (2H, m), 7,66 (1H, dd, $J = 10,1, 1,9$ Hz).

5 O presente composto (75)



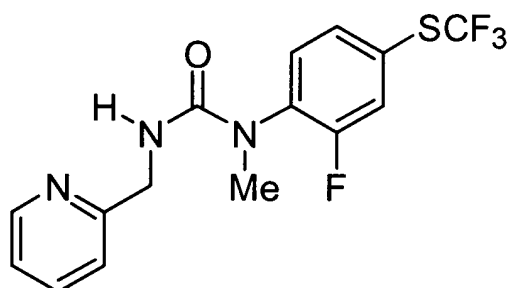
^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,03 (3H, s), 3,24 (3H, s), 3,48 (2H, t, $J = 7,5$ Hz), 4,02 (2H, t, $J = 7,5$ Hz), 7,13 (2H, t, $J = 8,6$ Hz), 7,33 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,51 - 7,69 (3H, m).

Exemplo de Produção 24

10 A uma solução de 1,2 g de 2-piridilmetilamina em 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 1,2 mL de trietilamina e Em seguida, 1,5 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada

15 sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila) para fornecer 1,55 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-piridilmetil)ureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-piridilmetil)ureia

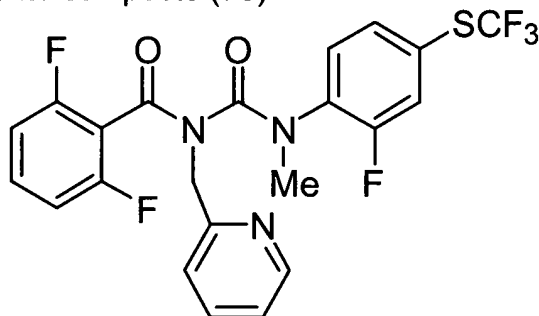


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,29 (3H, s), 4,52 (2H, d, $J = 5,1$ Hz), 5,67 (1H, br), 7,15 (1H, dd, $J = 7,7, 5,1$ Hz), 7,27 (1H, d, $J = 7,7$ Hz), 7,43 (1H, t, $J = 8,1$ Hz), 7,47 - 7,53 (2H, m), 7,64 (1H, td, $J = 7,7, 1,8$ Hz), 8,41 (1H, dd, $J = 5,1, 1,8$ Hz).

5 Exemplo 76

A uma solução de 1,46 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-piridilmetil)ureia e 0,85 mL de diisopropiletilamina em 20 mL de tolueno foram adicionadas 789 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 70 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 66: 34) para fornecer 1,55 g de 1-(2,6-difluorobenzoyl)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(2-piridilmetil)ureia (a seguir, referido como o presente composto (76)).

O presente composto (76)



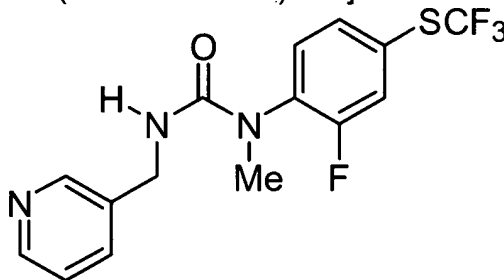
^1H -RMN ($\text{DMSO}-d_6$, Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,28 (3H, s), 4,87 (2H, s), 7,06 (2H, t, $J = 8,7$ Hz), 7,25 (1H, dd, $J = 7,7, 4,9$ Hz), 7,33 (1H, d, $J = 7,7$ Hz), 7,44 (1H, t, $J = 8,1$ Hz), 7,47 - 7,57 (2H, m), 7,63 (1H, dd, $J =$

10,1, 1,9 Hz), 7,73 (1H, td, J = 7,7, 1,5 Hz), 8,46 (1H, dd, J = 4,9, 1,5 Hz).

Exemplo de Produção 25

A uma solução de 1,13 g de 3-piridilmetilamina em 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 1,1 mL de trietilamina e Em seguida, 1,5 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila) para fornecer 1,55 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(3-piridilmetil)ureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(3-piridilmetil)ureia



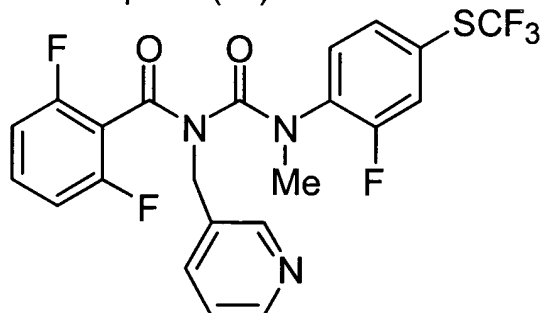
¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 3,27 (3H, s), 4,43 (2H, d, J = 6,0 Hz), 4,73 (1H, br), 7,22 - 7,28 (1H, m), 7,37 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,45 - 7,53 (2H, m), 7,60 - 7,66 (1H, m), 8,46 - 8,52 (2H, m).

Exemplo 77

A uma solução de 1,32 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(3-piridilmetil)ureia e 0,77 mL de diisopropiletilamina em 20 mL de tolueno foram adicionados 713 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoila, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 70 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 50: 50) para fornecer 1,55 g de 1-(2,6-

difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(3-piridilmetil) ureia (a seguir, referido como o presente composto (77)).

O presente composto (77)

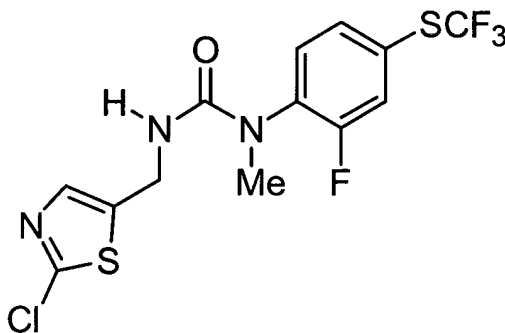


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,26 (3H, s),
 5 4,82 (2H, s), 7,07 (2H, t, J = 8,5 Hz), 7,24 - 7,36 (2H, m), 7,49 - 7,59 (2H, m),
 7,65 (1H, dd, J = 10,1, 1,9 Hz), 7,71 (1H, d, J = 8,0 Hz), 8,42 - 8,50 (2H, m).

Exemplo de Produção 26

A uma solução de 775 mg de 5-aminometil-2-clorotiazol em 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,7 mL de trietilamina e Em
 10 seguida, 1,0 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A
 solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solu-
 15 ção salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concen-
 trada sob pressão reduzida para fornecer 1,20 g de 3-[2-clorotiazol-5-il)metil]-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia.

3-[2-Clorotiazol-5-il)metil]-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia



¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 3,26 (3H, s), 4,47 (2H, d, J = 5,7 Hz), 4,79 (1H,
 20 br), 7,32 (1H, s), 7,35 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,47 - 7,54 (2H, m).

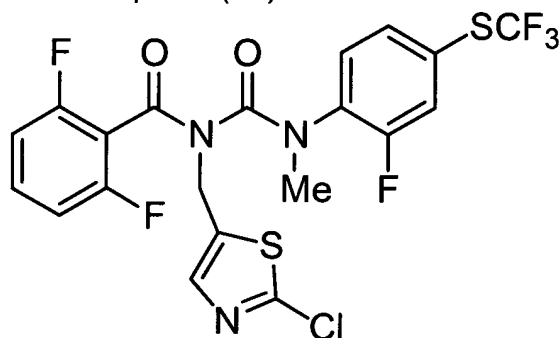
Exemplo 78

A uma solução de 994 mg de 3-[2-clorotiazol-5-il]metil]-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia e 1,0 mL de diisopropiletilamina em 20 mL de tolueno foram adicionadas 983 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacio-

5 nal foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 80 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purifica-

10 do por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 1,30 g de 1-[(2-clorotiazol-5-il)metil]-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (78)).

O presente composto (78)



15 ¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,25 (3H, s), 4,96 (2H, s), 7,10 (2H, t, J = 8,5 Hz), 7,26 (1H, t, J = 8,3 Hz), 7,39 (1H, s), 7,48 - 7,68 (3H, m).

Exemplo de Produção 27

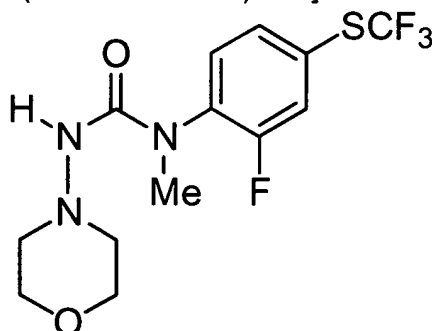
A uma solução de 533 mg de 1-aminomorfolina em 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 1,5 mL de trietilamina e Em seguida,

20 1,0 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante 16 horas. A solução reacional foi lavada sequencialmente com água e uma solução aquosa de bicarbonato de sódio saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada

25 sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila)

para fornecer 1,02 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-morfolinourea.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3 -morfolinourea

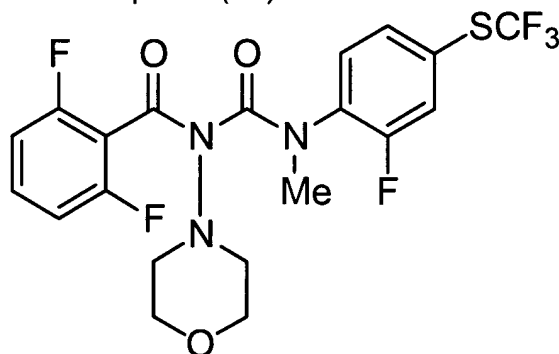


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 2,57 (4H, t, J = 4,6 Hz), 3,22 (3H, s), 3,46 (4H, t, J = 4,6 Hz), 5,15 (1H, br), 7,30 (1H, t, J = 8,1 Hz), 7,43 - 7,52 (2H, m).

Exemplo 79

A uma solução de 800 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-morfolinourea e 1,0 mL de diisopropiletilamina em 20 mL de tolueno foram adicionados 800 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 80 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 1,02 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-morfolinourea (a seguir, referido como o presente composto (79)).

O presente composto (79)

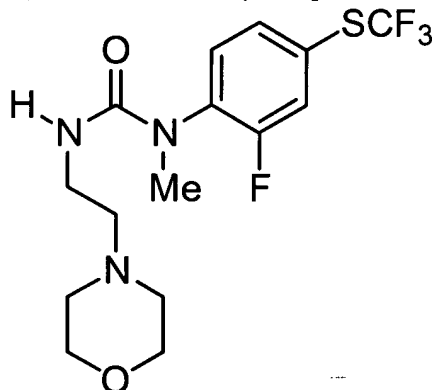


^1H -RMN (DMSO-d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 2,94 - 3,11 (4H, br), 3,22 - 3,43 (4H, br), 3,30 (3H, s), 7,11 - (2H, t, $J = 8,6$ Hz), 7,47 - 7,63 (3H, m), 7,74 (1H, dd, $J = 10,1, 1,9$ Hz).

Exemplo de Produção 28

- 5 A uma solução de 1,03 g de 1-(aminoetil)morfolina em 30 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 1,5 mL de trietilamina e Em seguida, 1,0 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e agitada em temperatura ambiente durante 3 horas. A solução reacional foi lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O
- 10 resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila) para fornecer 1,23 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-morfolinoetil)ureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-morfolinoetil)ureia



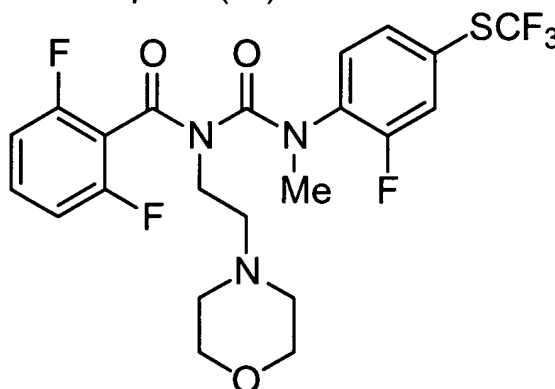
- 15 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,32 - 2,38 (4H, br), 2,42 (2H, t, $J = 6,0$ Hz), 3,25 (3H, s), 3,27 - 3,33 (2H, m), 3,47 - 3,59 (4H, br), 5,02 (1H, br), 7,38 (1H, t, $J = 8,3$ Hz), 7,48 - 7,54 (2H, m).

Exemplo 80

- A uma solução de 1,0 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(2-morfolinoetil)ureia e 1,0 mL de diisopropiletilamina em 15 mL de tolueno foram adicionadas 694 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoila, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 50 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencial-
- 25 mente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio sa-

turada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 66: 34) para fornecer 1,30 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(2-morfolinoetil)ureia (a seguir, referido como o presente composto (80)).

O presente composto (80)

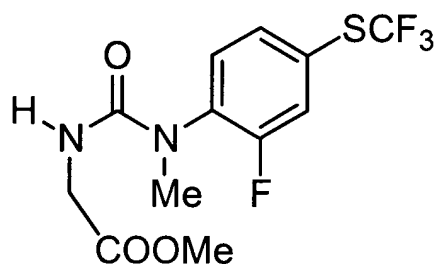


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 2,28 - 2,40 (4H, br), 2,53 (2H, t, $J = 6,2$ Hz), 3,28 (3H, s), 3,53 (4H, t, $J = 4,6$ Hz), 3,62 - 3,74 (2H, br), 7,13 (2H, t, $J = 8,5$ Hz), 7,48 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,52 - 7,61- (2H, m), 7,66 (1H, dd, $J = 10,1, 1,9$ Hz).

Exemplo de Produção 29

A uma mistura de 655 mg de hidrocloreto de glicina metil éster, 30 mL de éter terc-butilmetílico e 1,5 mL de trietilamina foi adicionado 1,0 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A solução reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 1,20 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metoxycarbonilmetil-1-metilureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metoxycarbonilmetil-1-metilureia

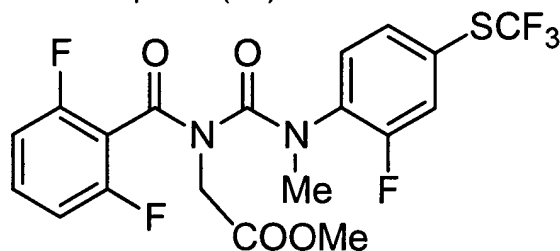


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,26 (3H, s), 3,73 (3H, s), 4,00 (2H, d, $J = 5,4$ Hz), 4,80 (1H, br), 7,43 - 7,55 (3H, m).

Exemplo 81

A uma solução de 904 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metoxicarbonilmetil-1-metilureia e 0,9 mL de diisopropiletilamina em 20 mL de tolueno foram adicionadas 704 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante 3 horas com aquecimento até o refluxo. A solução reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela 50 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 817 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metoxicarbonilmetil-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (81)).

O presente composto (81)



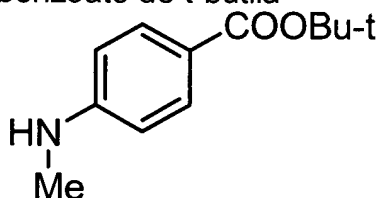
^1H -RMN (DMSO-d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,24 (3H, s), 3,65 (3H, s), 4,37 (2H, s), 7,10 (2H, t, $J = 8,5$ Hz), 7,42 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,49 - 7,59 (2H, m), 7,62 (1H, dd, $J = 10,1, 1,9$ Hz).

Exemplo de Produção 30

A uma mistura de 1,00 g de 4-aminobenzoato de t-butila e 0,23 g de paraformaldeído (conteúdo; 90% em peso) em 5 mL de metanol foi adi-

cionada uma mistura de 4,91 g de uma solução de metilato de sódio-metanol a 28% e 2 mL de metanol, e agitada em temperatura ambiente durante 18 horas. A mistura reacional foi vertida em 15 mL de água gelada, e Em seguida, extraída com 20 mL de clorofórmio. A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para obter um resíduo. O resíduo foi dissolvido em 20 mL de etanol, e a ele 0,43 g de boroidreto de sódio (conteúdo; 90% em peso) foi adicionado. A mistura foi aquecida em refluxo durante 30 minutos. A mistura reacional foi deixada resfriar para a temperatura ambiente e Em seguida, concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foram adicionados 20 mL de água e 20 mL de clorofórmio, e Em seguida, as camadas separadas. A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: hexano = 1: 5) para fornecer 0,73 g de 4-metilaminobenzoato de t-butila.

4-Metilaminobenzoato de t-butila

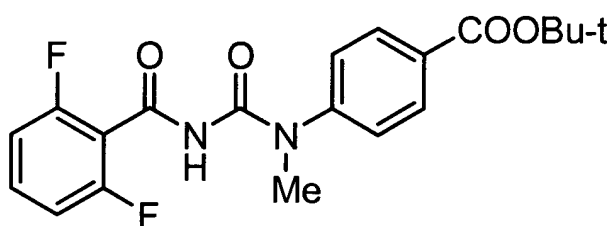


$^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3) δ (ppm): 1,58 (9H, s), 2,88 (3H, brs), 4,12 (1H, br), 6,52 - 6,55 (2H, m), 7,81 - 7,84 (2H, m).

Exemplo 82

Uma solução de 0,64 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 0,5 mL de éter dietílico foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 0,73 g de 4-metilaminobenzoato de t-butila em 3,5 mL de éter dietílico, e agitada durante uma hora. Em seguida, 3,5 mL de hexano foram adicionados a ela, e um sólido produzido foi coletado por filtração e secado para fornecer 1,20 g de 1-[4-(t-butoxicarbonil)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (82)).

O presente composto (82)

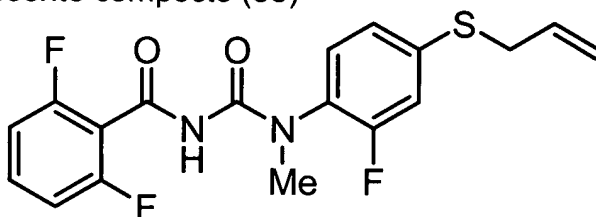


^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 1,57 (9H, s), 3,28 (3H, s), 7,13 - 7,19 (2H, m), 7,38 - 7,41 (2H, m), 7,48 - 7,56 (1H, m), 7,89 - 7,92 (2H, m), 10,74 (1H, brs).

Exemplo 83

Uma solução de 3,78 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoila em
 5 3,0 mL de éter dietílico foi adicionada em temperatura ambiente a uma solu-
 ção de 3,79 g de 2-flúor-N-metil-4-(2-propeniltio)anilina em 18 mL de éter
 dietílico, e agitada durante uma hora. Um sólido produzido foi coletado por
 filtração, e secado para fornecer 5,83 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-flúor-
 4-(2-propeniltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente com-
 10 posto (83)).

O presente composto (83)



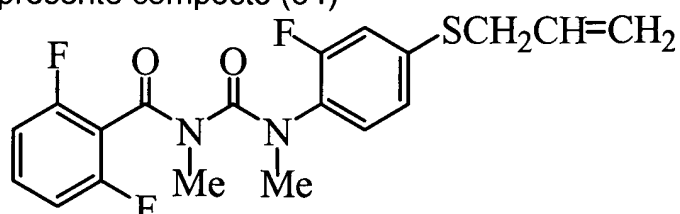
^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,15 (3H, s), 3,72 - 3,74 (2H, s), 5,10 - 5,13
 (1H, m), 5,27 - 5,32 (1H, m), 5,79 - 5,88 (1H, m), 7,11 - 7,17 (3H, m), 7,26 -
 7,30 (2H, m), 7,46 - 7,52 (1H, m), 10,70 (1H, br).

15 Exemplo 84

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-flúor-4-
 (2-propeniltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram
 adicionados 126 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a
 2°C, e agitada durante 30 minutos. A ela 0,39 mL de iodeto de metila foi adi-
 20 cionado a 1°C, e a mistura foi agitada durante 3 horas a 2-3°C. A uma mistu-
 ra reacional foi adicionada uma mistura de 10 mL de uma solução aquosa de
 cloreto de amônio saturada e 10 mL de água sob resfriamento, e a mistura
 foi extraída com 20 mL de acetato de etila três vezes. As camadas orgânicas
 foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada,
 25 secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão

reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,66 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(2-propeniltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (84)).

5 O presente composto (84)

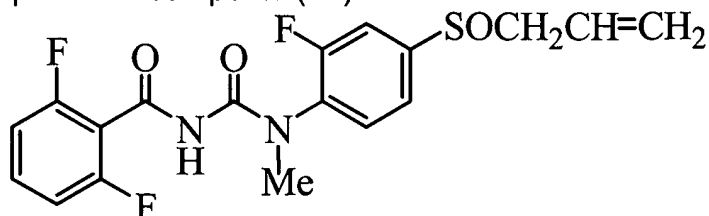


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,04 (3H, s), 3,26 (3H, brs), 3,56 - 3,58 (2H, m), 5,12 - 5,25 (2H, m), 5,82 - 5,92 (1H, m), 6,87 - 6,92 (2H, m), 7,06 - 7,11 (3H, m), 7,31 - 7,38 (1H, m).

Exemplo 85

10 A uma solução de 0,50 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2-propeniltio)fenil]-1-metilureia em 5,0 mL de clorofórmio foi adicionado 0,35 g de ácido meta-cloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso) sob resfriamento, e agitada durante uma hora. A uma mistura reacional foi adicionada 5 mL de clorofórmio. A mistura reacional foi lavada três vezes com 10 mL de uma
15 solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: hexano = 2: 1) para fornecer 0,45 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2-propenilsulfinil)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente com-
20 posto (85)).

O presente composto (85)

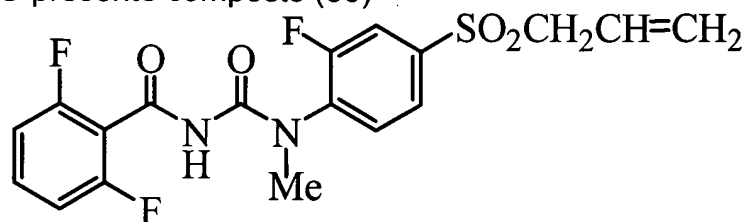


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,28 (3H, s), 3,49 - 3,64 (2H, m), 5,24 - 5,41 (2H, m), 5,61 - 5,72 (1H, m), 6,93 - 6,97 (2H, m), 7,38 - 7,43 (2H, m), 7,49 - 7,53 (2H, m), 8,03 (1H, brs).

25 Exemplo 86

A uma solução de 0,50 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2-propenilsulfonil)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de clorofórmio foi adicionado 0,77 g de ácido meta-cloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso) sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante duas horas. À solução reacional foram adicionados 10 mL de clorofórmio. A mistura foi lavada três vezes com 20 mL de uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: hexano = 1: 1) para fornecer 0,41 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2-propenilsulfonil)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (86)).

O presente composto (86)



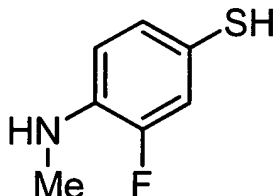
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,29 (3H, s), 3,80 - 3,81 (2H,d), 5,20 - 5,39 (2H, m), 5,72 - 5,83 (1H, m), 6,92 - 6,97 (2H, m), 7,37 - 7,44 (1H, m), 7,53 - 7,57 (1H, m), 7,68 - 7,72 (2H, m), 8,28 (1H, brs).

Exemplo de Produção 31

A uma mistura de 15 g de 2-flúor-N-metilanilina e 31,0 g de tiocianato de sódio em 90 mL de metanol foi adicionada gota a gota uma mistura de 6,8 mL de bromo e 60 mL de uma solução de brometo de sódio-metanol saturada a -18°C . A mistura obtida foi agitada a -5°C durante duas horas, vertida em 240 mL de água gelada, e Em seguida, ajustada para pH 8 por uma adição de 45 g de carbonato de sódio. A solução reacional foi extraída duas vezes com 90 mL de clorofórmio. As camadas orgânicas foram combinadas, e secadas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi adicionado a 40 mL de água, e 30,0 g de monohidrato de sulfeto de sódio foram adicionados a ele. A mistura foi aquecida em refluxo durante duas horas, e Em seguida, deixada resfriar para a temperatura ambiente. A mistura reacional foi ajustada para pH 5 por uma

adição de 8,0 mL de ácido acético, e extraída três vezes com 80 mL de clorofórmio. As camadas orgânicas foram combinadas, e secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida para fornecer 21,7 g de 3-flúor-4-metilaminobenzenotiol.

5 3-Flúor-4-metilaminobenzenotiol

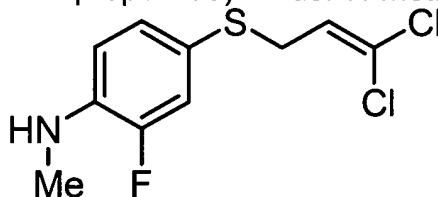


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,86 (1H, brs), 2,88 (3H, s), 4,19 (1H, br), 6,51 - 6,61 (1H, m), 7,10 - 7,18 (2H, m).

Exemplo de Produção 32

A uma solução de 5,00 g de 3-flúor-4-metilaminobenzenotiol em
10 50 mL de N,N-dimetilformamida foram adicionados 3,6 mL de 1,1,3-tricloro-1-propeno e 4,80 g de carbonato de potássio, e agitada em temperatura ambiente durante dois dias. A mistura reacional foi filtrada, e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para obter um resíduo. O resíduo foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: hexano = 1: 10) para fornecer 1,76 g de 4-(3,3-dicloro-2-propeniltio)-2-flúor-N-metilanilina.

4-(3,3-dicloro-2-propeniltio)-2-flúor-N-metilanilina



^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,89 (3H, s), 3,46 (2H, d, $J = 8,0$ Hz), 4,06 (1H, br), 5,92 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 6,58 - 6,62 (1H, m), 7,08 - 7,17 (2H, m).

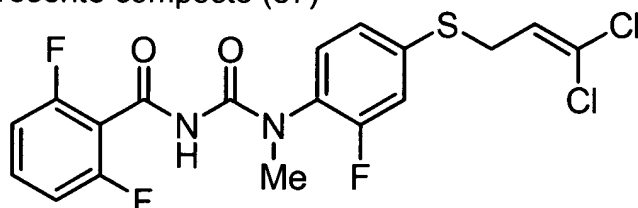
Exemplo 87

20 Uma solução de 1,21 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 1,0 mL de éter dietílico foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 1,76 g de 4-(3,3-dicloro-2-propeniltio)-2-flúor-N-metilanilina em 8,0 mL de éter dietílico, e agitada durante duas horas. Em seguida, 9,0 mL de hexano foram adicionados a ela, e um sólido produzido foi coletado por filtração e secado para fornecer 1,96 g de 1-[4-(3,3-dicloro-2-propeniltio)-2-

25

fluorofenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (87)).

O presente composto (87)

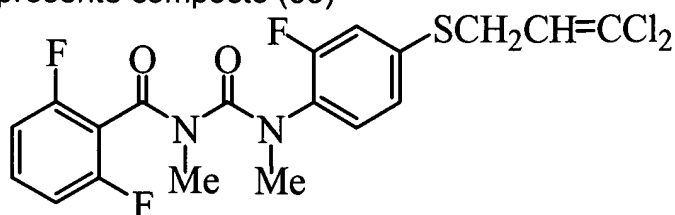


¹H-RMN (DMSO-d₆) δ (ppm): 3,16 (3H, s), 3,82 (2H, d, J = 7,7 Hz), 6,29 (1H, t, J = 7,7 Hz), 7,11 - 7,15 (2H, m), 7,20 - 7,23 (1H, m), 7,31 - 7,50 (3H, m), 10,71 (1H, brs).

Exemplo 88

A uma solução de 1,01 g de 1-[4-(3,3-dicloro-2-propeniltio)-2-fluorofenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 112 mg de hidróxido de sódio a 1°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,33 mL de iodeto de metila foi adicionado a 1°C a ela. A mistura obtida foi agitada a 2-3°C durante três horas. A uma mistura reacional foi adicionada uma mistura de 10 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10 mL de água sob resfriamento, e extraída três vezes com 20 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,65 g de 1-[4-(3,3-dicloro-2-propeniltio)-2-fluorofenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1,3-dimetilureia (a seguir referido como o presente composto (88)).

O presente composto (88)

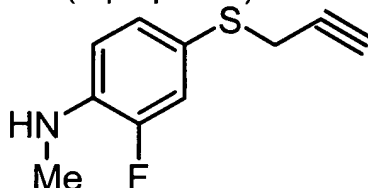


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 3,06 (3H, s), 3,29 (3H, brs), 3,66 (2H, d), 5,97 (1H, t), 6,88 - 6,92 (2H, m), 7,10 - 7,15 (3H, m), 7,31 - 7,39 (1H, m).

Exemplo de Produção 33

A uma solução de 6,09 g de 3-flúor-4-metilaminobenzenotiol em 60 mL de acetona foram adicionados 3,2 mL de brometo de propargila e 10,7 g de carbonato de potássio, e aquecida a 50°C durante 6 horas. A mistura reacional foi deixada resfriar para a temperatura ambiente e Em seguida, filtrada. O filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para obter um resíduo. O resíduo foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: hexano = 1: 10) para fornecer, 1,28 g de 2-flúor-N-metil-4-(2-propiniltio)anilina.

2-Flúor-N-metil-4-(2-propiniltio)anilina

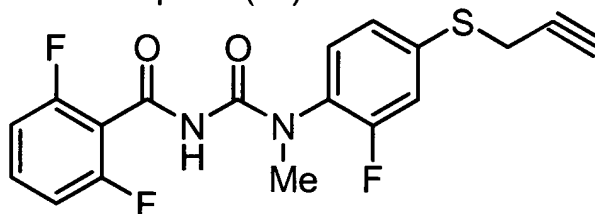


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 2,23 (1H, t, J = 4,0 Hz), 2,89 (3H, s), 3,45 (2H, d, J = 4,0 Hz), 4,11 (1H, br), 6,60 - 6,64 (1H, m), 7,19 - 7,26 (2H, m).

Exemplo 89

Uma solução de 1,20 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 1,0 mL de éter dietílico foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 1,28 g de 2-flúor-N-metil-4-(2-propiniltio)anilina em 6,0 mL de éter dietílico, e agitada durante 17 horas. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida para obter um resíduo. O resíduo foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: hexano = 1: 10) para fornecer 1,75 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2-propiniltio)fenil]-1-metilureia (a seguir referido como o presente composto (89)).

O presente composto (89)



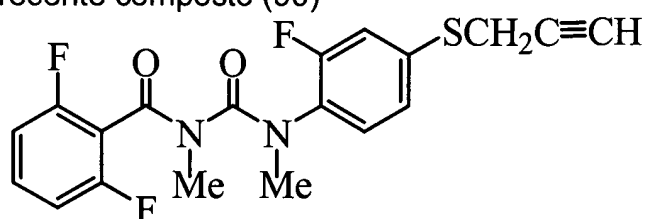
¹H-RMN (DMSO-d₆) δ (ppm): 3,16 (3H, s), 3,20 (1H, t, J = 2,5 Hz), 3,94 (2H, d, J = 2,5 Hz), 7,11 - 7,16 (2H, m), 7,21 - 7,24 (1H, m), 7,31 - 7,38 (2H, m), 7,48 - 7,52 (1H, m), 10,74 (1H, brs).

Exemplo 90

A uma solução de 0,50 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2-propiniltio)fenil]-1-metilureia em 5,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionadas 70 mg de hidróxido de sódio a 2°C, e Em seguida, agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,20 mL de iodeto de metila foi adicionado a 1°C a
 5 ela. A mistura obtida foi agitada a 2-3°C durante duas horas. A uma mistura reacional foi adicionada uma mistura de 5 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 5 mL de água sob resfriamento, e extraída três vezes com 10 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre
 10 sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,43 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(2-propiniltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir referido como o presente composto (90)).

15

O presente composto (90)



^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,02 (3H, brs), 3,03 (1H, brs), 3,20 (3H, s), 3,86 (2H, m), 7,09 - 7,16 (2H, m), 7,18 - 7,23 (2H, m), 7,31 - 7,34 (1H, m), 7,48 - 7,56 (1H, m).

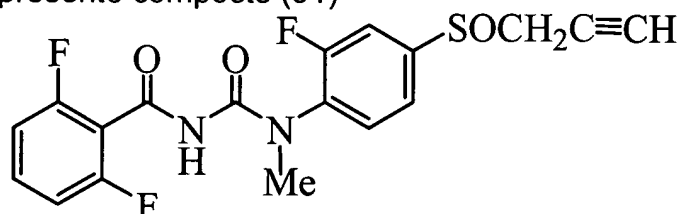
Exemplo 91

20

A uma solução de 0,50 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2-propiniltio)fenil]-1-metilureia em 5,0 mL de clorofórmio foi adicionado 0,35 g de ácido meta-cloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso) sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante 0,5 horas. À solução reacional foram adicionados 5 mL de clorofórmio. A mistura reacional foi lavada
 25 três vezes com 10 mL de uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: hexano = 1: 1) para fornecer 0,38 g de 3-(2,6-

difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2-propinilsulfinil)fenil]-1-metilureia (a seguir referido como o presente composto (91)).

O presente composto (91)

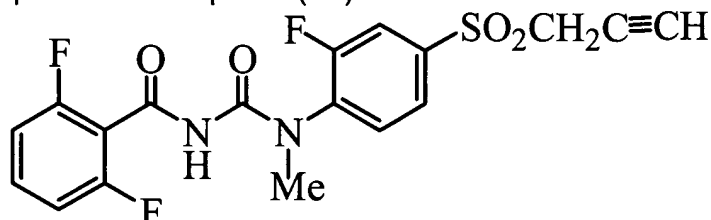


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 2,42 (1H, t, J = 2,7Hz), 3,28 (3H, s), 3,64 - 3,76 (2H, m), 6,93 - 6,97 (2H, m), 7,36 - 7,43 (1H, m), 7,51 - 7,57 (2H, m), 7,61 - 7,64 (1H, m), 8,07 (1H, brs).

Exemplo 92

A uma solução de 0,50 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2-propiniltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de clorofórmio foi adicionado 0,77 g de ácido meta-cloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso) sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante duas horas. À solução reacional foram adicionados 10 mL de clorofórmio. A mistura foi lavada três vezes com 20 mL de uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: hexano = 1: 1) para fornecer 0,42 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(2-propinilsulfonyl)fenil]-1-metilureia (a seguir referido como o presente composto (92)).

O presente composto (92)



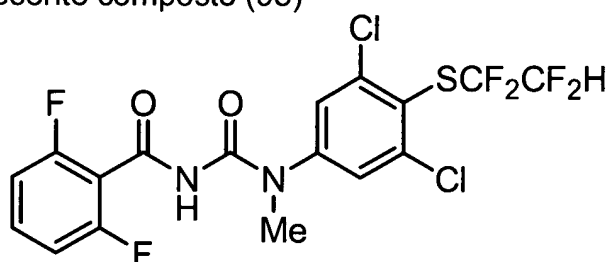
¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 2,42 (1H, t, J = 2,7Hz), 3,31 (3H, s), 3,99 (2H, d, J = 2,7Hz), 6,93 - 6,97 (2H, m), 7,37 - 7,44 (1H, m), 7,57 - 7,61 (1H, m), 7,82 - 7,86 (2H, m), 8,09 (1H, brs).

Exemplo 93

Uma solução de 1,97 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoila em 1,0 mL de éter dietílico foi adicionada a uma solução de 3,32 g de 3,5-

dicloro-N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)anilina em 10 mL de éter dietílico em temperatura ambiente, e agitada durante uma hora. A uma mistura reacional foram adicionados 22 mL de hexano, e um sólido produzido foi coletado por filtração e Em seguida, secado para fornecer 4,17 g de 1-[3,5-dicloro-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metilureia (a seguir referido como o presente composto (93)).

O presente composto (93)

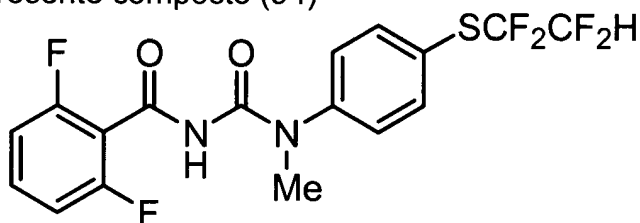


^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,32 (3H, s), 6,66 - 6,93 (1H, m), 7,15 - 7,19 (2H, m), 7,52 - 7,57 (1H, m), 7,70 - 7,72 (2H, m), 11,05 (1H, brs).

Exemplo 94

Uma solução de 0,53 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 0,5 mL de éter dietílico foi adicionada a uma solução de 0,70 g de N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)anilina em 3,5 mL de éter dietílico em temperatura ambiente, e agitada durante uma hora. A uma mistura reacional foram adicionados 4,0 mL de hexano, e um sólido produzido foi coletado por filtração e Em seguida, secado para fornecer 1,15 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metil-1-[4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]ureia (a seguir referido como o presente composto (94)).

O presente composto (94)



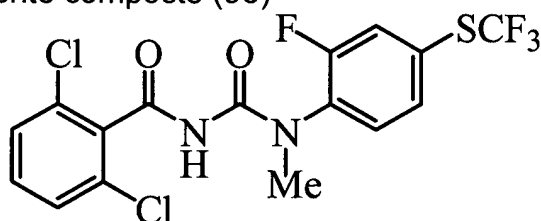
^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,29 (3H, s), 6,56 - 6,83 (1H, m), 7,13 - 7,17 (2H, m), 7,41 - 7,44 (2H, m), 7,48 - 7,55 (1H, m), 7,67 - 7,69 (2H, m), 10,79 (1H, brs).

Exemplo 95

A uma solução de 0,8 g de 2-fluór-N-metil-4-

(trifluorometiltio)anilina em 3,2 mL de éter dietílico foi adicionada uma solução de 0,77 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoila em 0,8 mL de éter dietílico sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante duas horas. A mistura reacional foi concentrada para obter um resíduo. O resíduo foi
 5 purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 1,43 g de 3-(2,6-diclorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir referido como o presente composto (95)).

O presente composto (95)

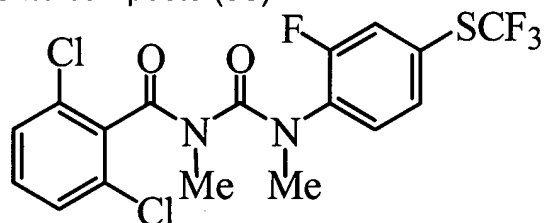


10 ^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,22 (3H, brs), 7,38 - 7,47 (3H,m), 7,56 - 7,63 (2H, m), 7,76 - 7,78 (1H, m), 10,80 (1H, brs).

Exemplo 96

A uma solução de 1,24 g de 3-(2,6-diclorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 12,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram
 15 adicionados 135 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,42 mL de iodeto de metila foi adicionado a 1,5°C a ela. A mistura foi agitada a 2-3°C durante três horas, e uma mistura de 12,0 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 12,0 mL de água foi adicionada à mistura reacional sob resfriamen-
 20 to. A mistura foi extraída três vezes com 24 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) e Em seguida,
 25 purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 15: 85) para fornecer 0,22 g de 1-(2,6-diclorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (96)).

O presente composto (96)

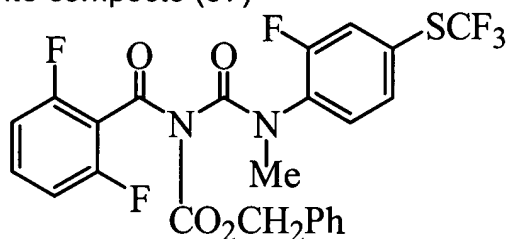


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 2,87 (3H, brs), 3,33 (3H, brs), 7,45 (3H, m), 7,57 - 7,59 (1H, m), 7,64 - 7,71 (2H, m).

Exemplo 97

- 5 A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 118 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C , e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 1,68 mL de clorocarbonato de benzila a 50% foi adicionado a 2°C a ela e agitado em temperatura ambiente durante 17 horas. A mistura reacional foi vertida em 10 mL de água ge-
- 10 lada e Em seguida, extraída três vezes com 20 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia
- 15 de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,52 g de 1-benziloxicarbonil-1-(2,6-difluorobenzoyl)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (97)).

O presente composto (97)



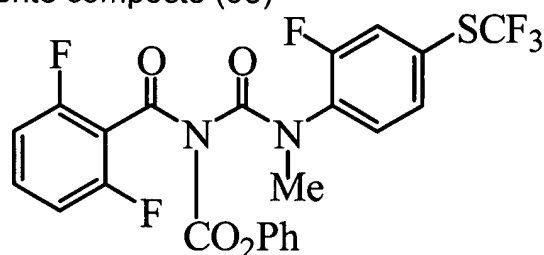
- 20 ^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,33 (3H, s), 5,17 (2H, s), 7,00 - 7,04 (2H, m), 7,23 - 7,25 (2H, m), 7,35 - 7,36 (3H, m), 7,41 - 7,45 (1H, m), 7,49 - 7,55 (2H, m), 7,69 - 7,72 (1H, m).

Exemplo 98

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-flúor-4-

(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 118 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 1°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,74 mL de clorocarbonato de fenila foi adicionado a 2°C a ela e agitado em temperatura ambiente durante 4 horas. A mistura reacional foi vertida em 10 mL de água gelada e Em seguida, extraída três vezes com 20 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) e Em seguida, purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 15: 85) para fornecer 0,45 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-fenoxycarbonilureia (a seguir, referido como o presente composto (98)).

O presente composto (98)



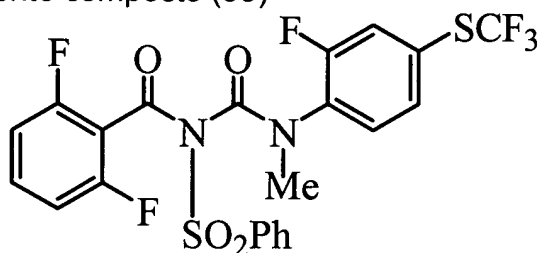
¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,45 (3H, s), 7,04 - 7,12 (4H, m), 7,29 - 7,32 (1H, m), 7,40 - 7,44 (2H, m), 7,51 - 7,57 (1H, m), 7,60 - 7,69 (2H, m), 7,81 - 7,83 (1H, m).

Exemplo 99

A uma solução de 3,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 30,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 353 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 1,5°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 2,25 mL de cloreto de benzenossulfonila foram adicionados a 1,5°C a ela e agitados em temperatura ambiente durante 22 horas. A mistura reacional foi vertida em 30 mL de água gelada e Em seguida, extraída três vezes com 60 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e con-

centradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) e Em seguida, purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 15: 85) para fornecer
 5 0,28 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-fenoxisulfonilureia (a seguir, referido como o presente composto (99)).

O presente composto (99)

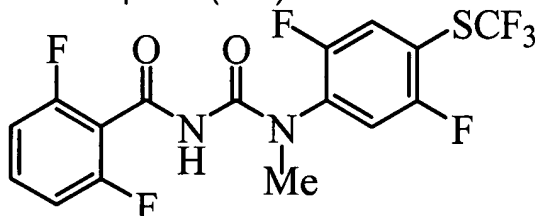


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,49 (3H, s), 7,01 - 7,06 (2H, m), 7,52 - 7,65 (5H, m), 7,74 - 7,83 (4H, m).

10 Exemplo 100

A uma solução de 2,33 g de 2,5-difluoro-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina em 8,0 mL de éter dietílico foi adicionada uma solução de 1,75 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 2,0 mL de éter dietílico sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante duas horas. A mistura reacional foi colocada sob resfriamento e a ela hexano foi adicionado em porções. Um pó branco depositado foi coletado por filtração para fornecer
 15 3,54 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2,5-difluoro-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (100)).

20 O presente composto (100)



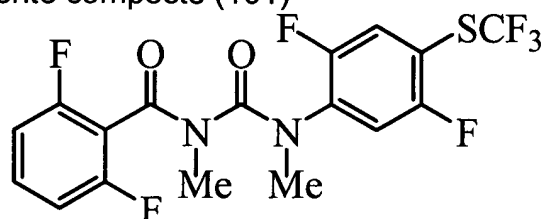
^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,26 (3H, s), 7,12 - 7,16 (2H, m), 7,47 - 7,55 (1H, m), 7,68 - 7,72 (1H, m), 7,89 - 7,93 (1H, m), 10,98 (1H, brs).

Exemplo 101

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2,5-

difluoro-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 113 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 3°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,35 mL de iodeto de metila foi adicionado a 1°C a ela. A mistura obtida foi agitada a 2-3°C durante três horas, e uma mistura de 10 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10 mL de água foi adicionada à mistura reacional sob resfriamento. A mistura foi extraída três vezes com 20 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,63 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2,5-difluoro-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (101)).

O presente composto (101)

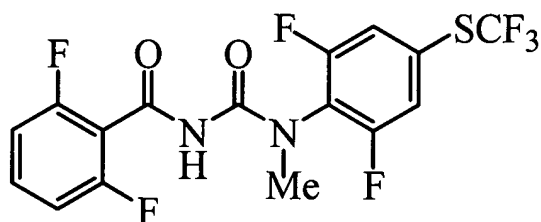


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,08 (3H, s), 3,28 (3H, s), 7,08 - 7,13 (2H, m), 7,44 - 7,58 (2H, m), 7,77 - 7,81 (1H, m).

Exemplo 102

A uma solução de 1,20 g de 2,6-difluoro-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina em 4,8 mL de éter dietílico foi adicionada uma solução de 0,90 g de isocianato de 2,6-difluorobenzóila em 1,2 mL de éter dietílico sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante 0,5 horas. Um pó branco depositado foi coletado por filtração para fornecer 1,76 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2,6-difluoro-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir referido como o presente composto (102)).

O presente composto (102)

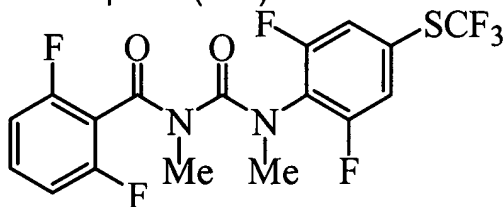


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,20 (3H, s), 7,05 - 7,09 (2H, m), 7,44 - 7,51 (1H, m), 7,58 - 7,60 (2H, m), 10,79 (1H, brs).

Exemplo 103

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2,6-difluoro-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 113 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 1°C , e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,35 mL de iodeto de metila foi adicionado a 1°C a ela. A mistura obtida foi agitada a $2-3^\circ\text{C}$ durante quatro horas, e uma mistura de 10 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10 mL de água foi adicionada à mistura reacional sob resfriamento. A mistura foi extraída três vezes com 20 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,49 g de 1-(2,6-difluorobenzoyl)-3-[2,6-difluoro-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (103)).

O presente composto (103)



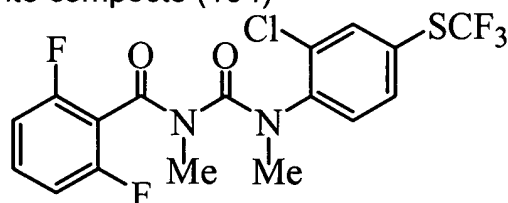
^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,08 (3H, s), 3,27 (3H, s), 7,09 - 7,13 (2H, m), 7,50 - 7,56 (1H, m), 7,57 - 7,61 (2H, m).

Exemplo 104

A uma solução de 1,01 g de 1-(2-cloro-4-(trifluorometiltio)fenil)-3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 113 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a

2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,35 mL de iodeto de metila foi adicionado a 1°C a ela. A mistura obtida foi agitada a 2-3°C durante três horas, e uma mistura de 10 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10 mL de água foi adicionada à mistura reacional sob resfriamento. A mistura foi extraída três vezes com 20 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 1,03 g de 1-[2-cloro-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (104)).

O presente composto (104)

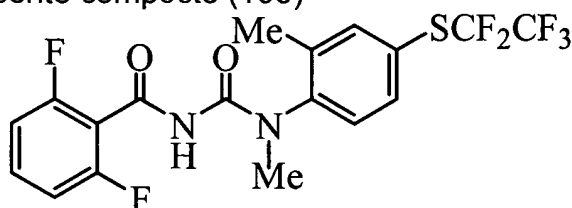


¹H-RMN (DMSO-d₆) δ (ppm): 3,05 (3H, s), 3,27 (3H, s), 7,08 - 7,12 (2H, m), 7,49 - 7,54 (2H, m), 7,70 - 7,72 (1H, m), 7,89 - 7,90 (1H, m).

Exemplo 105

A uma solução de 0,79 g de 2-metil-N-metil-4-(pentafluoroetiltio)anilina em 3,2 mL de éter dietílico foi adicionada uma solução de 0,53 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 0,8 mL de éter dietílico sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante duas horas. A solução reacional foi colocada sob resfriamento e hexano foi adicionado em porções a ela. Um pó branco depositado foi coletado por filtração para fornecer 1,18 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metil-1-[2-metil-4-(pentafluoroetiltio)fenil]ureia (a seguir, referido como o presente composto (105)).

O presente composto (105)

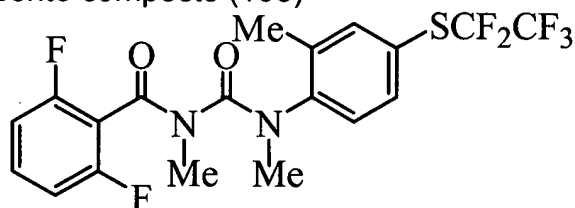


^1H -RMN (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,24 (3H, brs), 3,16 (3H, brs), 7,11 - 7,13 (2H, m), 7,35 - 7,37 (1H, m), 7,49 - 7,51 (1H, m), 7,59 - 7,61 (1H, m), 7,68 - 7,69 (1H, m), 10,42 (1H, brs).

Exemplo 106

- 5 A uma solução de 0,85 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metil-1-[2-metil-4-(pentafluoroetiltio)fenil]ureia em 8,5 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 90 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,28 mL de iodeto de metila foi adicionado a 1°C a ela. A mistura obtida foi agitada a 2-3°C durante três
- 10 horas, e uma mistura de 8,5 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 8,5 mL de água foi adicionada à mistura reacional sob resfriamento. A mistura foi extraída três vezes com 20 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentra-
- 15 das sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,64 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-1,3-dimetil-3-[2-metil-4-(pentafluoroetiltio)fenil]ureia (a seguir, referido como o presente composto (106)).

O presente composto (106)



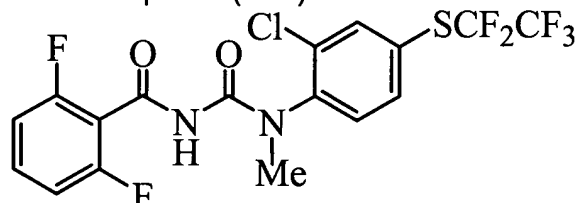
- 20 ^1H -RMN (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,18 (3H, brs), 3,05 (3H, brs), 3,23 (3H, brs), 7,11 - 7,14 (2H, m), 7,30 - 7,32 (1H, m), 7,53 - 7,56 (2H, m), 7,62 (1H, m).

Exemplo 107

- A uma solução de 1,02 g de 2-cloro-N-metil-4-(pentafluoroetiltio)anilina em 4,0 mL de éter dietílico foi adicionada uma solu-
- 25 ção de 0,64 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 1,0 mL de éter dietílico sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante duas horas. A mistura reacional foi colocada sob resfriamento e hexano foi adicionado em porções a ela. Um pó branco depositado foi coletado por filtração para fornecer 1,44 g de 1-[2-cloro-4-(pentafluoroetiltio)fenil]-3-(2,6-

difluorobenzoil)-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (107)).

O presente composto (107)

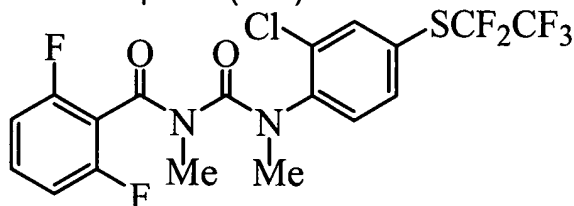


¹H-RMN (DMSO-d₆) δ (ppm): 3,19 (3H, brs), 7,09 - 7,14 (2H, m), 7,47 - 7,52 (1H, m), 7,59 - 7,61 (1H, m), 7,75 - 7,78 (1H, m), 7,96 - 7,97 (1H, m), 10,80 (1H, brs).

Exemplo 108

A uma solução de 1,01 g de 1-[2-cloro-4-(pentafluoroetilthio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metilureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 101 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,32 mL de iodeto de metila foi adicionado a 1°C a ela. A mistura obtida foi agitada a 2-3°C durante três horas, e uma mistura de 10 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10 mL de água foi adicionada à mistura reacional sob resfriamento. A mistura foi extraída três vezes com 20 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com solução de salina saturada três vezes, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,92 g de 1-[2-cloro-4-(pentafluoroetilthio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (108)).

O presente composto (108)



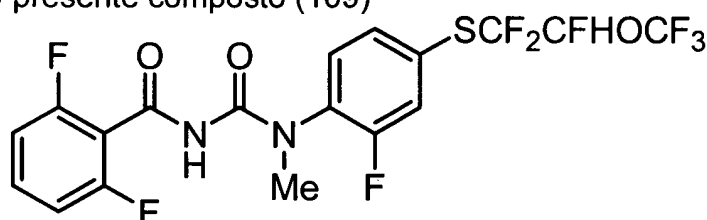
¹H-RMN (DMSO-d₆) δ (ppm): 3,05 (3H, s), 3,27 (3H, s), 7,08 - 7,12 (2H, m), 7,50 - 7,54 (2H, m), 7,70 - 7,73 (1H, m), 7,89 - 7,90 (1H, m).

Exemplo 109

Uma solução de 0,59 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla em 1,0 mL de éter dietílico foi adicionada em temperatura ambiente a uma solução de 2,09 g de 2-flúor-N-metil-4-(1,1,2-trifluoro-2-trifluorometoxietiltio) anilina em 5,0 mL de éter dietílico e agitada durante uma hora. Um sólido produzido foi coletado por filtração e Em seguida, secado para fornecer 1,27 g de

5 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(1,1,2-trifluoro-2-trifluorometoxietiltio)fenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (109)).

O presente composto (109)



10 ^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,23 (3H, s), 7,11 - 7,25 (3H, m), 7,47 - 7,55 (3H, m), 7,65 - 7,68 (1H, m), 10,89 (1H, brs).

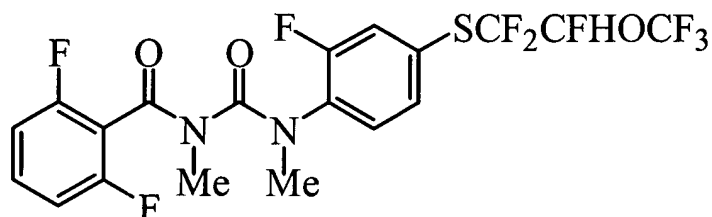
Exemplo 110

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-flúor-4-(1,1,2-trifluoro-2-trifluorometoxietiltio)fenil]-1-metilureia em 10,0 mL de 1-

15 metil-2-pirrolidona foram adicionados 95 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 55% em peso em óleo) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,29 mL de iodeto de metila foi adicionado a 1°C a ela. A mistura obtida foi agitada a 2-3°C durante três horas, e uma mistura de 10 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10 mL de água foi adicionada à

20 mistura reacional sob resfriamento. A mistura foi extraída três vezes com 20 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,57 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(1,1,2-trifluoro-2-trifluorometoxietiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (110)).

O presente composto (110)

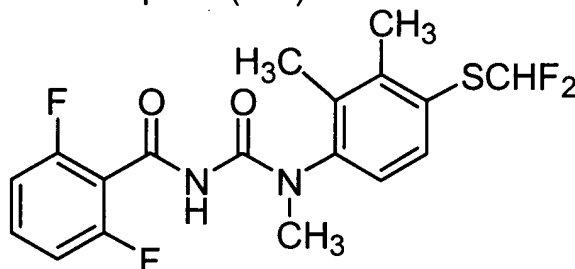


^1H -RMN (DMSO-d_6) δ (ppm): 3,05 (3H, s), 3,25 (3H, s), 6,91 - 7,06 (1H, m), 7,06 - 7,11 (2H, m), 7,36 - 7,40 (1H, m), 7,49 - 7,60 (3H, m).

Exemplo 111

A uma solução de 160 mg de 4-(difluorometiltio)-2,3-dimetil-N-metilanilina em 3 mL de éter metil terc-butilico foram adicionadas 135 mg de isocianato de 2,6-difluorobenzoila, e agitada em temperatura ambiente durante 30 minutos. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 66: 34) para fornecer 0,29 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[4-(difluorometiltio)-2,3-dimetilfenil]-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (111)).

O presente composto (111)



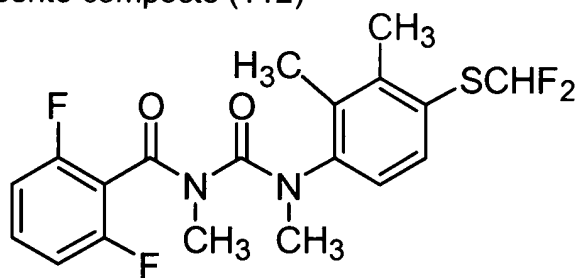
^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,26 (3H, s), 2,55 (3H, s), 3,17 (3H, s), 6,85 (1H, t, $J = 56,5$ Hz), 6,95 (2H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,13 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 7,33 - 7,46 (2H, m), 7,61 (1H, d, $J = 8,5$ Hz).

Exemplo 112

A uma solução de 190 mg de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[4-(difluorometiltio)-2,3-dimetilfenil]-1-metilureia em 3 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionadas 81 mg de iodometano e Em seguida, 21 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante a noite. A uma mistura reacional foram adicionados 30 mL de éter metil terc-butilico. A mistura foi lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido

foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 66: 34) para fornecer 0,19 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[4-(difluorometiltio)-2,3-dimetilfenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (112)).

5 O presente composto (112)



^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 2,09 (3H, s), 2,43 (3H, s), 3,04 (3H, s), 3,20 (3H, s), 7,00 - 7,22 (3H, m), 7,32 (1H, t, J = 56,6 Hz), 7,42 - 7,63 (2H, m).

Exemplo 10-(2)

10 A uma solução de 1,00 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 10,0 mL de tolueno foram adicionados 0,49 mL de cloreto de 2,6-difluorobenzóila e 0,55 g de diisopropiletilamina, e agitada durante três horas em um banho de óleo a 120°C. A mistura reacional foi lavada com 10 mL de água, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 1,14 g do presente composto (10).

Exemplo 10-(3)

20 A uma solução de 1,00 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 10,0 mL de tolueno foram adicionados 0,49 mL de cloreto de 2,6-difluorobenzóila e 0,59 mL de trietilamina, e agitada durante seis horas em um banho de óleo a 120°C. A mistura reacional foi lavada com 10 mL de água, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 1,05 g do presente composto (10).

Exemplo 10-(4)

A uma solução de 1,00 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 10,0 mL de tolueno foram adicionados 0,49 mL de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla e 0,34 mL de piridina, e agitada durante seis horas em um banho de óleo a 120°C. A mistura reacional foi lavada com 10 mL de água, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,85 g do presente composto (10).

Exemplo 10-(5)

10 A uma solução de 1,00 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 10,0 mL de tolueno foram adicionados 0,49 mL de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla e 0,64 mL de 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno, e agitada durante cinco horas em um banho de óleo a 120°C. A mistura reacional foi lavada com 10 mL de água, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,14 g do presente composto (10).

Exemplo 10-(6)

20 A uma solução de 1,00 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 10,0 mL de xileno foram adicionados 0,49 mL de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla e 0,55 g de diisopropiletilamina, e agitada durante seis horas em um banho de óleo a 120°C. A mistura reacional foi lavada com 10 mL de água, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 1,19 g do presente composto (10).

Exemplo 10-(7)

30 A uma solução de 1,00 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 10,0 mL de clorobenzeno foram adicionados 0,49 mL de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla e 0,55 g de diisopropiletilamina, e agitada durante três horas em um banho de óleo a 120°C. A mistura reacional foi lavada com 10 mL de água, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e con-

centrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 1,17 g do presente composto (10).

Exemplo 10-(8)

- 5 A uma solução de 1,00 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 10,0 mL de N,N-dimetilformamida foram adicionados 0,49 mL de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla e 0,55 g de diisopropiletilamina, e agitada durante três horas em um banho de óleo a 120°C. A mistura reacional foi lavada com 10 mL de água, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,82 g do presente composto (10).

Exemplo 10-(9)

- 15 A uma solução de 1,00 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 10,0 mL de tolueno foram adicionados 0,49 mL de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla e 0,98 g de carbonato de potássio, e agitada durante cinco horas em um banho de óleo a 120°C. A mistura reacional foi adicionada a 20 mL de água. A mistura foi extraída com 20 mL de acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com 20 mL de solução salina saturada, 20 secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,67 g do presente composto (10).

Exemplo 10-(10)

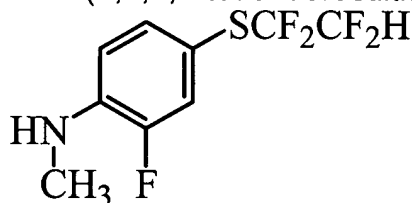
- 25 A uma solução de 1,00 g de 2,6-difluoro-N-metilbenzamida e 0,75 mL de clorotrimetilsilano em 10,0 mL de clorofórmio foi adicionada gota a gota uma solução de 0,82 mL de trietilamina em 5,0 mL de clorofórmio em temperatura ambiente, e agitada a 40°C durante 40 minutos. Em seguida, uma solução de 0,78 g de bis(triclorometil)carbonato em 10 mL de clorofórmio foi adicionada gota a gota a 3°C a ela, e a mistura foi agitada em temperatura ambiente durante duas horas. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi dissolvido em 20 mL de tolueno, e a 30

ele 1,30 g de 2-flúor-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina e 1,2 mL de diisopropil-
 etilamina foram adicionados, e a mistura foi aquecida a 110°C durante uma
 hora. A mistura reacional foi lavada com 20 mL de água. A camada orgânica
 foi secada sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão
 5 reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (ace-
 tato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 1,36 g do presente
 composto (10).

Exemplo de Produção 34

A uma solução de 3,00 g de 2-flúor-4-(1,1,2,2-
 10 tetrafluoroetiltio)anilina e 0,53 g de paraformaldeído (conteúdo; 90% em pe-
 so) em 15 mL de metanol foi adicionada uma mistura de 11,6 g de uma solu-
 ção de metilato de sódio-metanol a 28% e 7 mL de metanol, e agitada em
 temperatura ambiente durante 18 horas. A mistura reacional foi vertida em
 50 mL de água gelada e Em seguida, extraída com 70 mL de clorofórmio. A
 15 camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro e concen-
 trada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi dissolvido em 60 mL de e-
 tanol, e a ele 1,10 g de boroidreto de sódio (conteúdo; 90% em peso) foi adi-
 cionado. A mistura foi aquecida em refluxo durante 30 minutos. A mistura
 reacional foi deixada resfriar para a temperatura ambiente e Em seguida,
 20 concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foram adicionados 50 mL de
 água e 50 mL de clorofórmio, e as camadas separadas. A camada orgânica
 foi secada sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão
 reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (ace-
 tato de etila: hexano = 1: 5) para fornecer 3,18 g de 2-flúor-N-metil-4-
 25 (1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)anilina.

2-Flúor-N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)anilina

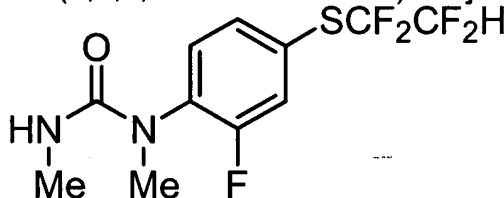


¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 2,91 (3H, d, J = 5,1 Hz), 4,26 (1H, br), 5,60 - 5,89
 (1H, m), 6,62 - 6,66 (1H, m), 7,21 - 7,32 (2H, m).

Exemplo de Produção 35

A uma solução de 3,18 g de 2-flúor-N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)anilina em 30 mL de tolueno foi adicionado 1,90 mL de trietilamina. A ela uma solução de 1,65 g de bis(triclorometil)carbonato em 10 mL de tolueno foi adicionada gota a gota a 1-8°C. A mistura reacional obtida foi agitada a 3°C durante uma hora e Em seguida, concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foram adicionados 60 mL de água e 60 mL de clorofórmio, e as camadas separadas. A camada orgânica foi lavada com 60 mL de uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi dissolvido em 30 mL de acetonitrila, e a ela 5,00 mL de uma solução de metilamina-metanol a 40% foram adicionados. A mistura obtida foi agitada em temperatura ambiente durante duas horas e Em seguida, concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foram adicionados 60 mL de água e 60 mL de clorofórmio, e as camadas separadas. A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro, e Em seguida, concentrada sob pressão reduzida para fornecer 3,72 g de 1,3-dimetil-1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]ureia.

1-[2-Flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia



¹H-RMN (CDCl₃) δ (ppm): 2,79 (3H, d, J = 4,8 Hz), 3,24 (3H, s), 4,24 (1H, br), 5,72 - 6,01 (1H, m), 7,33 - 7,37 (1H, m), 7,46 - 7,51 (2H, m).

Exemplo 12-(1)

A uma solução de 1,00 g de 1-[2-flúor-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 10,0 mL de tolueno foram adicionados 0,44 mL de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla e 0,66 mL de diisopropiletilamina, e agitada durante quatro horas em um banho de óleo a 120°C. A mistura reacional foi lavada com 10 mL de água, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 1,39 g do presente composto (12).

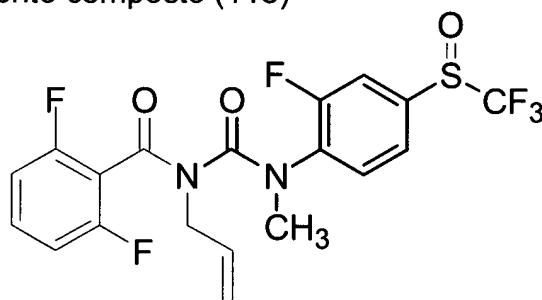
Exemplo 96-(1)

A uma solução de 1,00 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1,3-dimetilureia em 10,0 mL de tolueno foram adicionados 0,56 mL de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla e 0,55 g de diisopropiletilamina, e agitada durante 19 horas em um banho de óleo a 120°C. A mistura reacional foi lavada com 10 mL de água, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) e Em seguida, purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 13: 87) para fornecer 0,34 g do presente composto (96).

Exemplo 113

A uma solução de 2,26 g de 1-alil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia em clorofórmio foi adicionado 1,2 g de ácido meta-cloroperbenzóico (conteúdo; 65% em peso) sob resfriamento, e agitada em temperatura ambiente durante 24 horas. A uma mistura reacional foi adicionado éter terc-butilmetílico, e a mistura foi lavada sequencialmente com uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 75: 25) para fornecer 1,55 g de 1-alil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometilsulfinil)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (113)).

O presente composto (113)



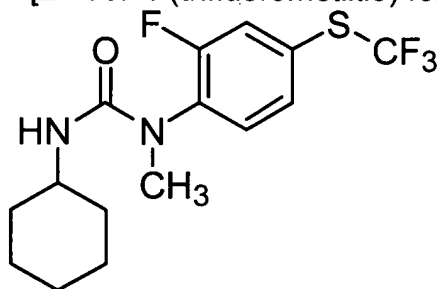
¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80°C) δ: 3,30 (3H, s), 4,13 (2H, d, J = 5,8 Hz), 5,03 - 5,14 (2H, m), 5,77 - 5,89 (1H, m), 7,09 (2H, t, J =

8,3 Hz), 7,50 - 7,58 (1H, m), 7,61 (1H, t, J = 8,1 Hz), 7,74 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,82 (1H, d, J = 9,7 Hz).

Exemplo de Produção 36

A uma solução de 776 mg de cicloexilamina em éter terc-butilmetílico foi adicionado 1,1 mL de trietilamina e Em seguida, 1,5 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 1,65 g de 3-cicloexil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia.

3-Cicloexil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio) fenil]-1-metilureia



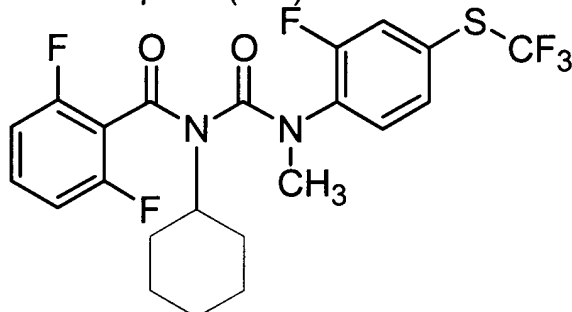
¹H-RMN (CDCl₃) δ: 0,95 - 1,17 (3H, m), 1,26 - 1,41- (2H, m), 1,52 - 1,68 (3H, m), 1,84 - 1,95 (2H, m), 3,23 (3H, s), 3,60 - 3,71 (1H, m), 4,11 (1H, d, J = 7,5 Hz), 7,36 (1H, t, J = 8,3 Hz), 7,45 - 7,52 (2H, m).

Exemplo 114

A uma solução de 1,52 g de 3-cicloexil-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 15 mL de tolueno foram adicionados 0,9 mL de diisopropiletilamina e 919 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoila, e agitada durante três horas com aquecimento até o refluxo. A mistura reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela acetato de etila foi adicionado. A mistura foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (acetato de etila: hexano = 75: 25) para fornecer 2,17 g de 1-cicloexil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-

flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (114)).

O presente composto (114)

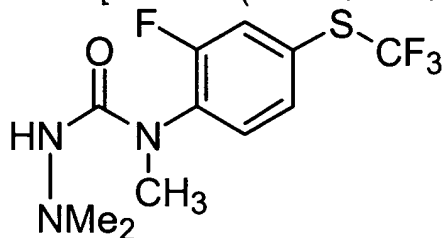


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80°C) δ: 0,99 - 1,24 (3H, m),
 5 1,51 - 1,60 (1H, m), 1,67 - 1,91 (6H, m), 3,27 (3H, s), 3,54 - 3,74 (1H, m),
 7,16 (2H, t, J = 8,4 Hz), 7,31 - 7,43 (1H, m), 7,52 - 7,62 (2H, m), 7,67 (1H,
 dd, J = 9,9, 1,8 Hz).

Exemplo de Produção 37

A uma solução de 470 mg de 1,1-dimetilhidrazina em 25 mL de
 10 éter terc-butilmetílico foram adicionados 1,1 mL de trietilamina e Em seguida,
 1,5 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e
 agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A mistura reacional foi
 lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada
 sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O
 15 sólido obtido foi lavado com hexano, e secado sob pressão reduzida para
 fornecer 930 g de 3-dimetilamino-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-
 metilureia.

3-Dimetilamino-1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia



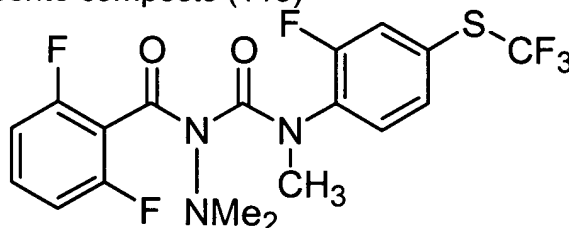
¹H-RMN (CDCl₃) δ: 2,44 (6H, s), 3,23 (3H, s), 5,06 (1H, br), 7,32 (1H, t, J =
 20 8,2 Hz), 7,44 - 7,51- (2H, m).

Exemplo 115

A uma solução de 804 mg de 3-dimetilamino-1-[2-flúor-4-

(trifluorometiltio)fenil]-1-metilureia em 8 mL de tolueno foram adicionados 1,1 mL de diisopropiletilamina e 912 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante seis horas com aquecimento até o refluxo. A mistura reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela acetato de etila foi adicionado. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 90: 10) para fornecer 1,10 g de 1-dimetilamino-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (115)).

O presente composto (115)

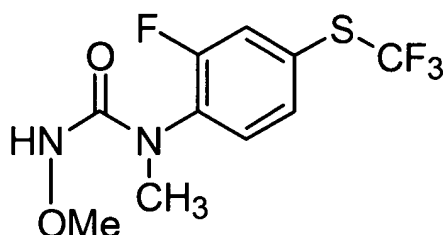


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ : 2,60 (6H, s), 3,27 (3H, s), 7,09 (2H, t, $J = 8,4$ Hz), 7,43 - 7,62 (3H, m), 7,71 (1H, dd, $J = 10,0$, 1,7 Hz).

Exemplo de Produção 38

A uma solução de 1,02 g de hidrocloreto de O-metilhidroxilamina em 30 mL de tetraidrofurano, foram adicionados 2 mL de trietilamina, 3 mL de água e 1,5 g de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante 24 horas. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 1,51 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metóxi-1-metilureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metóxi-1- etilureia

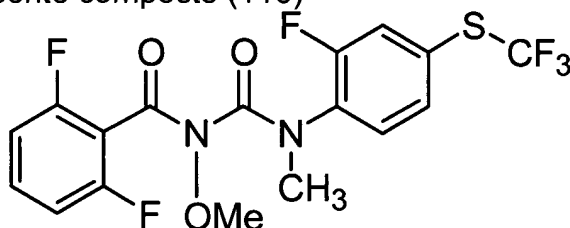


^1H -RMN (CDCl_3) δ : 3,25 (3H, s), 3,61 (3H, s), 7,07 (1H, br), 7,37 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,46 - 7,55 (2H, m).

Exemplo 116

A uma solução de 1,3 g de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metóxi-1-metilureia em 10 mL de tolueno foram adicionados 1,1 mL de diisopropiletilamina e 923 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoila, e agitada durante três horas com aquecimento até o refluxo. A mistura reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e a ela acetato de etila foi adicionado. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, seca-
da sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 80: 20) para fornecer 1,12 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metóxi-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (116)).

O presente composto (116)



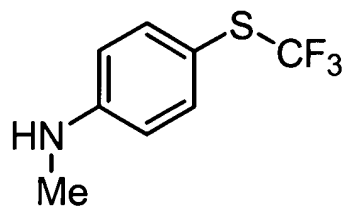
^1H -RMN ($\text{DMSO}-d_6$, Temperatura de avaliação 80°C) δ : 3,30 (3H, s), 3,63 (3H, s), 7,14 (2H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,50 - 7,63 (3H, m), 7,71 (1H, dd, $J = 10,1, 1,8$ Hz).

Exemplos de Produção 39-52

Da mesma maneira como no Exemplo de Produção 1, 2, 3 ou 4, os seguintes compostos foram produzidos.

Exemplo de Produção 39

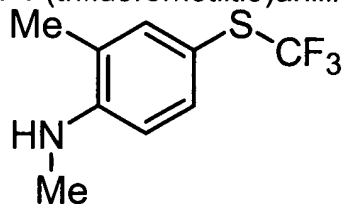
N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina



^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,86 (3H, s), 4,50 (1H, br), 6,61 (2H, d, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,44 (2H, d, $J = 8,0\text{Hz}$).

Exemplo de Produção 40

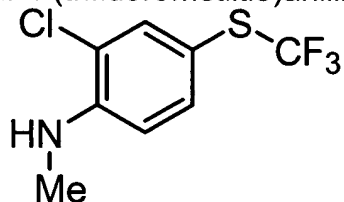
N-metil-2-metil-4-(trifluorometiltio)anilina



- 5 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,12 (3H, s), 2,92 (3H, d, $J = 5,3\text{Hz}$), 3,87 (1H, br), 6,56 - 6,58 (1H, m), 7,30 - 7,43 (2H, m).

Exemplo de Produção 41

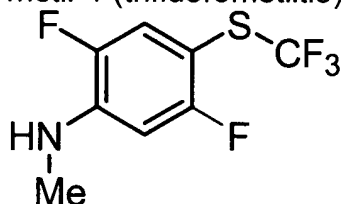
2-Cloro-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina



- 10 ^1H -RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,80 (3H, d, $J = 4,9\text{Hz}$), 6,23 - 6,24 (1H, m), 6,71 - 6,74 (1H, m), 7,45 - 7,48 (1H, m), 7,53 - 7,56 (1H, m).

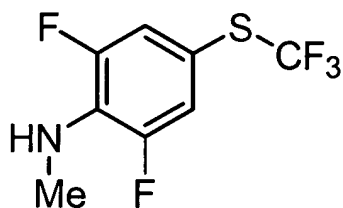
Exemplo de Produção 42

2,5-Difluoro-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina



- 15 ^1H -RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,77 - 2,78 (3H, m), 6,63 - 6,68 (1H, m), 6,70 (1H, br), 7,34 - 7,38 (1H, m).
- Exemplo de Produção 43

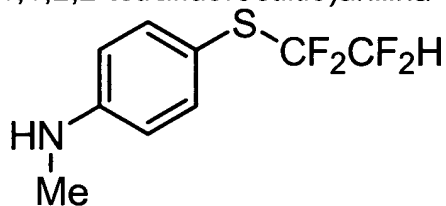
2,6-Difluoro-N-metil-4-(trifluorometiltio)anilina



^1H -RMN (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,96 - 2,99 (3H, m), 6,00 (1H, m), 7,30 - 7,32 (2H, m).

Exemplo de Produção 44

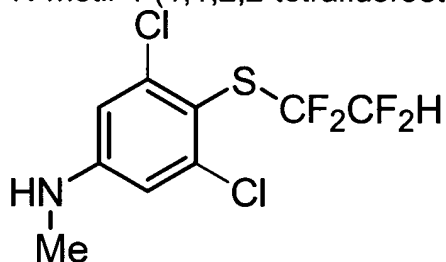
N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)anilina



- 5 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,86 (3H, s), 4,03 (1H, br), 5,59 - 5,86 (1H, m), 6,57 (2H, d, $J = 8,7\text{Hz}$), 7,42 (2H, d, $J = 8,7\text{Hz}$).

Exemplo de Produção 45

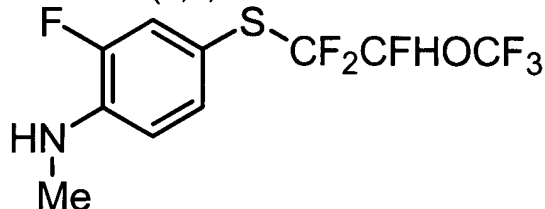
3,5-Dicloro-N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)anilina



- 10 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,85 (3H, d, $J = 5,3\text{Hz}$), 4,22 (1H, br), 5,73 - 6,02 (1H, m), 6,72 (2H, s).

Exemplo de Produção 46

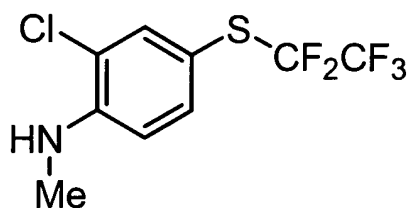
2-Flúor-N-metil-4-(1,1,2-trifluoro-2-trifluorometoxietiltio)anilina



- 15 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,91 (3H, s), 4,27 (1H, br), 5,68 - 5,84 (1H, m), 6,62 - 6,67 (1H, m), 7,20 - 7,30 (2H, m).

Exemplo de Produção 47

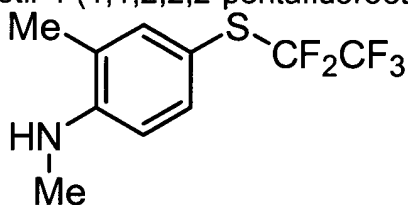
2-Cloro-N-metil-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio) anilina



^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 2,80 (3H, d, $J = 4,8\text{Hz}$), 6,27 - 6,28 (1H, m), 6,72 - 6,74 (1H, m), 7,43 - 7,46 (1H, m), 7,52 - 7,53 (1H, m).

Exemplo de Produção 48

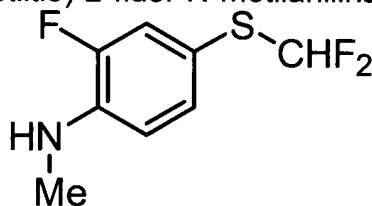
2-Metil-N-metil-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetil)anilina



- 5 ^1H -RMN (DMSO- d_6) δ (ppm): 2,03 (3H, s), 2,76 (1H, d, $J = 4,6\text{Hz}$), 5,74 - 5,75 (1H, m), 6,53 - 6,55 (1H, m), 7,21 - 7,24 (1H, m), 7,32 - 7,34 (1H, m).

Exemplo de Produção 49

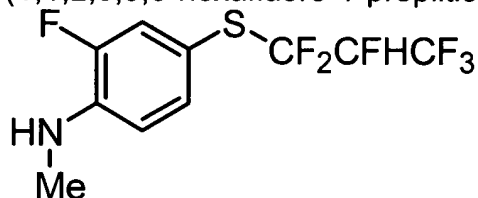
4-(Difluorometiltio)-2-flúor-N-metilanilina



- 10 ^1H -RMN (CDCl_3) δ : 2,90 (3H, d, $J = 5,1\text{ Hz}$), 4,19 (1H, br), 6,64 (1H, t, $J = 8,7\text{ Hz}$), 6,71 (1H, t, $J = 57,5\text{ Hz}$), 7,19 (1H, dd, $J = 11,3, 2,2\text{ Hz}$), 7,24 - 7,29 (1H, m).

Exemplo de Produção 50

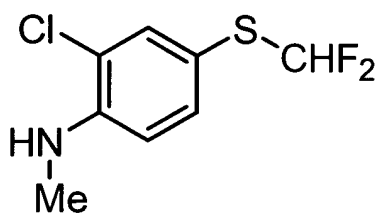
2-Flúor-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiltio)-N-metilanilina



- 15 ^1H -RMN (CDCl_3) δ : 2,92 (3H, d, $J = 5,1\text{ Hz}$), 4,29 (1H, br), 4,60 - 4,83 (1H, m), 6,65 (1H, t, $J = 8,7\text{ Hz}$), 7,23 (1H, d, $J = 11,3\text{ Hz}$), 7,31 (1H, d, $J = 8,7\text{ Hz}$).

Exemplo de Produção 51

2-Cloro-4-(difluorometiltio)-N-metilanilina

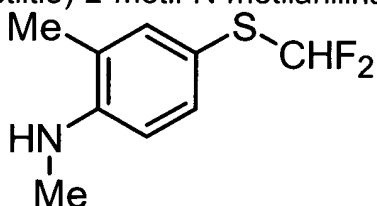


^1H -RMN (CDCl_3) δ : 2,93 (3H, d, $J = 5,1$ Hz), 4,61 (1H, br), 6,61 (1H, d, $J = 8,4$ Hz), 6,70 (1H, t, $J = 57,2$ Hz), 7,38 (1H, dd, $J = 8,4, 2,0$ Hz), 7,48 (1H, d, $J = 2,0$ Hz).

Exemplo de Produção 52

5

4-(Difluorometiltio)-2-metil-N-metilanilina



^1H -RMN (CDCl_3) δ : 2,12 (3H, s), 2,91 (3H, d, $J = 5,1$ Hz), 3,80 (1H, br), 6,57 (1H, d, $J = 8,4$ Hz), 6,70 (1H, t, $J = 57,5$ Hz), 7,26 (1H, d, $J = 2,1$ Hz), 7,37 (1H, dd, $J = 8,4, 2,1$ Hz).

Exemplos de Produção 53-60

10

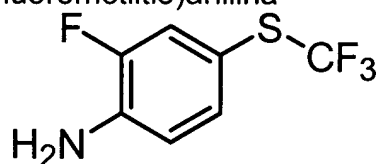
Os seguintes compostos foram produzidos por um método descrito em Journal of American Chemical Society Vol. 115, N $^{\circ}$. 6, 2156 - 2164 (1993), Journal of Fluorine Chemistry 69, 207-212 (1994) ou similar.

Exemplo de Produção 53

A uma solução de 101,0 g de 2-flúor-4-mercaptoanilina em 1400 mL de acetonitrila foram adicionados 109 mL de trietilamina. A ela 303 g de iodo trifluorometano foram adicionados em uma temperatura interna de 27-53°C durante 10 minutos. A mistura foi agitada em temperatura ambiente durante 25 minutos, resfriada sob resfriamento, e Em seguida, adicionada a 2000 mL de água. A mistura foi extraída duas vezes com 1000 mL de éter dietílico. A camada orgânica foi lavada com 1000 mL de ácido clorídrico a 3,5%, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada pela pressão reduzida. A 94,2 g do resíduo obtido foram adicionados 200 mL de éter dietílico, e substâncias insolúveis foram removidas por filtração. O filtrado foi concentrado sob pressão reduzida, e 90,2 g do resíduo obtido foram destilados sob pressão reduzida para fornecer 66,8 g de 2-flúor-4-

(trifluorometiltio)anilina.

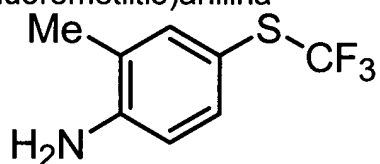
2-Flúor-4-(trifluorometiltio)anilina



^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 4,01 (2H, br), 6,73 - 7,78 (1H, m), 7,22 - 7,30 (2H, m).

5 Exemplo de Produção 54

2-Metil-4-(trifluorometiltio)anilina

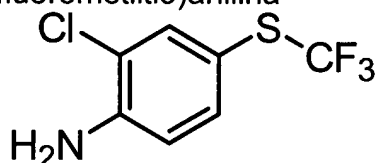


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,36 (2H, br), 6,64 - 6,66 (1H, m), 7,25 - 7,31 (2H, m).

Exemplo de Produção 55

10

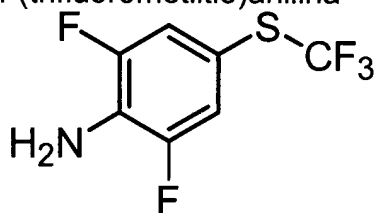
2-Cloro-4-(trifluorometiltio)anilina



^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 4,35 (2H, br), 6,73 - 6,75 (1H, d, $J = 8,4$ Hz), 7,32 - 7,34 (1H, dd, $J = 8,4, 2,1$ Hz), 7,54 (1H, d, $J = 2,1$ Hz).

Exemplo de Produção 56

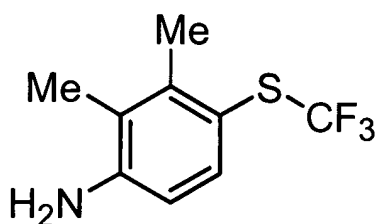
2,6-Difluoro-4-(trifluorometiltio)anilina



15 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 4,05 (2H, br), 7,14 - 7,19 (2H, m).

Exemplo de Produção 57

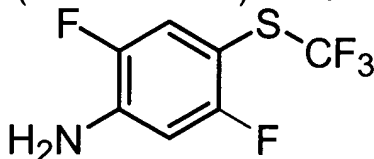
2,3-Dimetil-4-(trifluorometiltio)anilina



$^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3) δ (ppm): 2,12 (3H, s), 2,50 (3H, s), 4,10 (2H, br), 6,57 (1H, d J = 8,3 Hz), 7,36 (1H, d J = 8,3 Hz).

Exemplo de Produção 58

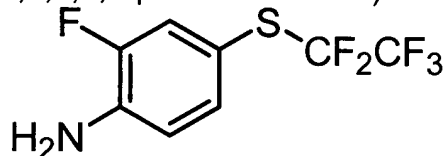
2,5-Difluoro-4-(trifluorometiltio)anilina



5 $^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3) δ (ppm): 4,17 (2H, br), 6,53 - 6,57 (1H, m), 7,20 - 7,26 (1H, m).

Exemplo de Produção 59

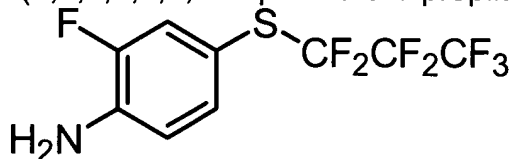
2-Flúor-4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetiltio)anilina



10 $^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3) δ (ppm): 3,60 - 4,40 (2H, br), 6,73 - 6,77 (1H, m), 7,20 - 7,28 (2H, m).

Exemplo de Produção 60

2-Flúor-4-(1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propiltio)anilina



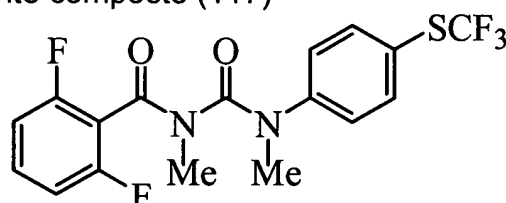
15 $^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3) δ (ppm): 4,04 (2H, br, NH_2), 6,73 - 6,78 (1H, m, Ph), 7,21 - 7,29 (2H, m, Ph).

Exemplo 117

A uma solução de 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzil)-1-metil-1-[4-(trifluorometiltio)fenil]ureia em 10,0 mL de 1-metil-2-pirrolidona foram adicionados 123 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. Em seguida, 0,38 mL de iodeto de metila foi adicionado a 2°C a ela. A mistura obtida foi agitada a 2-3°C durante três ho-

ras, e uma mistura de 10 mL de uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e 10 mL de água foi adicionada à mistura reacional. A mistura foi extraída três vezes com 20 mL de acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas três vezes com uma solução salina saturada, secadas sobre sulfato de magnésio anidro, e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,92 g de 1-(2,6-difluorobenzil)-1,3-dimetil-3-[(4-trifluorometiltio)fenil]ureia (a seguir, referido como o presente composto (117)).

10 O presente composto (117)

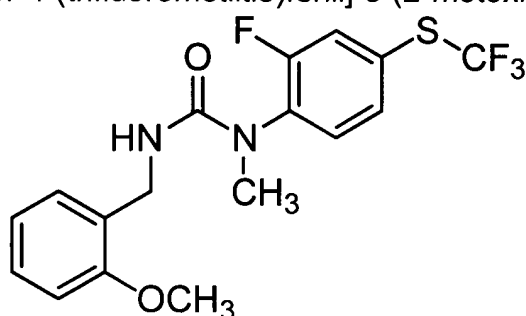


^1H -RMN (DMSO- d_6 , 80°C) δ (ppm): 3,03 (3H, s), 3,27 (3H, s), 7,07 - 7,11 (2H, m), 7,27 - 7,29 (2H, m), 7,48 - 7,56 (1H, m), 7,67 - 7,70 (2H, m).

Exemplo de Produção 61

A uma solução de 358 mg de 2-metoxibenzilamina em 20 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,36 mL de trietilamina e Em seguida, 500 mg de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 670 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2-metoxibenzil)-1-metilureia.

1-2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2-metoxibenzil)-1-metilureia

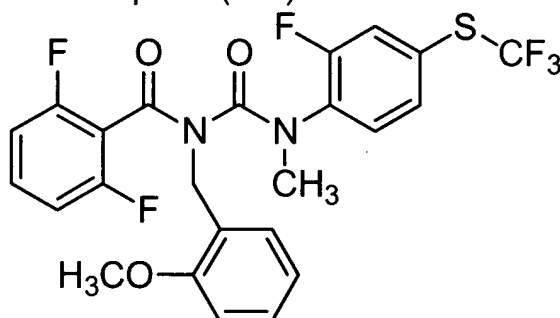


^1H -RMN (CDCl_3) δ : 3,23 (3H, s), 3,68 (3H, s), 4,38 (2H, d, $J = 6,1$ Hz), 5,05 (1H, br), 6,82 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 6,91 (1H, t, $J = 7,1$ Hz), 7,21 - 7,28 (2H, m), 7,31 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,42 - 7,51- (2H, m).

Exemplo 118

- 5 A uma solução de 670 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(2-metoxibenzil)-1-metilureia em 7 mL de tolueno foram adicionados 0,45 mL de diisopropiletilamina e 500 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante três horas com aquecimento até o refluxo. A mistura reacio-
- 10 nal foi resfriada para a temperatura ambiente, e acetato de etila foi adicionado à mistura reacional. A mistura foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato
- 15 de etila = 75: 25) para fornecer 897 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(2-metoxibenzil)-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (118)).

O presente composto (118)



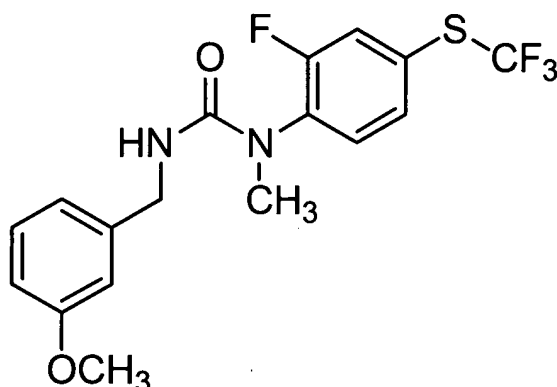
- ^1H -RMN (DMSO-d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ : 3,19 (3H, s), 3,68 (3H, s), 4,69 (2H, s), 6,88 (1H, t, $J = 7,5$ Hz), 6,93 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 7,08 (2H, t, $J = 8,5$ Hz), 7,17 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,21 - 7,30 (2H, m), 7,47 - 7,57 (2H, m), 7,63 (1H, dd, $J = 10,1, 1,9$ Hz).
- 20

Exemplo de Produção 62

- A uma solução de 358 mg de 3-metoxibenzilamina em 20 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,36 mL de trietilamina e Em seguida, 500 mg de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-
- 25

metilcarbamoíla, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 670 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(3-metoxibenzil)-1-metilureia.

1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(3-metoxibenzil)-1-metilureia

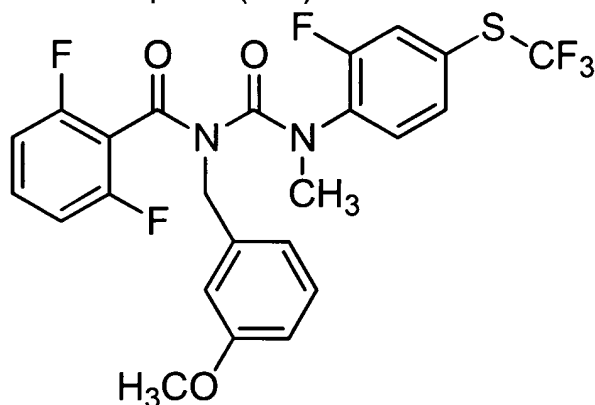


¹H-RMN (CDCl₃) δ: 3,27 (3H, s), 3,79 (3H, s), 4,40 (2H, d, J = 5,6 Hz), 4,62 (1H, br), 6,76 - 6,87 (3H, m), 7,18 - 7,25 (1H, m), 7,38 (1H, t, J = 7,9 Hz), 7,44 - 7,52 (2H, m).

Exemplo 119

A uma solução de 670 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(3-metoxibenzil)-1-metilureia em 7 mL de tolueno foram adicionados 0,45 mL de diisopropiletilamina e 500 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante três horas com aquecimento até o refluxo. A mistura reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e acetato de etila foi adicionado à mistura reacional. A mistura foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 923 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(3-metoxibenzil)-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (119)).

O presente composto (119)

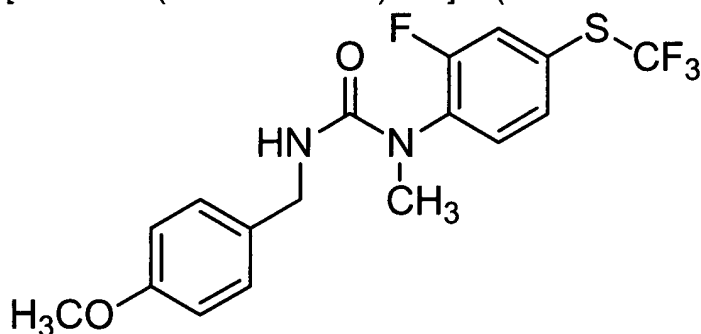


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação; 80°C) δ : 3,24 (3H, s), 3,71 (3H, s), 4,72 (2H, s), 6,79 - 6,86 (3H, m), 7,06 (2H, t, $J = 8,5$ Hz), 7,16 - 7,27 (2H, m), 7,47 - 7,57 (2H, m), 7,63 (1H, dd, $J = 10,1, 1,9$ Hz).

5 Exemplo de Produção 63

A uma solução de 358 mg de 4-metoxibenzilamina em 20 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 0,36 mL de trietilamina e Em seguida, 500 mg de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A mistura reacional foi lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 670 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(4-metoxibenzil)-1-metilureia.

15 1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(4-metoxibenzil)-1-metilureia

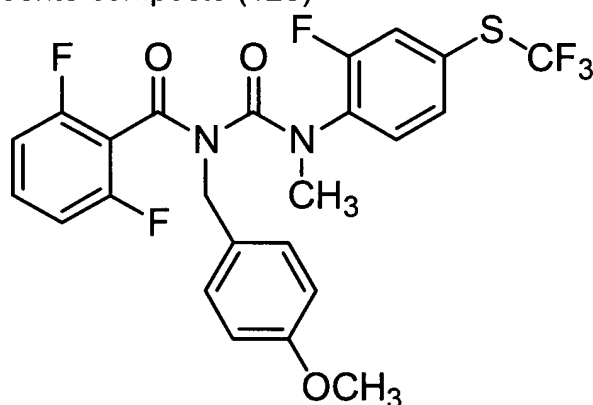


^1H -RMN (CDCl_3) δ : 3,26 (3H, s), 3,78 (3H, s), 4,35 (2H, d, $J = 5,6$ Hz), 4,55 (1H, br s), 6,84 (2H, d, $J = 8,8$ Hz), 7,18 (2H, d, $J = 8,8$ Hz), 7,36 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,42 - 7,51 (2H, m).

Exemplo 120

A uma solução de 670 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-(4-metoxibenzil)-1-metilureia em 7 mL de tolueno foram adicionados 0,45 mL de diisopropiletilamina e 500 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante três horas com aquecimento até o refluxo. A mistura reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e acetato de etila foi adicionado à mistura reacional. A mistura foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 897 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(4-metoxibenzil)-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (120)).

O presente composto (120)

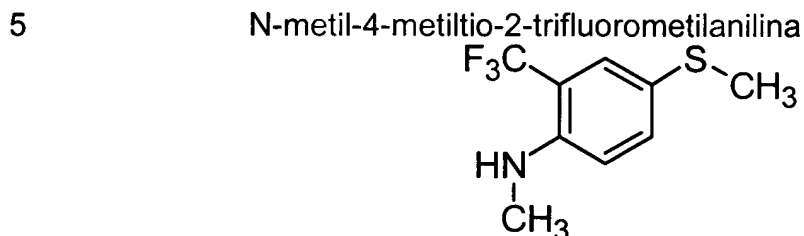


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80°C) δ: 3,21 (3H, s), 3,74 (3H, s), 4,68 (2H, s), 6,85 (2H, d, J = 8,7 Hz), 7,07 (2H, t, J = 8,5 Hz), 7,14 - 7,24 (3H, m), 7,47 - 7,57 (2H, m), 7,63 (1H, dd, J = 10,1, 1,9 Hz).

Exemplo de Produção 64

A uma solução de 6,43 g de 4-mercapto-2-trifluorometilanilina em 20 mL de tetraidrofurano foram adicionados 3,1 mL de iodeto de metila. A solução foi ajustada para 0°C, e 1,46 g de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo) foi adicionado a ela. A mistura foi agitada a 0°C durante duas horas. Água foi adicionada à mistura reacional, e extraída com éter terc-butilmetílico. A camada orgânica obtida foi lavada com uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada

sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 90: 10) para fornecer 402 mg de N-metil-4-metiltio-2-trifluorometilanilina.

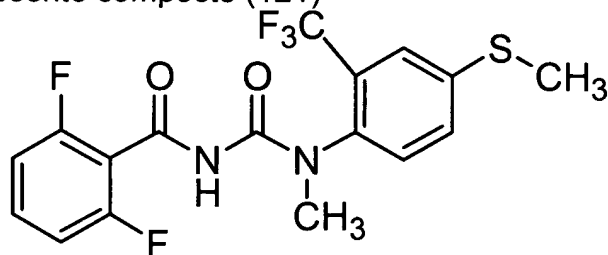


^1H -RMN (CDCl_3) δ : 2,42 (3H, s), 2,89 (3H, d, $J = 4,8$ Hz), 4,42 (1H, br), 6,67 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 7,43 (1H, dd, $J = 8,7, 2,2$ Hz), 7,48 (1H, d, $J = 2,2$ Hz).

Exemplo 121

A uma solução de 400 mg de N-metil-4-metiltio-2-trifluorometilanilina em 4 mL de éter terc-butilmetílico foram adicionados 331 mg de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada em temperatura ambiente durante cinco minutos. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida. O sólido obtido foi lavado com hexano, e secado sob pressão reduzida para fornecer 675 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-metil-3-(2-trifluorometil-4-metiltiofenil)ureia (a seguir, referido como o presente composto (121)).

O presente composto (121)



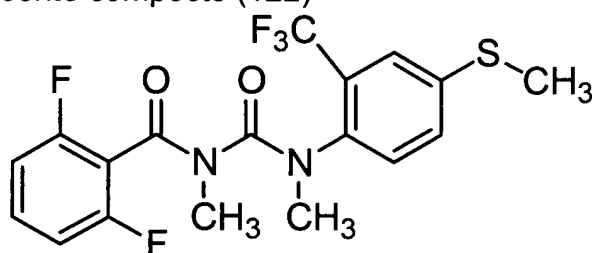
^1H -RMN (CDCl_3) δ : 2,58 (3H, s), 3,18 (3H, s), 6,94 (2H, t, $J = 8,4$ Hz), 7,27 (1H, br), 7,31 (1H, d, $J = 8,3$ Hz), 7,38 (1H, tt, $J = 8,4, 6,5$ Hz), 7,51 (1H, dd, $J = 8,3, 2,1$ Hz), 7,61 (1H, d, $J = 2,1$ Hz).

Exemplo 122

A uma solução de 500 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-metil-3-(2-trifluorometil-4-metiltiofenil)ureia em 3 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionados 0,1 mL de iodometano e Em seguida, 59 mg de hidreto de

sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante 16 horas. A uma mistura reacional foi adicionada água. A mistura foi extraída com acetato de etila, lavada com uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão redu-
 5 zida. O sólido obtido foi lavado com hexano e secado sob pressão reduzi-
 da para fornecer 466 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-1,3-dimetil-3-(2-trifluorometil-4-metiltiofenil)ureia (a seguir, referido como o presente compos-
 to (122)).

O presente composto (122)

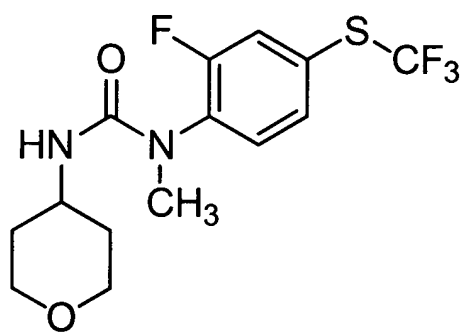


10 ^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ : 2,54 (3H, s), 3,10 (3H, s), 3,26 (3H, s), 7,14 (2H, t, J = 8,5 Hz), 7,29 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,48 - 7,64 (3H, m).

Exemplo de Produção 65

A uma solução de 264 mg de 4-tetraidropiranilamina em 16 mL
 15 de tetraidrofurano foram adicionados 0,36 mL de trietilamina e Em seguida,
 500 mg de cloreto de N-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-N-metilcarbamoila, e
 agitada em temperatura ambiente durante três horas. A mistura reacional foi
 lavada sequencialmente com 2N de ácido clorídrico, uma solução aquosa de
 hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, seca-
 20 da sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida.
 O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho ele-
 vado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 50: 50) para
 fornecer 520 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(4-
 tetraidropiranil)ureia.

25 1-[2-Flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(4-
 tetraidropiranil)ureia

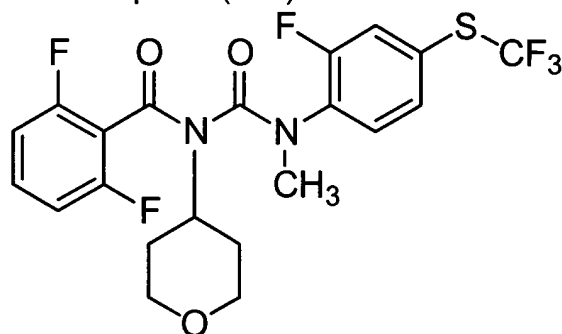


^1H -RMN (CDCl_3) δ : 1,28 - 1,40 (2H, m), 1,84 - 1,93 (2H, m), 3,24 (3H, s), 3,45 (2H, td, $J = 11,7, 2,1$ Hz), 3,82 - 3,95 (3H, m), 4,13 (1H, d, $J = 7,5$ Hz), 7,36 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,47 - 7,54 (2H, m).

Exemplo 123

- 5 A uma solução de 510 mg de 1-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-metil-3-(4-tetraidropiranil)ureia em 8 mL de tolueno foram adicionados 0,45 mL de diisopropiletilamina e 600 mg de cloreto de 2,6-difluorobenzoíla, e agitada durante três horas com aquecimento até o refluxo. A mistura reacional foi resfriada para a temperatura ambiente, e acetato de etila foi adicionado à mistura reacional. A mistura foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 66: 34) para fornecer 654 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metil-1-(4-tetraidropiranil)ureia (a seguir, referido como o presente composto (123)).
- 10
- 15

O presente composto (123)



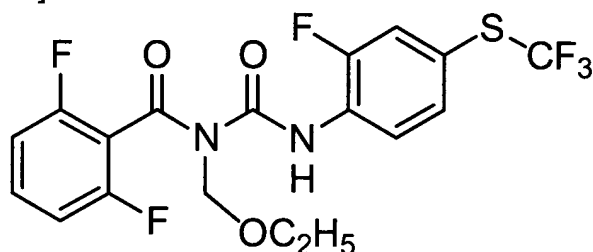
- ^1H -RMN ($\text{DMSO}-d_6$, Temperatura de avaliação 80°C) δ : 1,72 - 1,83 (2H, m), 1,99 - 2,13 (2H, m), 3,21 - 3,35 (5H, m), 3,88 (2H, dd, $J = 11,3, 4,3$ Hz), 3,98
- 20

(1H, br), 7,16 (2H, t, J = 8,5 Hz), 7,35 (1H, t, J = 7,4 Hz), 7,53 - 7,63 (2H, m), 7,67 (1H, dd, J = 10,1, 1,9 Hz).

Exemplo de Produção 66

A uma solução de 500 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia em 5 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionados 200 mg de éter etil clorometílico e Em seguida, 50 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante 30 minutos. A uma mistura reacional foram adicionados água e acetato de etila, e as camadas separadas. A camada orgânica foi lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 85: 15) para fornecer 390 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-1-etoximetil-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia.

1-(2,6-Difluorobenzoil)-1-etoximetil-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia



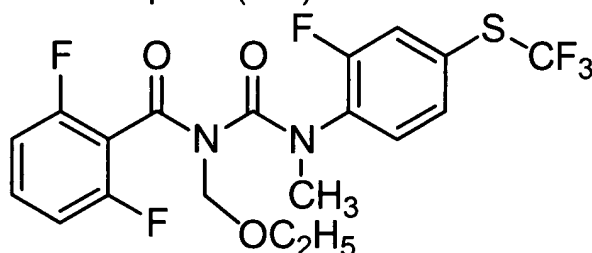
¹H-RMN (CDCl₃) δ: 1,15 (3H, t, J = 7,0 Hz), 3,55 (2H, q, J = 7,0 Hz), 5,26 (2H, s), 7,01 - (2H, t, J = 8,0 Hz), 7,39 - 7,53 (3H, m), 8,36 (1H, t, J = 8,0 Hz), 11,38 (1H, br).

Exemplo 124

A uma solução de 380 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-1-etoximetil-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia em 5 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionados 0,11 mL de iodeto de metila e Em seguida, 50 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante uma hora. A uma mistura reacional foi adicionado acetato de etila. A mistura foi lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidroso,

e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 85: 15) para fornecer 123 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-1-etoximetil-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (124)).

O presente composto (124)

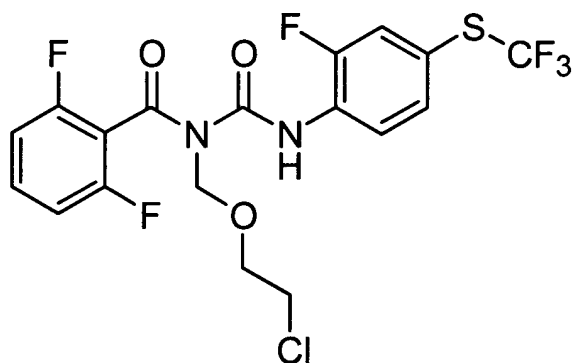


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ : 1,04 (3H, t, $J = 7,0$ Hz), 3,30 (3H, s), 3,48 (2H, q, $J = 7,0$ Hz), 4,86 (2H, s), 7,10 (2H, t, $J = 8,3$ Hz), 7,45 - 7,59 (3H, m), 7,67 (1H, dd, $J = 10,1, 1,9$ Hz).

10 Exemplo de Produção 67

A uma solução de 1,0 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia em 8 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionados 654 mg de éter clorometil 2-cloroetílico e Em seguida, 110 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante 3 horas. A uma mistura reacional foram adicionados água e acetato de etila, e as camadas separadas. A camada orgânica foi lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 85: 15) para fornecer 876 mg de 1-(2-cloroetoximetil)-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia.

1-(2-Cloroetoximetil)-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia

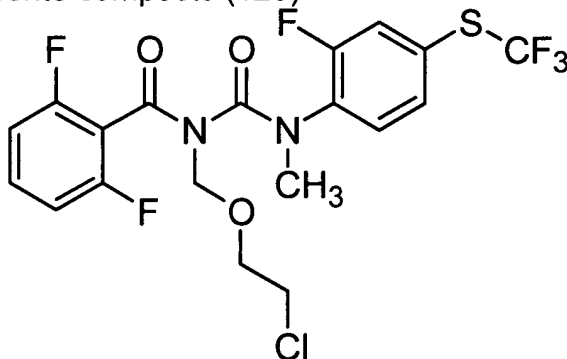


^1H -RMN (CDCl_3) δ : 3,57 (2H, t, $J = 5,6$ Hz), 3,82 (2H, t, $J = 5,6$ Hz), 5,32 (2H, s), 7,02 (2H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,40 - 7,54 (3H, m), 8,35 (1H, t, $J = 8,1$ Hz), 11,39 (1H, br).

Exemplo 125

- 5 A uma solução de 876 mg de 1-(2-cloroetoximetil)-1-(2,6-difluorobenzoyl)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia em 8 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionados 0,2 mL de iodeto de metila e Em seguida, 100 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante 16 horas. A uma mistura reacional
- 10 foi adicionado acetato de etila, lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 85: 15) para fornecer 235 mg de 1-(2-cloroetoximetil)-
- 15 1-(2,6-difluorobenzoyl)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (125)).

O presente composto (125)

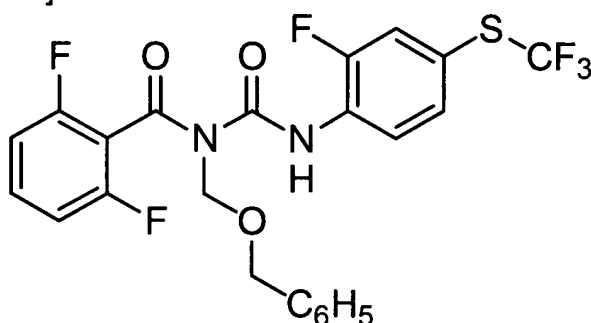


- ^1H -RMN (DMSO-d_6 , Temperatura de avaliação; 80°C) δ : 3,30 (3H, s), 3,64 (2H, t, $J = 5,5$ Hz), 3,76 (2H, t, $J = 5,5$ Hz), 4,97 (2H, s), 7,10 (2H, t, $J = 8,4$ Hz), 7,46 - 7,59 (3H, m), 7,67 (1H, dd, $J = 10,0, 2,0$ Hz).
- 20

Exemplo de Produção 68

A uma solução de 1,0 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia em 8 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionados 440 mg de éter clorometil benzílico e Em seguida, 110 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante três horas. A uma mistura reacional foram adicionados água e acetato de etila, lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 85: 15) para fornecer 762 mg de 1-benziloximetil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia.

1-Benziloximetil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio) fenil]ureia



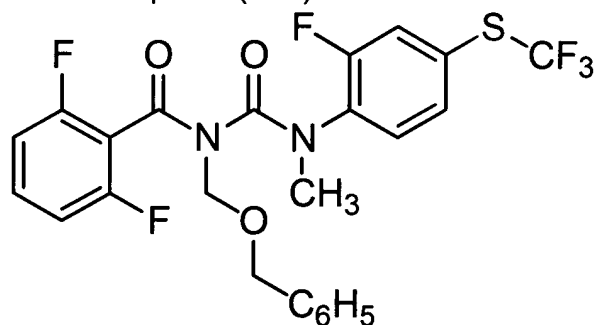
^1H -RMN (CDCl_3) δ : 4,58 (2H, s), 5,32 (2H, s), 6,99 (2H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,19 - 7,35 (5H, m), 7,39 - 7,51 (3H, m), 8,37 (1H, t, $J = 8,3$ Hz), 11,35 (1H, br).

Exemplo 126

A uma solução de 762 mg de 1-benziloximetil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia em 8 mL de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona foram adicionados 0,2 mL de iodeto de metila e Em seguida, 100 mg de hidreto de sódio (conteúdo; 60% em peso em óleo), e agitada em temperatura ambiente durante 24 horas. A uma mistura reacional foi adicionado acetato de etila, lavada sequencialmente com água e uma solução salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidroso, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexa-

no: acetato de etila = 85: 15) para fornecer 149 mg de 1-benziloximetil-1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (126)).

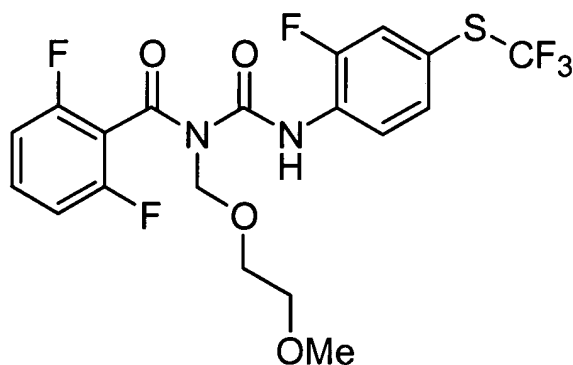
O presente composto (126)



- 5 ^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação; 80°C) δ : 3,31 (3H, s), 4,54 (2H, s), 4,96 (2H, s), 7,09 (2H, t, J = 8,5 Hz), 7,19 - 7,24 (2H, m), 7,26 - 7,34 (3H, m), 7,48 (1H, t, J = 8,1 Hz), 7,51 - 7,58 (2H, m), 7,66 (1H, dd, J = 10,0, 2,0 Hz).

Exemplo de Produção 69

- 10 1-(2,6-Difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]ureia (2,0 g) foi dissolvido em 1,3-dimetil-2-imidazolidinona (10ml), e éter 2-metoxietil clorometílico (758 mg) e hidreto de sódio (60% em óleo; 200 mg) foram adicionados a ele, seguido por agitação em temperatura ambiente durante 3 horas. À mistura reacional resultante foi adicionada água, e extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada sequencialmente com
- 15 água e salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25). Ao resíduo resultante foi adicionado hexano,
- 20 filtrado, e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para fornecer 1,57 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(2-metoxietoximetil)ureia.
- 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(2-metoxietoximetil)ureia

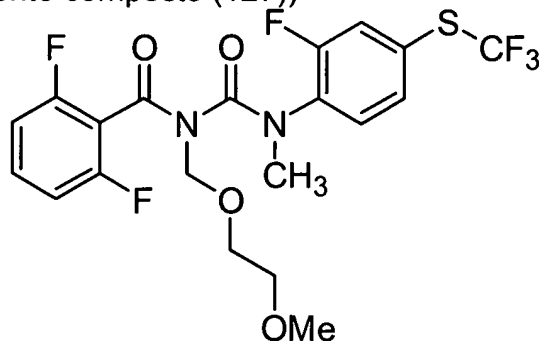


^1H -RMN (CDCl_3) δ : 3,31 (3H, s), 3,47 (2H, t, $J = 4,5\text{Hz}$), 3,69 (2H, t, $J = 4,5\text{Hz}$), 5,33 (2H, s), 7,00 (2H, t, $J = 8,0\text{Hz}$), 7,39 - 7,52 (3H, m), 8,35 (1H, t, $J = 8,0\text{Hz}$), 11,36 (1H, br).

Exemplo 127

- 5 1-(2,6-Difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio)fenil]-1-(2-metoxietoximetil)ureia (1,57 g) foi dissolvido em 1,3-dimetil-2-imidazolidinona (10 ml), e iodeto de metila (0,4 ml) e hidreto de sódio (60% em óleo; 156 mg) foram adicionados a ele, seguido por agitação em temperatura ambiente durante 16 horas. A uma mistura reacional foi adicionado acetato de etila. A
- 10 solução foi lavada sequencialmente com água e salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 75: 25) para fornecer 300 mg de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2-flúor-4-(trifluorometiltio) fenil]-
- 15 1-(2-metoxietoximetil)-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (127)).

O presente composto (127))

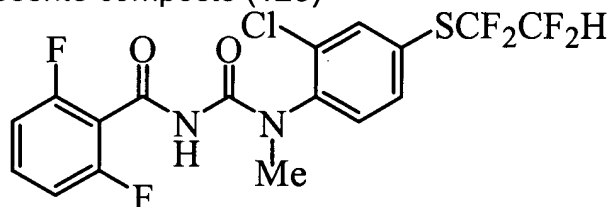


- ^1H -RMN (DMSO-d_6 , Temperatura de avaliação; 80°C) δ : 3,20 (3H, s), 3,30 (3H, s), 3,38 (2H, t, $J = 4,9\text{Hz}$), 3,58 (2H, t, $J = 4,9\text{Hz}$), 4,92 (2H, s), 7,10 (2H, t, $J = 8,5\text{Hz}$), 7,45 - 7,59 (3H, m), 7,66 (1H, dd, $J = 10,1, 1,9\text{Hz}$).
- 20

Exemplo 128

A uma mistura de 2-cloro-N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)anilina (1,0 g) e éter dietílico (4,0 ml) foi adicionada uma solução de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla (0,67 g) em éter dietílico (1,0 ml) sob resfriamento, e a mistura resultante foi agitada em temperatura ambiente durante 2 horas. A uma mistura reacional foi adicionado hexano pouco a pouco sob resfriamento, e sólidos brancos foram depositados. Coletando-se os sólidos com filtração, 1,40 g de 1-[2-cloro-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (128)) foi obtido.

O presente composto (128)

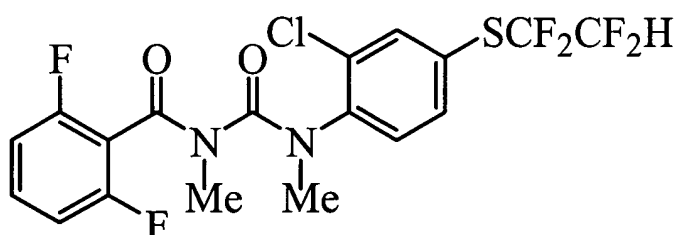


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 3,22 (3H, brs), 5,75 - 6,02 (1H, m), 6,92 - 6,99 (2H, m), 7,36 - 7,45 (2H, m), 7,51 (1H, br), 7,67 - 7,69 (1H, m), 7,86 (1H, brs)

Exemplo 129

15 1-[2-Cloro-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1-metilureia (1,01 g) foi dissolvido em 1-metil-2-pirrolidona (10ml), e hidreto de sódio (105 mg) foi adicionado a ele a 2°C , seguido por agitação durante 30 minutos. A uma mistura reacional foi adicionado iodeto de metila (0,33 ml) a 2°C , e agitada a 2 a 3°C durante 3 horas. A uma mistu-
20 ra reacional foi adicionada uma solução mista de solução de cloreto de amônio aquosa saturada (10 ml) e água (10 ml) sob resfriamento, e extraída três vezes com acetato de etila (20 ml). A camada orgânica combinada foi lavada três vezes com salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por
25 cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,85 g de 1-[2-cloro-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (129)).

O presente composto (129))

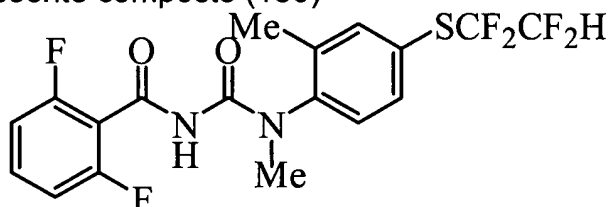


^1H -RMN (DMSO-d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 3,07 (3H, brs), 3,26 (3H, brs), 6,50 - 6,78 (1H, m), 7,08 - 7,12 (2H, m), 7,46 - 7,56 (2H, m), 7,64 - 7,67 (1H, m), 7,82 (1H, s).

Exemplo 130

- 5 A uma mistura de 2-metil-N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetil) anilina (1,0 g) e éter dietílico (4,0 ml) foi adicionada uma solução de isocianato de 2,6-difluorobenzoila (0,72 g) em éter dietílico (1,0 ml) sob resfriamento, e a mistura resultante foi agitada em temperatura ambiente durante 2 horas. A mistura reacional foi concentrada. O resíduo foi purificado por cromatografia
- 10 de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 1,32 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-metil-1-[2-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetil)io]fenil]ureia (a seguir, referido como o presente composto (130)).

O presente composto (130)



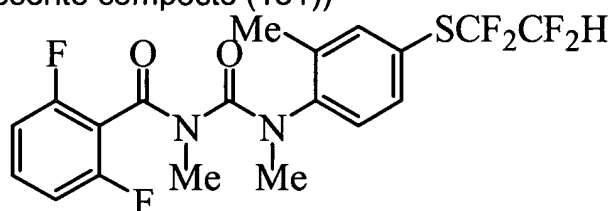
- 15 ^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,34 (3H, brs), 3,19 (3H, brs), 5,72 - 6,00 (1H, m), 6,92 - 6,96 (2H, m), 7,26 - 7,30 (1H, m), 7,35 - 7,43 (1H, m), 7,47 (1H, br), 7,60 - 7,62 (1H, m), 7,66 (1H, brs).

Exemplo 131

- 20 3-(2,6-Difluorobenzoyl)-1-metil-1-[2-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetil)io]fenil]ureia (1,01 g) foi dissolvido em 1-metil-2-pirrolidona (10,0 ml), e hidreto de sódio (110 mg) foi adicionado a ele a 2°C , seguido por agitação durante 30 minutos. À mistura resultante foi adicionado iodeto de metila (0,34 ml) a 2°C , e agitada a 2 a 3°C durante 3 horas. A uma mistura reacional foi adicionada uma solução mista de solução de cloreto de amônio
- 25 aquosa saturada (10 ml) e água (10 ml) sob resfriamento, e extraída três

vezes com acetato de etila (20 ml). A camada orgânica combinada foi lavada três vezes com salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,85 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-1,3-dimetil-3-[2-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]ureia (a seguir, referido como o presente composto (131)).

O presente composto (131))

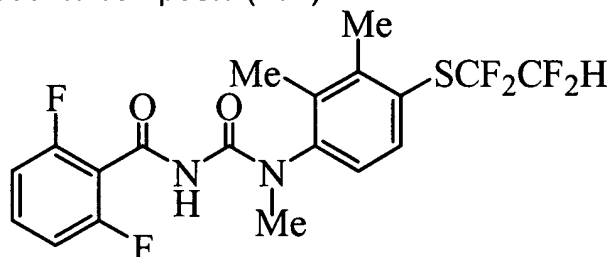


^1H -RMN (DMSO- d_6 , Temperatura de avaliação 80°C) δ (ppm): 2,17 (3H, brs), 3,05 (3H, brs), 3,23 (3H, s), 6,44 - 6,72 (1H, m), 7,10 - 7,14 (2H, m), 7,26 - 7,28 (1H, m), 7,49 - 7,54 (3H, m)

Exemplo 132

A uma mistura de 2,3-dimetil-N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)anilina (1,0 g) e éter dietílico (4,0 ml) foi adicionada uma solução de isocianato de 2,6-difluorobenzoila (0,69 g) em éter dietílico (1,0 ml) sob resfriamento, e a mistura resultante foi agitada em temperatura ambiente durante 1 hora. Coletando-se os sólidos brancos depositados na mistura reacional com filtração, 1,63 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2,3-dimetil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-3-metilureia (a seguir, referido como o presente composto (132)) foi obtido.

O presente composto (132)

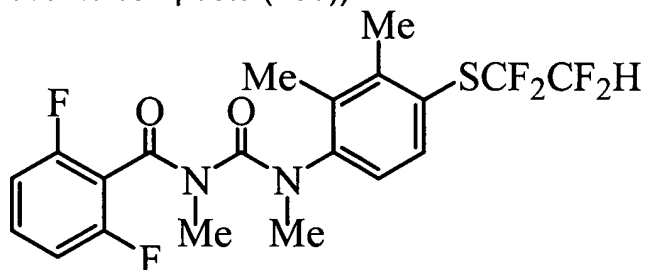


^1H -RMN (CDCl_3) δ (ppm): 2,27 (3H, s), 2,58 (3H, s), 3,18 (3H, s), 5,72 - 5,99 (1H, m), 6,92 - 6,96 (2H, m), 7,14 - 7,16 (1H, m), 7,35 - 7,43 (2H, m), 7,67 - 7,69 (1H, m)

Exemplo 133

1-(2,6-Difluorobenzoil)-3-[2,3-dimetil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-3-metilureia (1,01 g) foi dissolvido em 1-metil-2-pirrolidona (10,0 ml), e hidreto de sódio (107 mg) foi adicionado a ele a 2°C, seguido por agitação durante 30 minutos. À mistura resultante foi adicionado iodeto de metila (0,33 ml) a 2°C, e agitada a 2 a 3°C durante 3 horas. A uma mistura reacional foi adicionada uma solução mista de solução de cloreto de amônio aquosa saturada (10 ml) e água (10 ml) sob resfriamento, e extraída lavada três vezes com acetato de etila (20 ml). A camada orgânica combinada foi lavada três vezes com salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: clorofórmio: hexano = 1: 1: 4) para fornecer 0,98 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-3-[2,3-dimetil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetiltio)fenil]-1,3-dimetilureia (a seguir, referido como o presente composto (133)).

O presente composto (133))

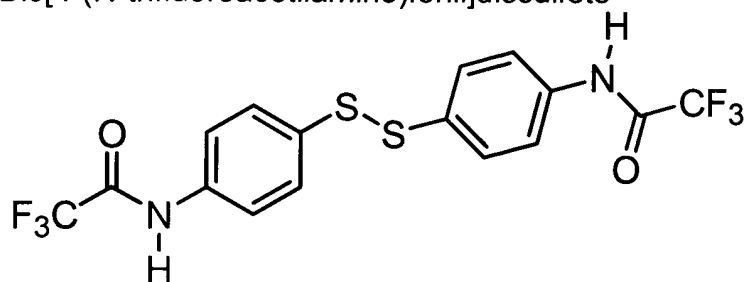


¹H-RMN (DMSO-d₆, Temperatura de avaliação 80 °C) δ (ppm): 2,12 (3H, brs), 2,48 (3H, brs), 3,07 (3H, brs), 3,22 (3H, brs), 6,42 - 6,70 (1H, m), 7,10 - 7,14 (3H, m), 7,49 - 7,55 (2H, m)

Exemplo de Produção 70

A uma mistura de bis(4-aminofenil)dissulfeto (5,0 g), clorofórmio (100 ml) e trietilamina (8,4 ml) foi adicionado gota a gota anidrido trifluoroacético (8,4 ml) a 2 a 7°C. A mistura resultante foi agitada a 20°C durante 1 hora. A mistura reacional foi vertida em água gelada (100 ml), e extraída com acetato de etila (200 ml). A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 9,55 g de bis[4-(N-trifluoroacetilamino)fenil]dissulfeto.

Bis[4-(N-trifluoroacetilamino)fenil]dissulfeto

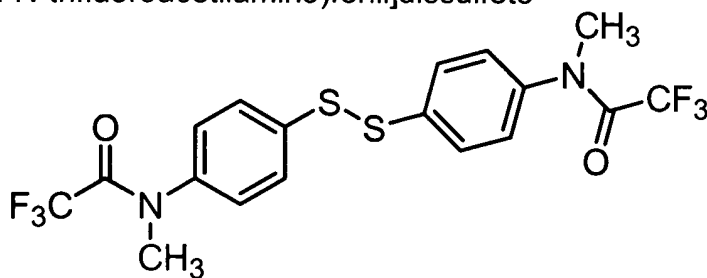


^1H -RMN (DMSO- d_6) δ : 7,55 - 7,59 (4H, m), 7,68 - 7,72 (4H, m), 11,37 (2H, brs).

Exemplo de Produção 71

- 5 A uma mistura de bis[4-(N-trifluoroacetilamino)fenil]dissulfeto (9,21 g) e dimetilsulfóxido (90 ml) foi adicionado hidreto de sódio (60% em óleo; 2,40 g), e agitada em temperatura ambiente durante 30 minutos. Iodeto de metila (7,5 ml) foi adicionado gota a gota a ela, e agitada em temperatura ambiente durante 1 hora. A uma mistura reacional foram adicionados água
- 10 gelada (150 ml) e acetato de etila (150 ml), e separadas as camadas. A camada orgânica foi lavada duas vezes com salina saturada (150 ml), secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (hexano: acetato de etila = 1: 5 a 1: 2) para fornecer 7,56 g de bis[4-(N-metil-N-
- 15 trifluoroacetilamino)fenil]dissulfeto.

Bis[4-(N-metil-N-trifluoroacetilamino)fenil]dissulfeto

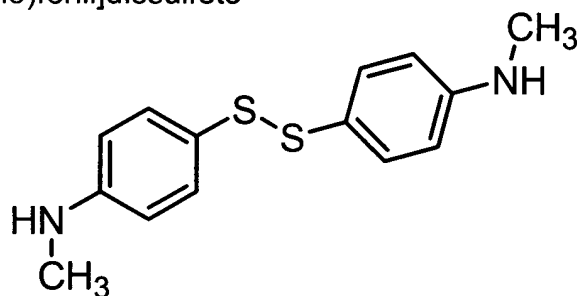


^1H -RMN (CDCl_3) δ : 3,33 (6H, s), 7,16 - 7,21 (4H, m), 7,51 - 7,59 (4H, m).

Exemplo de Produção 72

- A uma mistura de bis[4-(N-metil-N-trifluoroacetilamino) fe-
- 20 nil]dissulfeto (6,87 g) e metanol (60 ml) foi adicionado carbonato de potássio (4,10 g), e agitada em temperatura ambiente durante 4 horas. Hidreto de sódio (60% em óleo; 200 mg) foi adicionado a ela, e agitada em temperatura ambiente durante 3 horas. A mistura reacional foi filtrada, e o filtrado foi con-

- centrado sob pressão reduzida. Ao resíduo resultante foram adicionados água (100 ml) e clorofórmio (100 ml), e separadas as camadas. A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (clorofórmio) para fornecer 3,39 g de bis[4-(N-metilamino)fenil]dissulfeto.
- 5 Bis[4-(N-metilamino)fenil]dissulfeto

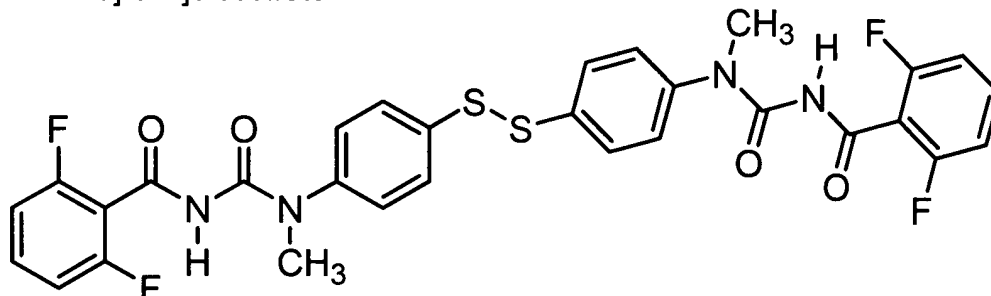


^1H -RMN (CDCl_3) δ : 2,83 (6H, s), 3,86 (2H, brs), 6,49 - 6,53 (4H, m), 7,25 - 7,30 (4H, m).

Exemplo de Produção 73

- 10 A uma mistura de bis[4-(N-metilamino)fenil]dissulfeto (1,00 g) e éter dietílico (10 ml) foi adicionada uma mistura de isocianato de 2,6-difluorobenzoíla (1,46 g) e éter dietílico (2,0 ml) sob resfriamento. A mistura resultante foi agitada em temperatura ambiente durante 6 horas. Os sólidos depositados na mistura reacional foram coletados por filtração, e 2,30 g de
- 15 bis[4-[N-[(2,6-difluorobenzoil)aminocarbonil]-N-metilamino]fenil]dissulfeto foi obtido.

Bis[4-[N-[(2,6-difluorobenzoil)aminocarbonil]-N-metilamino]fenil]dissulfeto



- 20 ^1H -RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 3,22 (6H, s), 7,11 - 7,15 (4H, m), 7,29 - 7,31 (4H, m), 7,47 - 7,52 (2H, m), 7,58 - 7,59 (4H, m), 7,39 - 7,52 (3H, m), 10,66 (2H, brs).

Exemplo de Produção 74

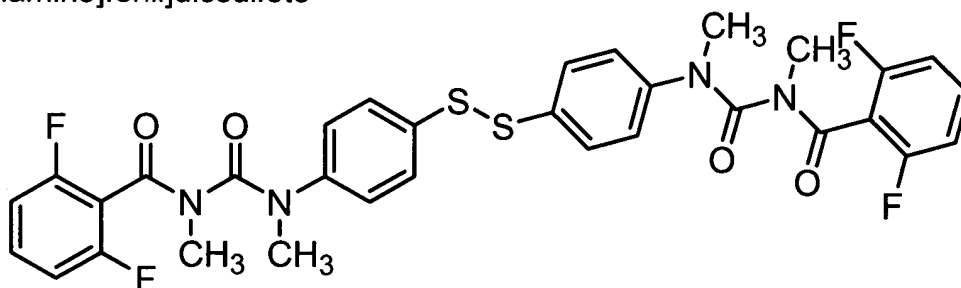
A uma mistura de bis[4-[N-[(2,6-difluorobenzoil)aminocarbonil]-N-

metilamino]fenil]dissulfeto (2,00 g) e 1-metil-2-pirrolidona (20,0 ml) foi adicionado hidreto de sódio (0,31 g) a 2°C, e agitada durante 30 minutos. À mistura resultante foi adicionado iodeto de metila (0,93 ml) a 2°C, e agitada a 2 a 3°C durante 3 horas. A uma mistura reacional foi adicionada uma solução

5 mista de solução de cloreto de amônio aquosa saturada (20 ml) e água (20 ml) sob resfriamento, e extraída três vezes com acetato de etila (40 ml). A camada orgânica combinada foi lavada três vezes com salina saturada, secada sobre sulfato de magnésio anidro, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: hexano = 1: 1) para fornecer 1,67 g de bis[4-[N-[N'-(2,6-

10 difluorobenzoil)-N'-metilaminocarbonil]-N-metilamino]fenil]dissulfeto.

Bis[4-[N-[N'-(2,6-difluorobenzoil)-N'-metilaminocarbonil]-N-metilamino]fenil]dissulfeto



¹H-RMN (CDCl₃) δ: 3,03 (6H, s), 3,29 (6H, s), 6,85 - 7,15 (8H, m), 7,32 - 7,36 (2H, m), 7,46 - 7,48 (4H, m).

15

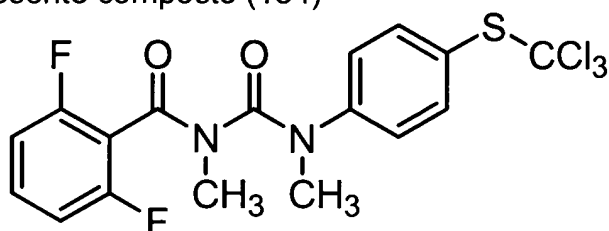
Exemplo 134

A uma mistura de bis[4-[N-[N'-(2,6-difluorobenzoil)-N'-metilaminocarbonil]-N-metilamino]fenil]dissulfeto (1,67 g) e N,N-dimetilformamida (16 ml) foi adicionado tricloroacetato de sódio (1,60 g), e

20 aquecida a 100°C durante 10 minutos. A mistura reacional foi filtrada através de Celita. O filtrado foi concentrado sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia de sílica-gel (acetato de etila: hexano = 1: 1), Em seguida, purificado por cromatografia líquida de desempenho elevado preparativa de pressão média (hexano: acetato de etila = 15: 85 a 20: 80) para

25 fornecer 0,49 g de 1-(2,6-difluorobenzoil)-1,3-dimetil-3-[4-(triclorometiltio)fenil]ureia (a seguir, referido como o presente composto (134)).

O presente composto (134)



^1H -RMN (DMSO- d_6) δ : 3,05 (3H, s), 3,29 (3H, s), 7,13 - 7,50 (4H, m), 7,51 - 7,59 (1H, m), 7,79 - 7,81 (2H, m).

A seguir, Exemplos de Preparação serão mostrados. Além disso,
5 as partes representam partes por peso.

Exemplo de Preparação 1

Em uma mistura de 35 partes de xileno e 35 partes de N,N-dimetilformamida, 10 partes de qualquer um dos presentes compostos (1) a (134) são dissolvidas, e Em seguida, 14 partes de estirilfenil éter de polioxie-
10 tileno e 6 partes de dodecilbenzenossulfonato de cálcio são adicionadas. A mistura é agitada cuidadosamente para obter uma emulsão a 10%.

Exemplo de Preparação 2

A uma mistura de 4 partes de laurilsulfato de sódio, 2 partes de ligninsulfonato de cálcio, 20 partes de pó fino de óxido de silício hidroso sintético e 54 partes de terra diatomácea, 20 partes de qualquer um dos presentes compostos (1) a (134) são adicionadas. A mistura é agitada cuidadosamente para obter um pó umectável a 20%.

Exemplo de Preparação 3

Às 2 partes de qualquer um dos presentes compostos (1) a (134), 1 parte de pó fino de óxido de silício hidroso sintético, 2 partes de ligninsulfonato de cálcio, 30 partes de bentonita e 65 partes de argila de caulim são adicionadas, e Em seguida, agitadas cuidadosamente. Em seguida, uma quantidade apropriada de água é adicionada à mistura. A mistura é também agitada, granulada com um granulador, e secada por ar forçado para obter
25 um grânulo a 2%.

Exemplo de Preparação 4

Em uma quantidade apropriada de acetona, 1 parte de qualquer um dos presentes compostos (1) a (134) é dissolvida, e Em seguida, 5 par-

tes de pó fino de óxido de silício hidroso sintético, 0,3 parte de PAP e 93,7 partes de argila fubasami são adicionadas. A mistura é agitada cuidadosamente. Em seguida, acetona é removida da mistura por evaporação para obter um pó a 1%.

5 Exemplo de Preparação 5

Uma mistura de 10 partes de qualquer um dos presentes compostos (1) a (134); 35 partes de carbono branco contendo 50 partes de sal de amônio de sulfato de alquil éter de polioxietileno; e 55 partes de água é bem moída por um método de moagem úmida para obter um agente fluível a 10%.

Exemplo de Preparação 6

Em 5 partes de xileno e 5 partes de tricloroetano, 0,1 parte de qualquer um dos presentes compostos (1) a (134) é dissolvida. A solução é misturada com 89,9 partes de querosene desodorizado para obter um óleo a 0,1%.

Exemplo de Preparação 7

Em 0,5 mL de acetona, 10 mg de qualquer um dos presentes compostos (1) a (134) são dissolvidos. A solução é misturada uniformemente com 5 g de um pó de alimentação sólido para animais (pó de alimentação sólido para criação e reprodução de CE - 2, fabricado por CLEA Japan, Inc.), e Em seguida, secada por evaporação de acetona para obter alimentação de veneno.

Em seguida, será mostrado por Exemplos de Teste que o presente composto é eficaz para controlar pestes.

25 Exemplo de Teste 1

Dez partes do presente composto (1), (2), (5) a (19), (21) a (34), (36) a (61), (63), (64), (68) a (71), (74), (76) a (78), (82) a (83), (89), (93), (94), (97), (99), (102) a (110), (111), (115), (116) (117) a (120) ou (123) a (134); 35 partes de carbono branco contendo 50 partes de sal de amônio de sulfato de alquil éter de polioxietileno; e 55 partes de água foram misturadas, e bem moídas por um método de moagem úmida para obter um agente fluível a 10%. O agente fluível obtido foi diluído com água de modo que a con-

centração de ingrediente ativo se tornasse 500 ppm para preparar uma solução *spray* para teste.

Repolhos foram plantados em xícaras de polietileno, e desenvolvidos até a terceira folha real ou a quarta folha real ser desenvolvida. A solução *spray* para teste preparada acima foi vaporizada em uma taxa de 20 ml/xícara sobre os repolhos.

Após a solução pesticida vaporizada sobre os repolhos ser secada, 5 larvas de segundo-instar de *Plutella xilostella* foram colocadas sobre os repolhos. Após 5 dias, o número de *Plutella xilostella* mortas foi examinado, e uma taxa de peste morta foi calculada pela seguinte equação:

Taxa de peste morta (%) = (o número de pestes mortas / o número de pestes testadas) × 100

Como um resultado, na área tratada com cada uma das soluções *spray* para teste dos presentes compostos (1), (2), (5) a (19), (21) a (34), (36) a (61), (63), (64), (68) a (71), (74), (76) a (78), (82), (83), (89), (93), (94), (97), (99), (102) a (110), (111), (115), (116), (117) a (120) e (123) a (134), um valor de controle de 100% foi exibido.

Exemplo de Teste 2

Em 0,25 mL de uma solução de mistura de Sorgen TW-20 (fabricado por Daiichi Industries Pharmaceuticals, Co., Ltd.) e acetona (relação de volume de mistura; Sorgen TW-20: acetona = 1: 19), 2,5 mg do presente composto (1), (2), (3), (4), (7), (10), (11), (12), (16), (18), (19), (20), (21), (22), (25), (30), (36), (37), (41), (42), (52), (54), (56), (57), (60), (62), (105) ou (109) foram dissolvidas. A solução foi diluída com água permutada por íon de modo que a concentração de ingrediente ativo se tornasse uma concentração predeterminada para preparar uma solução pesticida para teste do composto de teste. A parte de raiz de repolhos no período de quarta folha foi lavada com água de torneira para remover a terra, e Em seguida, imersa na solução pesticida para teste. Após 5 dias de imersão da parte de raiz, a parte de raiz foi removida, e as folhas e troncos foram colocados em uma xícara (volume; 180 mL). Na xícara 10 larvas de segundo-instar de *Plutela xilostella* foram liberadas, e a xícara foi armazenada a 24°C. Após 5 dias, o número

de pestes mortas foi contado, e a taxa de peste morta foi calculada pela seguinte equação:

Taxa de peste morta (%) = (o número de pestes mortas / o número de pestes testadas) x 100

- 5 Como um resultado, o presente compostos (1), (2), (3), (4), (7)**,
(10), (11), (12), (16), (18)*, (19)*, (20)**, (21)*, (22)**, (25)**, (30)**, (36)**,
(37), (41), (42), (52)**, (54), (56), (57)**, (60), (62), (105) e (109) cada qual
exibiu uma taxa de peste morta de 100%.

*: concentração de teste de 1 ppm

- 10 **: concentração de teste de 5 ppm

As concentrações de teste dos outros presentes compostos foram 25 ppm.

Exemplo de Teste 3

- 15 Dez partes do presente composto (1) a (5), (7) a (13), (18) a
(33), (35) a (49), (52) a (56), (58) a (61), (71), (73) a (77), (79), (80), (82),
(83), (93), (94), (95), (96), (97), (100) a (109), (111), (112), (115), (117),
(119), (121), ou (123) a (133), 35 partes de carbono branco contendo 50 partes
de sal de amônio de sulfato de alquil éter de polioxietileno, e 55 partes de
água foram misturados, e bem moídas por um método de moagem úmida
20 para obter uma preparação. A preparação obtida foi diluída com água de
modo que a concentração de ingrediente ativo se tornasse 500 ppm para
preparar uma solução pesticida para teste. No fundo de uma xícara de polietileno
tendo um diâmetro de 5,5 cm, um papel filtro tendo um diâmetro de 5,5
cm foi colocado, no qual Insecta LF (Nippon Agriculture Industries, Co., Ltd.)
25 foi cortado em uma espessura de 6 mm e outra metade cortada foi depositada,
e a qual 2 mL da solução pesticida descrita acima para teste foram adicionados.
Após secada por ar, 5 larvas quarto-instar de *Spondoptela litura* foram liberadas na
xícara, e a xícara foi tampada. Após 6 dias, o número de pestes mortas foi
30 contado, e a taxa de peste morta foi calculada pela seguinte equação:

Taxa de peste morta (%) = (o número de pestes mortas / o número de pestes testadas) x 100

Como um resultado, os presentes compostos (1) a (5), (7) a (13), (18) a (33), (35) a (49), (52) a (56), (58) a (61), (71), (73) a (77), (79), (80), (82), (83), (93), (94), (95), (96), (97), (100) a (109), (111), (112), (115), (117), (119), (121), e (123) a (133) cada qual exibiu uma taxa de peste morta de 100%.

Exemplo de Teste 4

Dez partes do presente composto (1), (2), (4), (7), (10) a (13), (18) a (20), (22), (23), (24), (25), (28), (29), (30), (31), (34), (36), (40), (41), (45), (47), (49), (52) a (54), (56), (62), (69), (71), (73), (76), (81), (97), (101), (104), (105), (106), (107), (108), (109), (110), (117) ou (131); 35 partes de carbono branco contendo 50 partes de sal de amônio de sulfato de alquil éter de polioxietileno; e 55 partes de água foram misturadas, e bem moídas por um método de moagem úmida para obter uma preparação. A preparação obtida foi diluída com água de modo que a concentração de ingrediente ativo se tornasse uma concentração pré-determinada para preparar uma solução *spray* para teste. Pepinos foram plantados em xícaras de polietileno, e foram desenvolvidos até a primeira folha real ser desenvolvida. A solução *spray* para teste preparada acima foi vaporizada na taxa de 20 ml/xícara sobre o pepino. Após a solução pesticida vaporizada sobre o pepino ser secada, a primeira folha real foi cortada e Em seguida, colocada sobre um papel filtro (diâmetro: 70 mm) contendo água em uma xícara de polietileno (diâmetro: 110 mm). Na folha de pepino, 30 larvas de *Frankliniella occidentalis* foram liberadas, e a xícara de polietileno foi tampada. Sete dias após vaporização, o número de pestes sobreviventes na folha de pepino foi contado, e um valor de controle foi calculado pela seguinte equação:

$$\text{Valor de controle(\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

em que, cada símbolo tem o seguinte significado:

Cb: o número de pestes antes do tratamento em uma área não tratada

Cai: o número de pestes no momento de observação em uma área não tratada

Tb: o número de pestes antes do tratamento em uma área trata-

da

Tai: o número de pestes no momento de observação em uma área tratada.

Como um resultado, na área tratada com cada das soluções s-pray de teste dos presentes compostos (1), (2), (4), (7)**, (10) a (13), (18) a (20), (22)*, (23)**, (24)**, (25)**, (28), (29), (30), (31), (34), (36)**, (40)**, (41), (45), (47), (49), (52) a (54), (56), (62), (69), (71), (73), (76), (81), (97), (101), (104), (105), (106), (107), (108), (109), (110), (117) e (131), um valor de controle de 100% foi exibido.

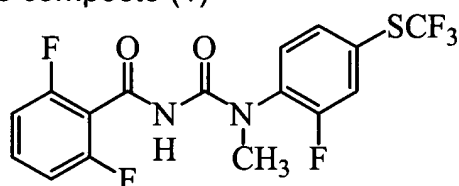
10 *: concentração de teste de 3,2 ppm

** : concentração de teste de 12,5 ppm

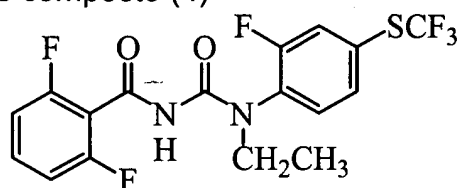
As concentrações de teste dos outros presentes compostos foram 50 ppm.

Exemplo de Teste 5

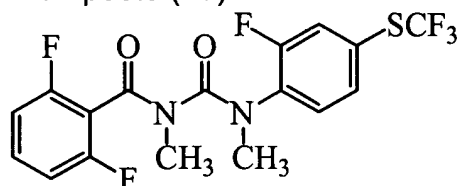
15 O presente composto (1)



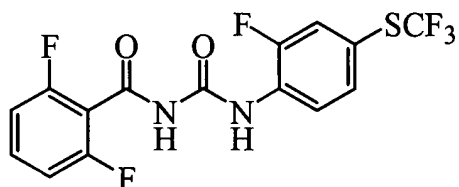
O presente composto (4)



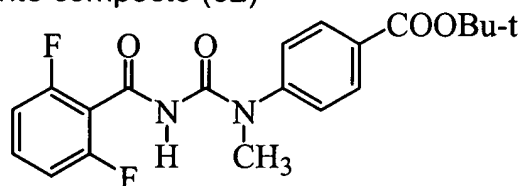
O presente composto (10)



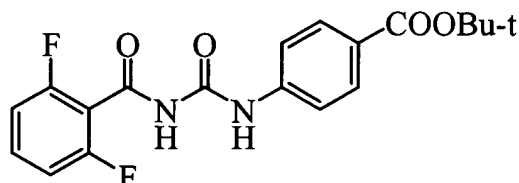
Composto comparativo A (um composto descrito em US 2005-0159599A1)



O presente composto (82)



Composto comparativo B (um composto descrito em USP 4.234.600)



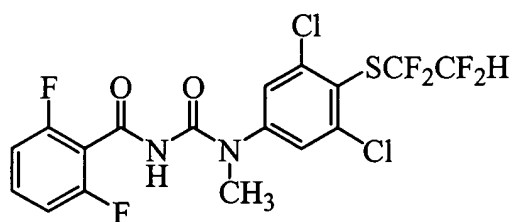
Em 0,25 mL de uma solução mista de Tween-20 e acetona (relação de volume de mistura: Tween-20: acetona = 1: 19), 2,5 mg do presente composto (1), (4), (10), (82), composto comparativo A ou B foram dissolvidas. A solução foi diluída com água permutada por íon de modo que a concentração de ingrediente ativo se tornasse a concentração pré-determinada (25 ppm) para preparar uma solução pesticida para teste do composto de teste. A parte de raiz de repolhos no período de quarta folha foi lavada com água de torneira para remover a terra, e Em seguida, imersa na solução pesticida para teste. Após 5 dias de imersão da parte de raiz, a parte de raiz foi removida, e as folhas e troncos foram colocados em uma xícara (volume; 180 mL). Na xícara 10 larvas de segundo-instar de *Plutela xilostella* foram liberadas, e a xícara foi armazenada a 24°C. Após 5 dias, o número de pestes mortas foi contado, e a taxa de peste morta foi calculada pela seguinte equação:

Taxa de peste morta (%) = (o número de pestes mortas / o número de pestes testadas) x 100

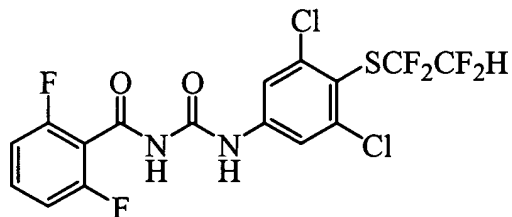
Como um resultado, os presentes compostos (1), (4), (10) e (82) cada qual exibiu uma taxa de peste morta de 80 a 100%. Por outro lado, o composto comparativo A exibiu uma taxa de peste morta de 5%, e o composto comparativo B exibiu uma taxa de peste morta de 0%.

Exemplo de Teste 6

O presente composto (93)



Composto comparativo C (um composto descrito na USP 4.468.405)



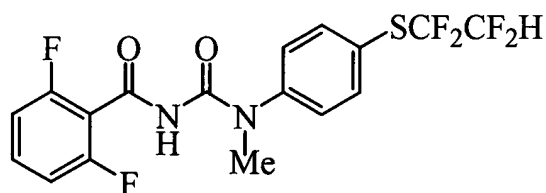
Em 0,25 mL de uma solução mista de Tween-20 e acetona (relação de volume de mistura: Tween-20: acetona = 1: 19), 2,5 mg do presente composto (93) ou composto comparativo C foram dissolvidas. A solução foi diluída com água permutada por íon de modo que a concentração de ingrediente ativo se tornasse a concentração pré-determinada (100 ppm) para preparar uma solução pesticida para teste do composto de teste. A parte de raiz de repolhos no período de quarta folha foi lavada com água de torneira para remover a terra, e Em seguida, imersa na solução pesticida para teste. Após 5 dias de imersão da parte de raiz, a parte de raiz foi removida, e as folhas e troncos foram colocados em uma xícara de polietileno (volume; 180 mL). Na xícara 10 larvas de segundo-instar de *Plutela xilostella* foram liberadas, e a xícara foi armazenada a 24°C. Após 5 dias, o número de pestes mortas foi contado, e a taxa de peste morta foi calculada pela seguinte equação:

Taxa de peste morta (%) = (o número de pestes mortas / o número de pestes testadas) x 100

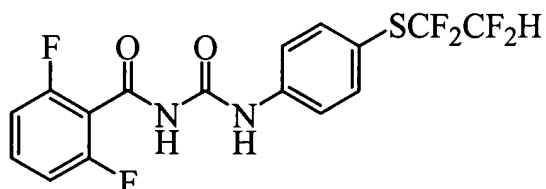
Como um resultado, o presente composto (93) exibiu uma taxa de peste morta de 90%. Por outro lado, o composto comparativo exibiu uma taxa de peste morta de 20%.

Exemplo de Teste 7

O presente composto (94)



Composto comparativo D (um composto descrito em USP 4.170.657)



Em 0,25 mL de uma solução mista de Tween-20 e acetona (relação de volume de mistura: Tween-20: acetona = 1: 19), 2,5 mg do presente composto (94) ou composto comparativo D foram dissolvidas. A solução foi diluída com água permutada por íon de modo que a concentração de ingrediente ativo se tornasse a concentração pré-determinada (25 ppm) para preparar uma solução pesticida para teste do composto de teste. A parte de raiz de repolhos no período de quarta folha foi lavada com água de torneira para remover a terra, e Em seguida, imersa na solução pesticida para teste. Após 5 dias de imersão da parte de raiz, a parte de raiz foi removida, e as folhas e troncos foram colocados em uma xícara de sorvete (volume; 180 mL). Na xícara 10 larvas de segundo-instar de *Plutela xilostella* foram liberadas, e a xícara foi armazenada a 24°C. Após 5 dias, o número de pestes mortas foi contado, e a taxa de peste morta foi calculada pela seguinte equação:

Taxa de peste morta (%) = (o número de pestes mortas / o número de pestes testadas) x 100

Como um resultado, o presente composto (94) exibiu uma taxa de peste morta de 100%. Por outro lado, o composto comparativo exibiu uma taxa de peste morta de 20%.

Exemplo de Teste 8

Um papel filtro tendo um diâmetro de 33 mm (Nº. 1026 fabricado por Toyo Filter Paper, Co., Ltd.) foi tratado com solução de acetona (1 mL) de 10 mg / mL do presente composto (1) ou (12) empregando-se uma pipeta, e secado em temperatura ambiente. A seguir, o papel filtro resultante é referido como uma isca de papel filtro. Agarose a 4% foi vertida em uma pla-

ca de Petri de plástico tendo um diâmetro de 9 cm para tornar a espessura de cerca de 5 mm, e solidificada deixando em repouso em temperatura ambiente. Um orifício circular tendo um diâmetro de 35 mm (a seguir, referido como uma cavidade) foi feito na agarose solidificada. Uma isca de papel filtro foi colocada na cavidade. Em seguida, após 20 *ergates* de *Coptotermes formosanus* serem liberados na placa de Petri acima, a placa de Petri foi tampada, e selada com uma parapelícula. Após armazenagem em um local escuro durante 6 semanas, a placa de Petri foi aberta. A taxa de controle foi calculada observando-se a vida e morte das *Coptotermes formosanus* na placa de Petri. Como um resultado, o presente composto (10) exibiu uma taxa de controle de 65%, e o presente composto (12) exibiu uma taxa de controle de 60%.

Exemplo de Teste 9

Em uma solução mista (0,1 mL) de xileno e N,N-dimetilformamida (relação de volume de mistura; xileno: N,N-dimetilformamida = 1: 1), 30 mg do presente composto (3), (4), (20), (35), (62), (81), (100), (101) ou (112) foram dissolvidas, e também uma solução mista (0,1 mL) de xileno e SORPOL 3005X (fabricado por Toho Chemicals, Co., Ltd.) (relação de volume de mistura; xileno: SORPOL 3005X = 1: 9) foi adicionada a ela. A solução foi diluída com água permutada por íon de modo que o ingrediente ativo se tornasse a concentração pré-determinada para preparar uma solução pesticida para teste do composto de teste.

Pepinos foram plantados em xícaras de polietileno, e desenvolvidos até a terceira folha real ou a quarta folha real ser desenvolvida. A solução *spray* para teste preparada acima foi vaporizada em uma taxa de 20 ml/xícara sobre os repolhos.

Após a solução pesticida para teste ser secada, a parte aérea do repolho foi cortada, e colocada em uma xícara de polietileno tendo um volume de 100 ml juntamente com 10 larvas terceiro-instar de *Plutella xilostella*, e armazenada a 25°C. Após 5 dias, o número de pestes mortas foi contado, e a taxa de peste morta foi calculada pela seguinte equação:

Taxa de peste morta (%) = (o número de pestes mortas / o nú-

mero de pestes testadas) x 100

Como um resultado, os presentes compostos (3)*, (4)**, (20)*, (35)**, (62), (81), (100), (101), e (112)** exibiram uma taxa de peste morta de 100%, respectivamente.

5 *: concentração de teste de 12,5 ppm

 **: concentração de teste de 50 ppm

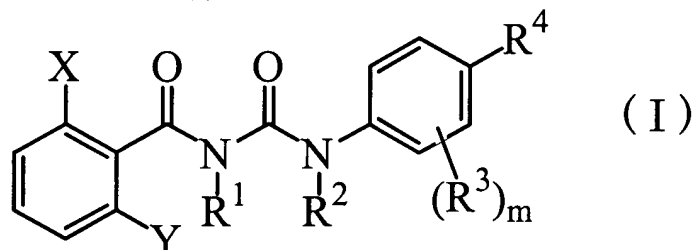
As concentrações de teste dos outros foram 200 ppm.

Aplicabilidade Industrial

10 O composto (I) ou um sal deste é útil como um ingrediente ativo para pesticidas uma vez que ele tem uma excelente eficácia no controle contra pestes.

REIVINDICAÇÕES

1. Composto de benzoilureia, caracterizado pelo fato de que é representado pela fórmula (I):



em que, X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou átomo de cloro, respectivamente,

R¹ representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo aril alquilocarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoíla, um grupo alcanoíla inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, grupo formila, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo alcanoilóxi inferior alquila inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4 e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcoxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de

halogênio,

R^2 representa um grupo alquila inferior,

R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

- 5 R^4 representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior
10 opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e

n representa um número inteiro de 0 a 2, e

m representa um número inteiro de 0 a 4; ou um sal destes.

2. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou
15 um átomo de cloro, respectivamente,

- R^1 representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alcóxicarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanoila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila infe-
- 20
- 25
- 30

rior, a um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 ou 2, e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,

R^2 representa um grupo alquila inferior,

R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

R^4 representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e

n representa um número inteiro de 0 a 2,

m representa um número inteiro de 0 a 2,

3. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que R^1 representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, um grupo N,N -di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanoila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo arilsulfonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, a um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 ou 2, e A

representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,

R^3 representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior,

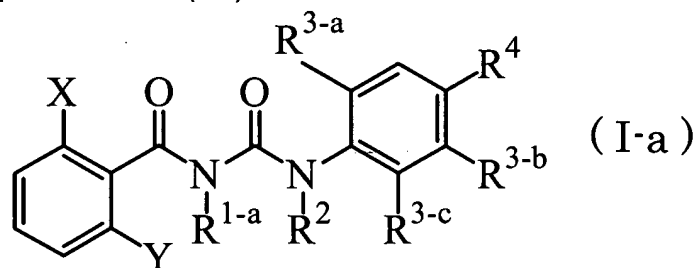
5 R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquênica inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquênica inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio.

10 4. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que n representa um número inteiro de 1 ou 2,

5. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que R^4 representa um grupo alcóxicarbonila inferior.

15 6. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que R^1 representa um grupo alquila inferior substituído com um ou mais átomos de halogênio.

7. Composto de benzoilureia, caracterizado pelo fato de que é representado pela fórmula (I-a):



20 em que, X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou átomo de cloro, respectivamente,

R^{1-a} representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila inferior,

R^2 representa um grupo alquila inferior, e

(1) quando R^{3-a} e R^{3-b} representam um átomo de halogênio, R^{3-c} representa um átomo de hidrogênio, ou

25 (2) quando R^{3-a} e R^{3-c} representam um átomo de halogênio, R^{3-b} representa um átomo de hidrogênio, ou

(3) quando R^{3-a} representa um átomo de halogênio ou um grupo

alquila inferior, R^{3-b} e R^{3-c} representam um átomo hidrogênio, e

R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0 a 2, ou um sal destes.

8. Composto de acordo com a reivindicação 7, caracterizado pelo fato de que

(1) quando R^{3-a} e R^{3-b} representam um átomo de halogênio, R^{3-c} representa um átomo de hidrogênio, ou

(2) quando R^{3-a} e R^{3-c} representam um átomo de halogênio, R^{3-b} representa um átomo de hidrogênio, e

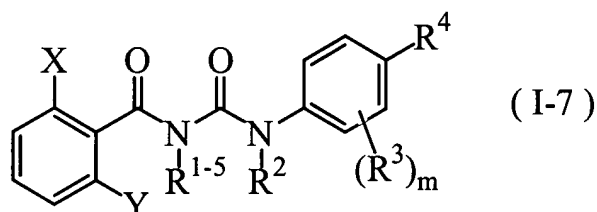
R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio.

9. Composto de acordo com a reivindicação 7, caracterizado pelo fato de que R^{3-a} representa um átomo de halogênio ou um grupo alquila inferior,

R^{3-b} e R^{3-c} representam um átomo hidrogênio, R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio.

10. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que R^3 representa um grupo alquila inferior substituído com um átomo de halogênio.

11. Processo para produzir um composto representado pela fórmula (I-7)



em que, X e Y independentemente representam um átomo de flúor ou um

átomo de cloro, respectivamente,

- R^{1-5} representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior,
- 5 or, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo
- 10 alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alcóxicarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanóila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halo-
- 15 gênio, grupo formila, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilsulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo alcanóilóxi inferior alquila inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila
- 20 inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4, e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,
- 25 R^2 representa um grupo alquila inferior,
- R^3 representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,
- R^4 representa um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente
- 30 substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente

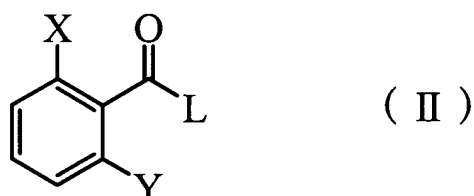
substituído com um ou mais átomos de halogênio, e

n representa um número inteiro de 0 a 2, e

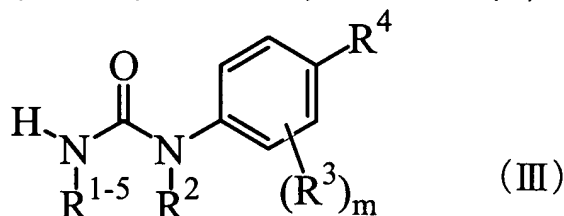
m representa um número inteiro de 0 a 4,

caracterizado pelo fato de que compreende reagir um composto representa-

5 do pela fórmula (II)



em que X e Y são como acima definido, e L representa um átomo de halo-
gênio, com um composto representado pela fórmula (III)



em que cada símbolo é como definido acima, em um solvente orgânico na
presença de uma base orgânica ou um carbonato de metal, e isolar.

10 12. Processo de acordo com a reivindicação 11, caracterizado
pelo fato de que

R^{1-5} representa um grupo alquila inferior,

R^3 representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila infe-
rior,

15 R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que
 R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou
mais átomos de halogênio, e n representa um número inteiro de 0, e

m representa um número inteiro de 1.

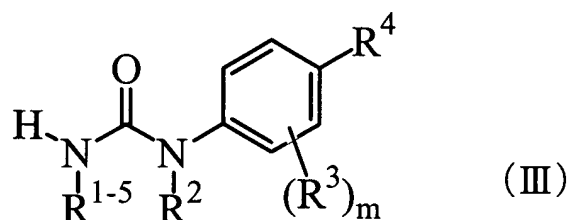
20 13. Pesticida, caracterizada pelo fato de que compreende o
composto ou um sal deste, como definido na reivindicação 1, como um in-
grediente ativo.

14. Uso do composto ou um sal deste como definido na reivindi-
cação 1, caracterizado pelo fato de que para controlar peste.

25 15. Uso do composto como definido na reivindicação 1, caracte-
rizado pelo fato de que é para fabricar um pesticida para controlar pestes.

16. Método para controlar pestes, caracterizado pelo fato de que compreende aplicar quantidade eficaz do composto ou um sal deste como definido na reivindicação 1, às pestes diretamente ou ao habitat de pestes.

- 5 17. Composto, caracterizado pelo fato de que é representado pela fórmula (III)



- em que, R^{1-5} representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alcóxi inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alcanoilóxi inferior alquila inferior, um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcóxicarbonila inferior, um grupo aril alquiloxicarbonila inferior, um grupo N,N-di(inferior alquil)carbamoila, um grupo alcanoila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, grupo formila, um grupo alquilsulfonila inferior opcionalmente substituído com um ou mais of átomo de halogênio, um grupo aril sulfonila, um grupo ariloxicarbonila, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior alquil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(\text{CH}_2)_l\text{-A}$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4, e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcóxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros

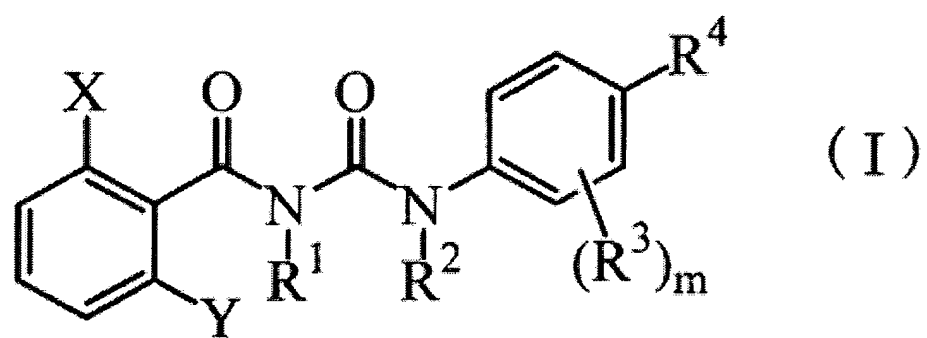
opcionalmente substituído com um átomo de halogênio,

R^2 representa um grupo alquila inferior,

R^3 representa um átomo de halogênio, ou um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,

- 5 R^4 representa um grupo representado por $S(O)_nR^5$ em que R^5 representa um grupo alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, ou um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de
- 10 halogênio, e
- n representa um número inteiro de 0 a 2, e
- m representa um número inteiro de 0 a 4,

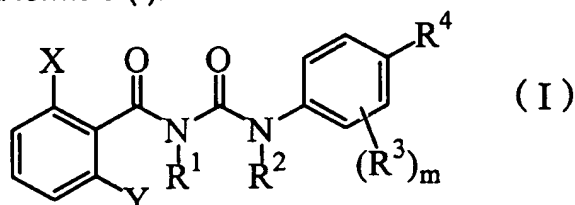
18. Composto de acordo com a reivindicação 17, caracterizado pelo fato de que R^{1-5} representa um grupo alquila inferior opcionalmente
- 15 substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquenila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo alquinila inferior, um grupo aril alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais grupos alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um
- 20 grupo arilóxi alquila inferior opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo N,N-di(inferior alquil)amino alquila inferior, um grupo alquiltio inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfinila inferior alquila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior alquila inferior, um grupo cicloalquila inferior, um grupo cicloalquila inferior alquila inferior, um grupo di(inferior al-
- 25 quil)amino, um grupo alcóxi inferior, um grupo heterocíclico saturado de 6 membros, ou um grupo representado por $-(CH_2)_l-A$ em que l representa um número inteiro de 1 a 4, e A representa um grupo di(inferior alcóxi)metila, um grupo alcoxicarbonila inferior, ou um grupo heterocíclico de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um átomo de halogênio.



RESUMO

Patente de Invenção: "COMPOSTOS DE BENZOILUREIA, PROCESSO PARA A PRODUÇÃO E USO DOS MESMOS E MÉTODO PARA CONTROLAR PESTES".

- 5 A presente invenção refere-se a um composto de benzoilureia representado pela fórmula (I):



- em que, X e Y representa um átomo de flúor ou um átomo de cloro, R¹ representa um grupo alquila inferior ou similar, R² representa um grupo alquila inferior, R³ representa um átomo de halogênio ou similar, R⁴ representa um grupo alquiltio opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, ou um sal destes, e uso deste para controlar pestes e similares.
- 10