



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

**(11) PI 1015315-2 B1**



**(22) Data do Depósito: 20/04/2010**

**(45) Data de Concessão: 04/02/2020**

**(54) Título:** COMPOSTO HETEROCÍCLICO FUNDIDO, SEU USO, COMPOSIÇÃO E MÉTODO DE CONTROLAR UM ARTRÓPODE NOCIVO

**(51) Int.Cl.:** A01N 43/52; A01N 43/90; C07D 401/04; C07D 471/04; A01P 7/00.

**(52) CPC:** A01N 43/52; A01N 43/90; C07D 401/04; C07D 471/04.

**(30) Prioridade Unionista:** 28/04/2009 JP 2009-108926.

**(73) Titular(es):** SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED.

**(72) Inventor(es):** MASAKI TAKAHASHI; MITSUHIKO IWAKOSHI; HIROSHI Ikegami.

**(86) Pedido PCT:** PCT JP2010057315 de 20/04/2010

**(87) Publicação PCT:** WO 2010/125985 de 04/11/2010

**(85) Data do Início da Fase Nacional:** 26/10/2011

**(57) Resumo:** "COMPOSTO HETEROCÍCLICO FUNDIDO, SEU USO, COMPOSIÇÃO E MÉTODO DE CONTROLAR UM ARTRÓPODE NOCIVO A presente invenção refere-se a um composto heterocíclico fundido de fórmula (1): em que, A1 e A2 representam um átomo de nitrogênio ou similares, R1, R2, R3 e R4 representam um átomo de halogênio ou similares, R2 e R3 representam um átomo de halogênio ou similares, R5 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, ou similares, R6 e R7 representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, ou similares, e n representa 0 ou 1, e tem um excelente efeito de controle de artrópode nocivo.

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para  
**"COMPOSTO HETEROCÍCLICO FUNDIDO, SEU USO,  
 COMPOSIÇÃO E MÉTODO DE CONTROLAR UM ARTRÓPODE  
 NOCIVO "**.

Campo técnico

[001] A presente invenção refere-se a um composto heterocíclico fundido e seu uso para controle de artrópodes nocivos

Antecedentes da Técnica

[002] Foram investigados vários compostos com a finalidade de controle de pestes, e posto em uso prático.

[003] Alguns tipos de compostos de benzimidazol substituídos são conhecidos em Farmaco, Edizione Scientifica (1987), 42(7), 475-90; Heterocycles (1977), 6(7), 911-27 e Chemical & Pharmaceutical Bulletin (1982), 30(8), 2996.

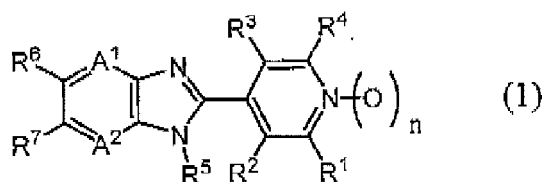
Descrição da Invenção

[004] A presente invenção é para fornecer um composto que tem um excelente efeito de controle sobre artrópodes nocivos.

[005] Os presentes inventores estudaram intensivamente para resolver o problema acima descrito e por conseguinte constataram que um composto heterocíclico fundido da seguinte fórmula (1) tem um excelente efeito de controle sobre artrópodes nocivos, levando a conclusão da presente invenção.

[006] Isto é, a presente invenção fornece o seguinte.

[1] Um composto heterocíclico fundido de fórmula (1):



[007] em que, A1 e A2 são os mesmos ou diferentes e representam um átomo de nitrogênio ou =CH-,

[008] m representa 0, 1 ou 2,

[009] R1, R2, R3 e R4 são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo benzila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, -OR8, -NR8R9, -NR8C(O)R9, -S(O)mR8, -SO2Cl, -SO2NR8R9, -CO2R10, -CONR8R9, -CONR10NR11R12, um grupo ciano, um grupo nitro, um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio,

[0010] R5 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciclopropila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciclopropilmetila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, -OR13, -NR13R14 ou um grupo ciano,

[0011] R6 e R7 são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, -OR15, -S(O)mR15, um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio (aqui, R6 ou R7 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, -OR15, -S(O)mR15), alternativamente R6 e R7 podem ser ligados para formar um anel de 5 membros ou anel de 6 membros substituído com um ou mais átomos de halogênio juntamente com átomos de carbono aos quais R6 e R7 estão

conectados,

[0012] R8 e R9 são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo benzila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, ou um átomo de hidrogênio (relativo a -S(O)<sub>m</sub>R8, m representa o mesmo significado como descrito acima, porém quando m representa 1 ou 2, R8 não representa um átomo de hidrogênio),

[0013] R10 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, ou um átomo de hidrogênio,

[0014] R11 e R12 são os mesmos ou diferentes e representam um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C5 alcoxicarbonila ou um átomo de hidrogênio,

[0015] R13 e R14 são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C3 opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciclopropila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, ou um átomo de hidrogênio,

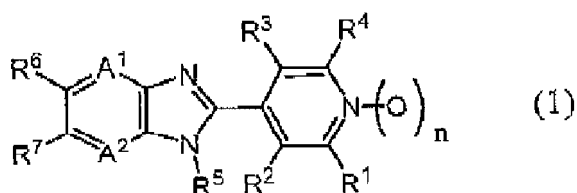
[0016] R15 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa 0 ou 1.

[0017] Grupo X: um grupo que consiste em um grupo C1-C4 alcóxi

opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, -CO<sub>2</sub>R<sub>16</sub> (aqui, R<sub>16</sub> representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído por um halogênio), um grupo ciano e um átomo de halogênio.

[0018] Grupo Y: um grupo que consiste em um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C1-C4 alcóxi opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro e um átomo de halogênio (em seguida, chamado presente composto ativo).

[1-2] Um composto heterocíclico fundido de fórmula (1):



[0019] em que,

[0020] A1 e A2 são os mesmos ou diferentes e representam um átomo de nitrogênio ou =CH-,

[0021] m representa 0, 1 ou 2,

[0022] R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> e R<sub>4</sub> são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo benzila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, -OR<sub>8</sub>, -NR<sub>8</sub>R<sub>9</sub>, -NR<sub>8</sub>C(O)R<sub>9</sub>, -S(O)<sub>m</sub>R<sub>8</sub>, -CO<sub>2</sub>R<sub>10</sub>, -CONR<sub>8</sub>R<sub>9</sub>, -CONR<sub>10</sub>NR<sub>11</sub>R<sub>12</sub>,

um grupo ciano, um grupo nitro, um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio,

[0023] R5 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciclopropila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciclopropilmetila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, -OR13, -NR13R14 ou um grupo ciano,

[0024] R6 e R7 são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, -OR15, -S(O)mR15, um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio (aqui, R6 ou R7 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, -OR15, -S(O)mR15), alternativamente R6 e R7 podem ser ligados para formar um anel de 5 membros ou anel de 6 membros substituído com um ou mais átomos de halogênio juntamente com átomos de carbono aos quais R6 e R7 estão conectados,

[0025] R8 e R9 são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo benzila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, ou um átomo de hidrogênio (relativo a -S(O)mR8, m representa o mesmo significado como descrito acima, porém quando

m representar 1 ou 2, R8 não representa um átomo de hidrogênio),

[0026] R10 representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, ou um átomo de hidrogênio,

[0027] R11 e R12 são os mesmos ou diferentes e representam um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C5 alcoxicarbonila ou um átomo de hidrogênio,

[0028] R13 e R14 são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C3 opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciclopropila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, ou um átomo de hidrogênio,

[0029] R15 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, e n representa 0 ou 1.

[0030] Grupo X: um grupo que consiste em um grupo C1-C4 alcóxi opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, -CO<sub>2</sub>R<sub>16</sub> (aqui, R<sub>16</sub> representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído por um halogênio), um grupo ciano e um átomo de halogênio.

[0031] Grupo Y: um grupo que consiste em um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C1-C4 alcóxi opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro e um átomo de halogênio .

[2] O composto heterocíclico fundido de acordo com [1] ou [1-2], em que R<sup>6</sup> e R<sup>7</sup> são os mesmos ou diferentes e são um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, -OR<sup>15</sup>, -S(O)<sub>m</sub>R<sup>15</sup>, um átomo de halogênio ou um

átomo de hidrogênio (aqui,  $R^6$  ou  $R^7$  representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio,  $-OR^{15}$ ,  $-S(O)_mR^{15}$ ).

[3] O composto heterocíclico fundido de acordo com [1], [2] ou [1-2], em que  $R^6$  é um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio.

[4] O composto heterocíclico fundido de acordo com qualquer um dentre [1] a [3] ou [1-2], em que  $R^5$  é um grupo metila, grupo etila, grupo ciclopropila ou grupo ciclopropilmetila.

[5] O composto heterocíclico fundido de acordo com qualquer um dentre [1] a [4] ou [1-2], em que  $R^1$  e  $R^4$  são átomos de hidrogênio.

[6] O composto heterocíclico fundido de acordo com qualquer um dentre [1] a [5] ou [1-2], em que  $R^2$  é um átomo de hidrogênio ou um átomo de halogênio.

[6-2] O composto heterocíclico fundido de acordo com qualquer um dentre [1] a [6], em que  $A^1$  é  $=CH-$  e  $A^2$  é um átomo de nitrogênio.

[6-3] O composto heterocíclico fundido de acordo com qualquer um dentre [1] a [6], [1-2] ou [6-2], em que  $n$  é 0.

[7] O composto heterocíclico fundido de acordo com qualquer um dentre [1] a [6], [1-2], [6-2] ou [6-3], em que  $R^3$  é um grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo benzila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, ou um grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y.

[8] O composto heterocíclico fundido de acordo com qualquer um dentre [1] a [6], [1-2], [6-2] ou [6-3], em que  $R^3$  é um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^9$ ,  $-NR^8C(O)R^9$ ,  $-S(O)_mR^8$ ,  $-CO_2R^{10}$ ,  $-CONR^8R^9$ ,  $-CONR^{10}NR^{11}R^{12}$ , um grupo ciano, um grupo nitro, um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio, e  $R^8$  e  $R^9$  são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, ou um átomo de hidrogênio (aqui,  $R^8$  não é um átomo de hidrogênio quando m em  $-S(O)_mR^8$  representa 1 ou 2).

[9] O composto heterocíclico fundido de acordo com qualquer um dentre [1] a [6], [1-2], [6-2] ou [6-3], em que  $R^3$  um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^9$ ,  $-S(O)_mR^8$ , um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio, e  $R^8$  e  $R^9$  são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, ou um átomo de hidrogênio (aqui,  $R^8$  um átomo de hidrogênio não é quando m em  $-S(O)_mR^8$  representa 1 ou 2).

[9-2] O composto heterocíclico fundido de acordo com qualquer um dentre [1] a [6], [1-2], [6-2] ou [6-3], em que  $R^3$  é  $-OR^8$  e  $R^8$  é um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C3 opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio.

[9-3] O composto heterocíclico fundido de acordo com qualquer um dentre [1] a [6], [1-2], [6-2] ou [6-3], em que  $R^3$  é  $-S(O)_mR^8$  e  $R^8$  é um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C3 contanto que  $R^8$  não seja um átomo de hidrogênio quando m representar 1 ou 2.

[10] Uma composição de controle de artrópode nocivo que

compreende o composto heterocíclico fundido como descrito em qualquer um dentre [1] a [9], [1-2], [6-2], [6-3], [9-2] ou [9-3], e um veículo inerte.

[11] Um método de controlar um artrópode nocivo que compreende aplicar uma quantidade eficaz do composto heterocíclico fundido como descrito em qualquer um dentre [1] a [9], [1-2], [6-2], [6-3], [9-2] ou [9-3] a um artrópode nocivo ou a um habitat de um artrópode nocivo (em seguida, chamado composição da presente invenção).

[12] Uso do composto heterocíclico fundido como descrito em qualquer um dentre [1] a [9], [1-2], [6-2], [6-3], [9-2] ou [9-3] para controlar um artrópode nocivo.

#### Modo de Realizar a Invenção

[0032] Os substituintes usados nas descrições da presente especificação serão explicados com exemplos listados abaixo. Na presente invenção, "átomo de halogênio" significa um átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo e átomo de iodo.

[0033] Na presente especificação, a descrição de uma parte "C2-C5" do "grupo C2-C5 alcóxicarbonila", ou similares, significa que o número de átomos de carbono que constituem o grupo alcóxicarbonila total está na faixa de 2 a 5.

[0034] Exemplos de "grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X" representado por R1, R2, R3 ou R4 incluem um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, tais como, um grupo metila, grupo etila, grupo propila, grupo isopropila, grupo butila, grupo isobutila, grupo sec-butila, grupo terc-butila, grupo pentila, grupo hexila, grupo metoximetila, grupo etoximetila, grupo propoximetila, grupo isopropoximetila, grupo 2-metoxietila, grupo 2-etoxietila, grupo

2-propoxietila, grupo 2-isopropoxietila, grupo metoxicarbeonilmetila, grupo etoxicarbonilmetila, grupo 2-metoxicarbeoniletila, grupo 2-etoxicarboniletila, grupo cianometila, grupo dicianometila, grupo 1-cianoetila, grupo 1,1-dicianoetila, grupo 2-cianoetila, grupo trifluorometila, grupo 2,2,2-trifluoroetila e grupo pentafluoroetila; um grupo C2-C6 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, tais como, um grupo vinila, grupo 1-propenila, grupo 2-propenila, grupo 1-metilvinila, grupo 2-metil-1-propenila, grupo 1-butenila, grupo 2-butenila, grupo 3-butenila, grupo 1-pentenila, grupo 1-hexenila, grupo 1,1-difluoroalila e grupo pentafluoroalila; e um grupo C2-C6 alquinila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, tais como, um grupo etinila, grupo propargila, grupo 2-butinila, grupo 3-butinila, grupo 1-pentinila, grupo 1-hexinila e grupo 4, 4, 4-trifluoro-2-butinila.

[0035] Exemplos de "grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X" representado por R1, R2, R3 ou R4 incluem um grupo ciclopropila, grupo ciclobutila, grupo ciclopentila e grupo ciclohexila.

[0036] Exemplos de "grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y" representado por R1, R2, R3 ou R4 incluem um grupo fenila, grupo 2-clorofenila, grupo 3-clorofenila, grupo 4-clorofenila, grupo 2-metilfenila, grupo 3-metilfenila, grupo 4-metilfenila, grupo 2-metoxifenoíla, grupo 3-metoxifenoíla, grupo 4-metoxifenoíla, grupo 2-(trifluorometil)fenila, grupo 3-(trifluorometil)fenila, grupo 4-(trifluorometil) fenila, grupo 2-nitrofenila, grupo 3-nitrofenila, grupo 4-nitrofenila, grupo 2-cianofenila, grupo 3-cianofenila e grupo 4-cianofenila.

[0037] Exemplos de "grupo benzila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y" representado

por R1, R2, R3, R4, R8 ou R9 incluem um grupo benzila, grupo 2-clorobenzila, grupo 3-clorobenzila, grupo 4-clorobenzila, grupo 2-metilbenzila, grupo 3-metilbenzila, grupo 4-metilbenzila, grupo 2-metoxibenzila, grupo 3-metoxibenzila e grupo 4-metoxibenzila.

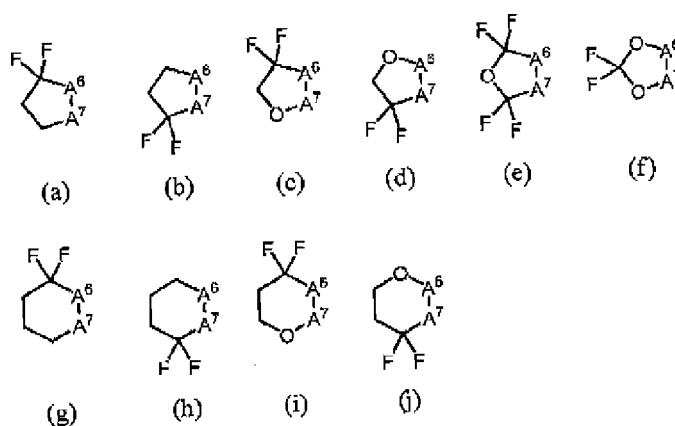
[0038] "Grupo heterocíclico" em "grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y" representado por R1, R2, R3 ou R4, significa um grupo residual de um composto heterocíclico, e exemplos de "grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y", incluem um grupo heterocíclico de 5 membros saturado tais como, um grupo pirrolidin-1-ila e grupo tetra-hidrofuran-2-ila; um grupo heterocíclico de 6 membros saturado tais como, um grupo piperidila, grupo morfolila, grupo tiomorfolila e grupo 4-metilpiperazin-1-ila; um grupo heterocíclico de 5 membros aromático tais como, um grupo pirazol-1-ila, grupo 3-cloropirazol-1-ila, grupo 3-bromopirazol-1-ila, grupo 3-nitropirazol-1-ila, grupo 3-metilpirazol-1-ila, grupo 3-(trifluorometil)pirazol-1-ila, grupo 4-metilpirazol-1-ila, grupo 4-cloropirazol-1-ila, grupo 4-bromopirazol-1-ila, grupo 4-cianopirazol-1-ila, grupo grupo imidazol-1-ila, grupo 4-(trifluorometilimidazol)-1-ila, grupo pirrol-1-ila, grupo 1,2,4-triazol-1-ila, grupo 3-cloro-1,2, 4-triazol-1-ila, grupo 1,2,3,4-tetrazol-1-ila, grupo 1,2,3,5-tetrazol-1-ila, grupo 2-tienila e grupo 3-tienila; e um grupo heterocíclico de 6 membros aromático tais como, um grupo 2-piridila, grupo 3-piridila e grupo 4-piridila.

[0039] Exemplos de "grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio", representados por R5, incluem um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio tais como, um grupo

metila, grupo etila, grupo propila, grupo isopropila, grupo butila, grupo isobutila, grupo sec-butila, grupo terc-butila, grupo trifluorometila, grupo 2,2,2-trifluoroetila e grupo pentafluoroetila; um grupo C2-C4 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio tais como, um grupo vinila, grupo alila e grupo 3,3-difluoroalila; e um grupo C2-C4 alquinila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio tais como, um grupo propargila e grupo 4, 4, 4-trifluoro-2-butila.

[0040] Exemplos de "grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio", representados por R6 ou R7, incluem um grupo fluorometila, grupo difluorometila, grupo trifluorometila, grupo 2,2,2-trifluoroetila, grupo pentafluoroetila, grupo heptafluoropropila, grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoroisopropila, grupo heptafluoroisopropila, grupo nonafluorobutila, grupo nonafluoroisobutila, grupo nonafluoro-sec-butila e grupo nonafluoro-terc-butila.

[0041] Exemplos de "anel de 5 membros ou anel de 6 membros substituído com um ou mais "átomos de halogênio" obtido por ligação de R6 e R7, juntamente com átomos de carbono ao quais R6 e R7 são conectados, incluem anéis das seguintes fórmulas (a) a (j) (aqui, A6 representa um átomo de carbono ao qual R6 está conectado, e A7 representa um átomo de carbono ao qual R7 está conectado).



[0042] Exemplos de "grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6

opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X" representado por R8 ou R9 incluem um grupo C1-C6 alquila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, tais como, um grupo metila, grupo etila, grupo propila, grupo isopropila, grupo butila, grupo isobutila, grupo sec-butila, grupo terc-butila, grupo 1-metilbutila, grupo 2-metilbutila, grupo 3-metilbutila, grupo 1-etilpropila, grupo 1,2-dimetilpropila, grupo 2,2-dimetilpropila, grupo pentila, 1,2-dimetilbutila, grupo 2,2-dimetilbutila, grupo 1-metilpentila, grupo 2-metilpentila, grupo 3-metilpentila, grupo 4-metilpentila, grupo hexila, grupo fluorometila, grupo difluorometila, grupo trifluorometila, grupo 2-fluoroetila, grupo 2,2-difluoroetila, grupo 2,2,2-trifluoroetila, grupo pentafluoroetila e grupo 1-metil-2,2,2-trifluoroetila; um grupo grupo C3-C6 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, tais como, um grupo grupo 2-propenila, grupo 3,3-dicloro-2-propenila, grupo 3,3-difluoro-2-propenila, grupo 1-metil-2-propenila, grupo 2-metil-2-propenila, grupo 2-butenila, grupo 3-butenila, grupo 1-metil-2-butenila, grupo e grupo 1-metil-3-butenila; e um grupo C3-C6 alquinila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, tais como, um grupo propargila, grupo 1-metil-2-propinila, grupo 2-butinila, grupo 3-butinila, grupo 1-metil-2-butinila grupo e grupo 1-metil-3-butinila.

[0043] Exemplos de "grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X" representado por R8 ou R9 incluem um grupo ciclopropila, grupo ciclobutila, grupo ciclopentila, grupo ciclo-hexila e grupo 2-ciclo-hexenila.

[0044] Exemplos de "grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y" representado por R8 e R9 incluem um grupo 2-clorofenila, grupo 3-clorofenila, grupo

4-clorofenila, grupo 2-metilfenila, grupo 3-metilfenila, grupo 4-metilfenila, grupo 2-metoxifenoíla, grupo 3-metoxifenoíla, grupo 4-metoxifenoíla, grupo 2-(trifluorometil) fenila, grupo 3-(trifluorometil)fenila, grupo 4-(trifluorometil)fenila, grupo 2-cianofenila, grupo 3-cianofenila, grupo 4-cianofenila, grupo 2-nitrofenila, grupo 3-nitrofenila e grupo 4-nitrofenila.

[0045] Exemplos de "grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y" representado por R8 ou R9, incluem um grupo heterocíclico de 5 membros aromático tais como, um grupo 2-tienila e grupo 3-tienila; e um grupo heterocíclico aromático de 6 membros tais como, um grupo 2-piridila, grupo 3-piridila, grupo 4-piridila, grupo 2-pirimidinila e grupo 4-pirimidinila.

[0046] Exemplos de "grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio", representados por R10, incluem um grupo metila, grupo etila, grupo propila, grupo isopropila, grupo butila, grupo isobutila, grupo sec-butila e grupo terc-butila, grupo trifluorometila e grupo pentafluoroetila.

[0047] Exemplos de grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio", representados por R11 ou R12, incluem um grupo metila, grupo etila, grupo propila, grupo isopropila, grupo butila, grupo isobutila, grupo sec-butila, grupo terc-butila, grupo trifluorometila, grupo 2,2,2-trifluoroetila e grupo pentafluoroetila.

[0048] Exemplos de "grupo C2-C5 alcoxicarbonila" representado por R11 ou R12, incluem um grupo metoxicarbonila, grupo etoxicarbonila, grupo propoxicarbonila, grupo isopropoxicarbonila, grupo butoxicarbonila, grupo isobutoxicarbonila, grupo sec-butoxiarbonila e grupo terc-butoxicarbonila.

[0049] Exemplos de "grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C3

opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio" representados por R13 ou R14, incluem um grupo C1-C3 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, tais como, um grupo metila, grupo etila, grupo propila, grupo isopropila, grupo fluorometila, grupo difluorometila, grupo trifluorometila, grupo 2,2,2-trifluoroetila e grupo pentafluoroetila; um grupo C2-C3 alquenila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, tais como, um grupo vinila, grupo 2-propenila, grupo 3,3-difluoro-2-propenila e grupo 3,3-dicloro-2-propenila; e um grupo C2-C3 alquinila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio tais como, um grupo etinila e grupo propargila.

[0050] Exemplos de "grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio" representados por R15 incluem um grupo C1-C4 alquila substituído com um ou mais átomos de halogênio tais como, um grupo fluorometila, grupo difluorometila, grupo trifluorometila, grupo 2,2,2-trifluoroetila, grupo pentafluoroetila, grupo heptafluoropropila, grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoroisopropila, grupo heptafluoroisopropila, grupo nonafluorobutila, grupo nonafluoroisobutila, grupo nonafluoro-sec-butila e grupo nonafluoro-terc-butila; um grupo C2-C4 alquenila substituído com um ou mais átomos de halogênio tais como, um grupo 3,3-difluoroalila e grupo pentafluoroalila; e um grupo C2-C4 alquinila substituído com um ou mais átomos de halogênio tais como, um grupo 4,4,4-trifluoro-2-butinila.

[0051] Exemplos de "grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio", representados por R16 incluem um grupo metila, grupo etila, grupo propila, grupo isopropila, grupo butila, grupo isobutila, grupo sec-butila, grupo terc-butila, grupo trifluorometila, grupo 2,2,2-trifluoroetila e grupo pentafluoroetila, e similares.

- [0052] Exemplos do presente composto ativo incluem o seguinte.
- [0053] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R1 e R4 representam átomos de hidrogênio;
- [0054] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R2 representa um átomo de hidrogênio ou átomo de halogênio;
- [0055] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R3 representa um grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo benzila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y ou um grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y;
- [0056] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R3 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, -OR8, -NR8R9, -NR8C(O)R9, -S(O)mR8, -CO2R10, -CONR8R9, -CONR10NR11R12, um grupo ciano, um grupo nitro, um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio, e R8 e R9 são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, ou um átomo de hidrogênio (aqui, quando m em -S(O)mR8 representa 1 ou 2, R8 não representa um átomo de hidrogênio);
- [0057] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R3 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, -OR8, -NR8R9, -S(O)mR8, um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio e R8 e R9 são os mesmos ou diferentes e

representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, ou um átomo de hidrogênio (aqui, quando m em -S(O)mR8 representa 1 ou 2, R8 não representa um átomo de hidrogênio);

[0058] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 e R7 são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, -OR15, -S(O)mR15, um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio (aqui, R6 ou R7 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, -OR15, -S(O)mR15), e R15 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio;

[0059] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio ou -OR15, e R15 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio;

[0060] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R7 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio ou -OR15, e R15 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio;

[0061] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio;

[0062] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 representa um grupo fluorometila;

[0063] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 representa um grupo difluorometila;

[0064] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>6</sup> representa um grupo trifluorometila;

[0065] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>6</sup> representa -OR<sup>15</sup> e R<sup>15</sup> representa um grupo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila substituído com um ou mais átomos de halogênio;

[0066] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>7</sup> representa -OR<sup>15</sup> e R<sup>15</sup> representa um grupo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila substituído com um ou mais átomos de halogênio;

[0067] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>6</sup> representa -OR<sup>15</sup> e R<sup>15</sup> representa um grupo fluorometila, grupo difluorometila ou grupo trifluorometila;

[0068] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>6</sup> representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> substituído com um ou mais átomos de halogênio e R<sup>7</sup> representa um átomo de hidrogênio ou átomo de halogênio;

[0069] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>6</sup> representa -OR<sup>15</sup>, R<sup>15</sup> representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> substituído com um ou mais átomos de halogênio e R<sup>7</sup> representa um átomo de hidrogênio ou átomo de halogênio;

[0070] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>6</sup> representa um átomo de hidrogênio ou átomo de halogênio e R<sup>7</sup> representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> substituído com um ou mais átomos de halogênio;

[0071] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>6</sup> representa um átomo de hidrogênio ou átomo de halogênio, R<sup>7</sup> representa -OR<sup>15</sup> e R<sup>15</sup> representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> substituído com um ou mais átomos de halogênio;

[0072] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>6</sup> representa um grupo fluorometila, grupo difluorometila ou grupo trifluorometila e R<sup>7</sup> representa um átomo de hidrogênio ou átomo de

halogênio;

[0073] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 representa um grupo fluorometila, grupo difluorometila ou grupo trifluorometila e R7 representa um átomo de hidrogênio;

[0074] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 representa um -OR15, R15 representa um grupo fluorometila, grupo difluorometila ou grupo trifluorometila e R7 representa um átomo de hidrogênio ou átomo de halogênio;

[0075] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 representa -OR15, R15 representa um grupo fluorometila, grupo difluorometila ou grupo trifluorometila e R7 representa um átomo de hidrogênio;

[0076] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 representa um átomo de hidrogênio ou átomo de halogênio e R7 representa um grupo fluorometila, grupo difluorometila ou grupo trifluorometila;

[0077] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 representa um átomo de hidrogênio e R7 representa um grupo fluorometila, grupo difluorometila ou grupo trifluorometila;

[0078] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 representa um átomo de hidrogênio ou átomo de halogênio, R7 representa -OR15 e R15 representa um grupo fluorometila, grupo difluorometila ou grupo trifluorometila;

[0079] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R6 representa um átomo de hidrogênio, R7 representa -OR15 e R15 representa um grupo fluorometila, grupo difluorometila ou grupo trifluorometila;

[0080] O presente composto ativo de fórmula (1), em que A1 representa um átomo de nitrogênio e A2 representa =CH-;

[0081] O presente composto ativo de fórmula (1), em que A1

representa =CH- e A2 representa um átomo de nitrogênio;

[0082] O presente composto ativo de fórmula (1), em que A1 e A2 representam =CH-;

[0083] O presente composto ativo de fórmula (1), em que n representa 0;

[0084] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R3 representa -OR8 e R8 representa um grupo C1-C3 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio;

[0085] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R3 representa -OR8 e R8 representa um grupo metila, grupo etila, grupo propila, grupo isopropila, grupo fluorometila, grupo difluorometila, grupo trifluorometila, grupo 2-fluoroetila, grupo 2,2-difluoroetila, grupo 2,2,2-trifluoroetila ou grupo pentafluoroetila;

[0086] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R3 representa -OR8 e R8 representa um grupo metila, grupo etila, grupo propila, grupo isopropila, grupo 2-fluoroetila, grupo 2,2-difluoroetila ou grupo 2,2,2-trifluoroetila;

[0087] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R1, R2 e R4 representam um átomo de hidrogênio, R3 representa -OR8 e R8 representa um grupo C1-C3 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio;

[0088] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R1, R2 e R4 representam átomos de hidrogênio, R3 representa -OR8 e R8 representa um grupo metila, grupo etila, grupo propila, grupo isopropila, grupo fluorometila, grupo difluorometila, grupo trifluorometila, grupo 2-fluoroetila, grupo 2,2-difluoroetila, grupo 2,2,2-trifluoroetila ou grupo pentafluoroetila;

[0089] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R1, R2 e R4 representam átomos de hidrogênio, R3 representa -OR8 e R8 representa um grupo metila, grupo etila, grupo propila, grupo

isopropila, grupo 2-fluoroetila, grupo 2,2-difluoroetila ou grupo 2,2,2-trifluoroetila;

[0090] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>3</sup> representa -S(O)mR<sup>8</sup> e R<sup>8</sup> representa um grupo C1-C3 alquila;

[0091] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>3</sup> representa -S(O)mR<sup>8</sup> e R<sup>8</sup> representa um grupo metila ou grupo etila;

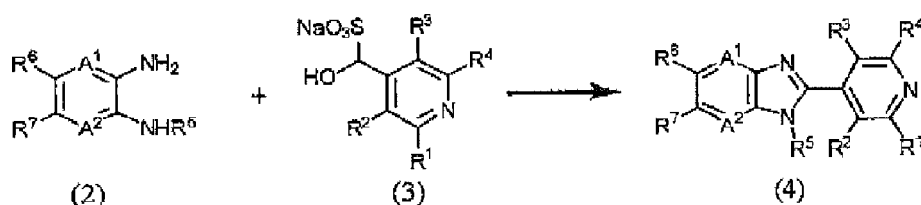
[0092] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> e R<sup>4</sup> representam átomos de hidrogênio, R<sup>3</sup> representa -S(O)mR<sup>8</sup> e R<sup>8</sup> representa um grupo C1-C3 alquila;

[0093] O presente composto ativo de fórmula (1), em que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> e R<sup>4</sup> representam átomos de hidrogênio, R<sup>3</sup> representa -S(O)mR<sup>8</sup> e R<sup>8</sup> representa um grupo metila ou grupo etila.

[0094] A seguir, o método de produzir o presente composto ativo será descrito.

[0095] O presente composto ativo pode ser produzido, por exemplo, pelo seguinte (Método de Produção 1) a (Método de Produção 12) e (Método de Produção 21) a (Método de Produção 36).  
(Método de Produção 1)

[0096] Entre os presentes compostos ativos, um composto (4), em que n é 0, pode ser produzido reagindo-se um composto (2) e um composto (3) na presença de uma base.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[0097] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[0098] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem

éteres tais como, tetra-hidrofurano (em seguida, chamado THF em alguns casos), dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano, e similares, hidrocarboneto alifático tais como, hexano, heptano, octano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como, clorobenzeno, e similares, ésteres tais como, acetato de etila, acetato de butila, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tal como, N,N-dimetilformamida (em seguida, chamado DMF em alguns casos), e similares, sulfóxidos tal como, sulfóxido de dimetila (em seguida, chamado DMSO em alguns casos), e similares, compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como, piridina, quinolina, e similares, e misturas dos mesmos.

[0099] O (3) é normalmente usado em uma proporção de 1 para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (2).

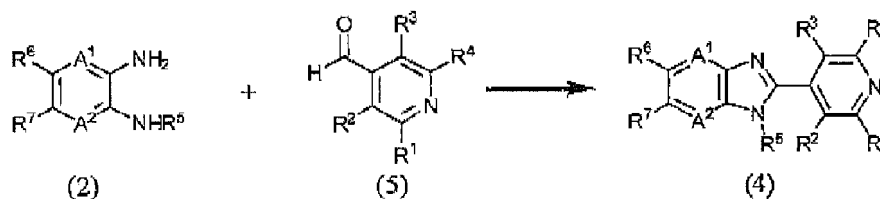
[00100] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 30 a 200°C, e o tempo de reação dos mesmos está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00101] Depois da conclusão da reação, o composto (4) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento, tal como, água a ser vertida na mistura reacional, a mistura a ser extraída com um solvente orgânico, em seguida a camada orgânica a ser seca e concentrada.

[00102] O composto isolado (4) também pode ser purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 2)

[00103] Entre os presentes compostos ativos, um composto (4), em que n é 0 pode ser produzido reagindo-se um composto (2) e um composto (5).



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00104] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00105] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano, e similares, hidrocarboneto alifático tais como, hexano, heptano, octano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, hidrocarboneto halogenado tais como, clorobenzeno, e similares, ésteres tais como, acetato de etila, acetato de butila, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, sulfóxido de dimetila, e similares, compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como, piridina, quinolina, e similares, e misturas dos mesmos.

[00106] A reação também pode ser realizada com adição de uma base se necessário.

[00107] A base a ser usada na reação inclui hidrogenocarbonato tais como, hidrogenocarbonato de sódio, hidrogenocarbonato de potássio, e similares, carbonato tais como, carbonato de sódio, carbonato de potássio, e similares, sulfitos tais como, sulfito de sódio, sulfito de potássio, e similares, sulfatos de hidrogênio tais como, sulfato de hidrogênio de sódio, sulfato de hidrogênio de potássio, e similares, e misturas dos mesmos.

[00108] O composto (5) é normalmente usado em uma proporção de 1 para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (2). No caso de adição de uma base, a base é normalmente usada em uma proporção

de 1 para 5 mols com respeito a 1 mol do composto (2).

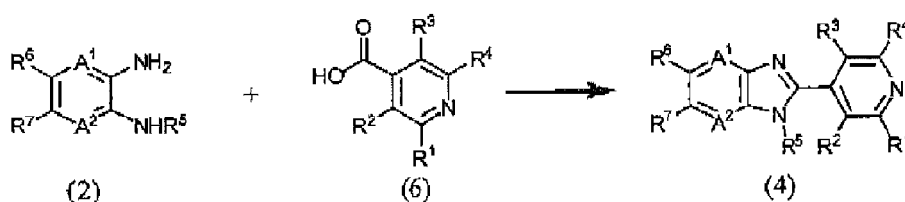
[00109] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 30 a 200°C, e o tempo de reação dos mesmos está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00110] Depois da conclusão da reação, o composto (4) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento, tal como, água a ser vertida na mistura reacional, a mistura a ser extraída com um solvente orgânico, em seguida a camada orgânica a ser seca e concentrada.

[00111] O composto isolado (4) também pode ser purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 3)

[00112] Entre os compostos, um composto (4), em que n é 0 pode ser produzido reagindo-se um composto (2) e um composto (6) na presença de um agente de desidrocondensação.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00113] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00114] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano, e similares, hidrocarboneto alifático tais como, hexano, heptano, octano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, hidrocarboneto halogenado tais como, clorobenzeno, e similares, ésteres tais como, acetato de etila, acetato de butila, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais

como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como, piridina, quinolina, e similares, e misturas dos mesmos.

[00115] O agente de desidrocondensação a ser usado na reação inclui carbodi-imidas tais como, cloridrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodi-imida (em seguida, chamado WSC em alguns casos), 1,3-diciclo-hexilcarbodi-imida, e similares. A reação pode ser realizada na presença de 1-hidroxibenzotriazol.

[00116] Quando o composto (6) é normalmente usado em uma proporção de 1 para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (2), o agente de desidrocondensação é normalmente usado em uma proporção de 1 para 5 mols, 1-hidroxibenzotriazol é normalmente usado em uma proporção de 0,01 para 0,1 mol.

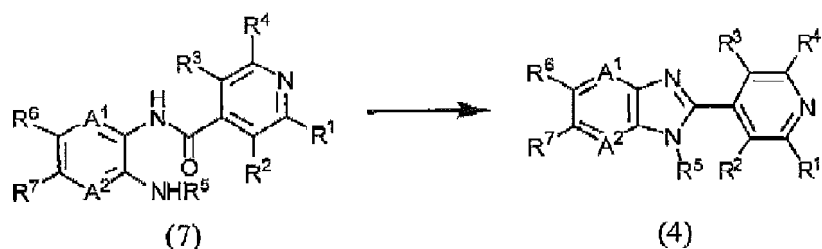
[00117] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 30 a 200°C, e o tempo de reação dos mesmos está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00118] Depois da conclusão da reação, o composto (4) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento, tal como, água a ser vertida na mistura reacional, a mistura a ser extraída com um solvente orgânico, em seguida a camada orgânica a ser seca e concentrada.

[00119] O composto isolado (4) também pode ser purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 4)

[00120] Entre os compostos, um composto (4), em que n é 0 pode ser produzido reagindo-se um composto (7) na presença de um agente de desidratação.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00121] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente, e também pode ser permissível usar um agente de desidratação em quantidade solvente.

[00122] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano, e similares, hidrocarboneto alifático tais como, hexano, heptano, octano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, hidrocarboneto halogenado tais como, clorobenzeno, e similares, ésteres tais como, acetato de etila, acetato de butila, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, e misturas dos mesmos.

[00123] O agente de desidratação a ser usado na reação inclui ácidos sulfônicos tais como, ácido p-toluenossulfônico, e similares, oxiclreto de fósforo, anidrido acético, anidrido trifluoroacético, e similares.

[00124] O agente de desidratação é normalmente usado em uma proporção de 0,1 para quantidade em excesso com respeito a 1 mol do composto (7).

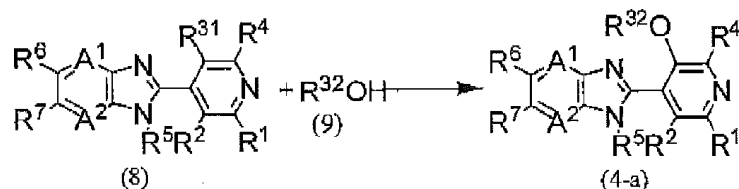
[00125] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 30 a 200°C, e o tempo de reação dos mesmos está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00126] Depois da conclusão da reação, o composto (4) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento, tal como, a

mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4) também pode ser purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

(Método de Produção 5)

[00127] Entre os compostos (4), um composto (4-a) pode ser produzido reagindo-se um composto (8) e um composto (9) na presença de uma base.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima,

[00128] R<sup>31</sup> representa um átomo de cloro ou um átomo de flúor, e

[00129] R<sup>32</sup> representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo benzila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y.]

[00130] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente, e também pode ser permissível usar o composto (9) em quantidade solvente.

[00131] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais

como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, e misturas dos mesmos.

[00132] Exemplos da base a ser usada na reação incluem hidretos de metal de álcali tais como, hidreto de sódio, e similares.

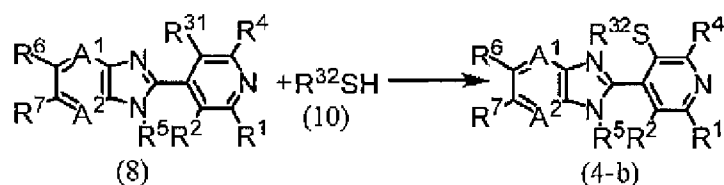
[00133] O composto (9) é normalmente usado em uma proporção de 1 para quantidade em excesso, e a base normalmente é usada em uma proporção de 1 para 10 mols com respeito a 1 mol do composto (8).

[00134] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 150°C, e o tempo de reação dos mesmos está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00135] Depois da conclusão da reação, o composto (4-a) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento, tal como, a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-a) também pode ser purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 6)

[00136] Entre os compostos (4), um composto (4-b) pode ser produzido reagindo-se um composto (8) e um composto (10) na presença de uma base.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>31</sup>, R<sup>32</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00137] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00138] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e

similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, e misturas dos mesmos.

[00139] Exemplos da base a ser usada na reação incluem hidretos de metal de álcali tais como, hidreto de sódio, e similares.

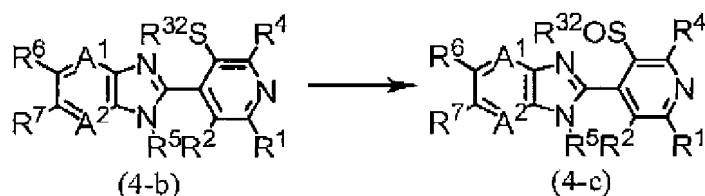
[00140] O composto (10) é normalmente usado em uma proporção de 1 para 10 mol, e a base normalmente é usada em uma proporção de 1 para 10 mols com respeito a 1 mol do composto (8).

[00141] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 150°C, e o tempo de reação dos mesmos está normalmente na faixa de 0,5 a 24 horas.

[00142] Depois da conclusão da reação, o composto (4-b) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento, tal como, a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-b) também pode ser purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 7)

[00143] Entre os compostos (4), um composto (4-c) pode ser produzido reagindo-se o composto (4-b) na presença de um agente de oxidação.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>32</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00144] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00145] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem hidrocarboneto halogenado alifático tais como, diclorometano, clorofórmio, e similares, alcoóis tais como, metanol, etanol, e similares,

ácido acético, água e misturas dos mesmos.

[00146] Exemplos do agente de oxidação a ser usado na reação incluem periodato de sódio.

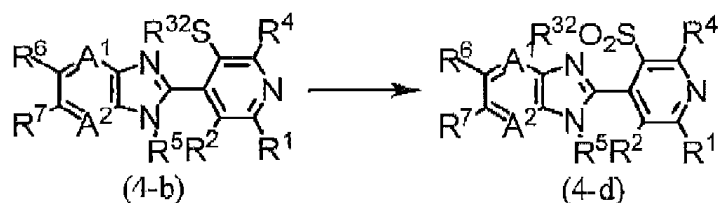
[00147] O agente de oxidação é normalmente usado em uma proporção de 1 para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (4-b).

[00148] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de -20 a 80°C, e o tempo de reação da mesma está normalmente na faixa de 0,1 a 12 horas.

[00149] Depois da conclusão da reação, o composto (4-c) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento, tal como, a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser lavada com uma solução aquosa de um agente de redução (por exemplo, sulfito de sódio, tiosulfato de sódio) e uma solução aquosa de uma base (por exemplo, hidrogenocarbonato de sódio) se necessário, em seguida a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-c) também pode ser purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 8)

[00150] Entre os compostos (4), um composto (4-d) pode ser produzido reagindo-se o composto (4-b) na presença de um agente de oxidação.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>32</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00151] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00152] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem

hidrocarbonetos halogenados alifáticos tais como, diclorometano, clorofórmio, e similares, ácido acético, água e misturas dos mesmos.

[00153] Exemplos do agente de oxidação a ser usado na reação incluem peróxidos de ácido carboxílico tais como ácido 3-cloroperbenzoico e similares.

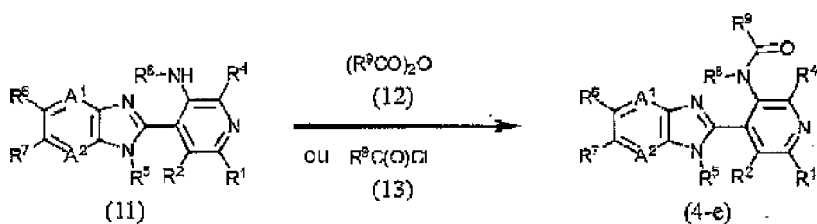
[00154] O agente de oxidação é normalmente usado em uma proporção de 2 a 4 mols com respeito a 1 mol do composto (4-b).

[00155] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de -20 a 30°C, e o tempo de reação da mesma está normalmente na faixa de 0,1 a 12 horas.

[00156] Depois da conclusão da reação, o composto (4-d) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser lavada com uma solução aquosa de um agente de redução (por exemplo, sulfito de sódio, tiosulfato de sódio) e uma solução aquosa de uma base (por exemplo, hidrogenocarbonato de sódio) se necessário, em seguida a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-d) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 9)

[00157] Entre os compostos (4), um composto (4-e) pode ser produzido reagindo-se um composto (11) com um anidrido ácido representado por (12) ou um cloreto ácido representado por (13).



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00158] A reação é normalmente realizada na presença de um

solvente, e também pode ser permissível usar o composto (12) em quantidade de solvente.

[00159] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como, piridina, quinolina, e similares, e misturas dos mesmos. A reação também pode ser realizada com a adição de uma base se necessário.

[00160] Exemplos da base a ser usada na reação incluem hidretos de metal de álcali tais como, hidreto de sódio, e similares, carbonato tais como, carbonato de potássio, e similares, aminas terciárias tais como, trietilamina, di-isopropiletilamina, e similares, e compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como, piridina, 4-dimetilaminopiridina e similares.

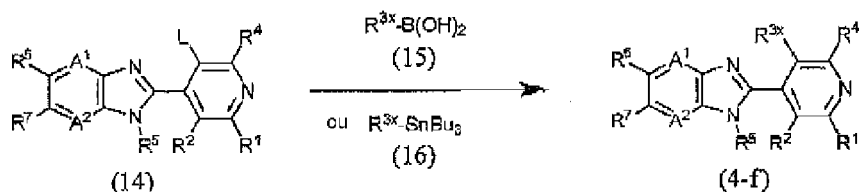
[00161] O composto (12) ou o composto (13) é normalmente usado em uma proporção de 1 para 10 mols, e a base é normalmente usada em uma proporção de 1 para 10 mols com respeito a 1 mol do composto (11).

[00162] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 120°C, e o tempo de reação da mesma está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00163] Depois da conclusão da reação, o composto (4-e) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-e) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

(Método de Produção 10)

[00164] Entre os compostos (4), um composto (4-f) pode ser produzido reagindo-se um composto (14) com um composto de ácido borônico representado por (15) ou um composto de estanho representado por (16) na presença de um composto de paládio.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima,

[00165] L representa um átomo de bromo ou iodo,

[00166] R<sup>3x</sup> representa um grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo heterocíclico de 5 membros aromático ou um grupo heterocíclico aromático de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y (aqui, limitado a grupos heterocíclicos aromáticos que ligam-se a um anel de piridina em seu átomo de carbono).]

[00167] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00168] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano, e similares, alcoóis tais como, metanol, etanol, e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como, hexano, heptano, octano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, e similares, água e misturas dos mesmos, e similares.

[00169] Os compostos de paládio a ser usados na reação incluem acetato de paládio, tetracistrifenilfosfinapaládio, complexo de {1,1'-bis (difenilfosfino) ferrocene}dicloropaládio cloreto de metileno, e dicloreto

de bis (trifenilfosfina) paládio, e similares.

[00170] O composto (15) ou o composto (16) é normalmente usado em uma proporção de 0,5 a 5 mols, e o composto de paládio é normalmente usado em uma proporção de 0,001 para 0,1 mol com respeito a 1 mol do composto (14).

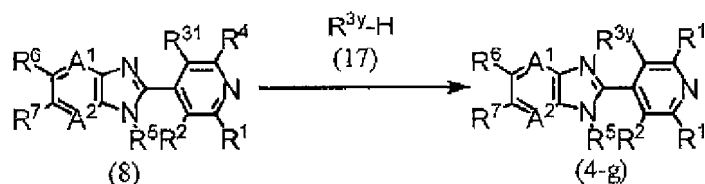
[00171] A reação também pode ser realizada na presença de uma base (sais inorgânicos tais como, acetato de sódio, acetato de potássio, carbonato de potássio, fosfato de tripotássio, hidrogenocarbonato de sódio, e similares são mencionados) e/ou um catalisador de transferência de fase (sais de amônio quaternário tais como, brometo de tetrabutil amônio, brometo de benzil trietil amônio, e similares são mencionados), se necessário.

[00172] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 50 a 120°C, e o tempo de reação da mesma está normalmente na faixa de 0,5 a 24 horas.

[00173] Depois da conclusão da reação, o composto (4-f) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-f) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 11)

[00174] Entre os compostos (4), um composto (4-g) pode ser produzido reagindo-se um composto (8) e um composto (17) na presença de uma base.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>31</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima,

[00175] R3y representa um grupo heterocíclico de 5 membros ou um grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y (aqui, limitado a grupos heterocíclicos que ligam-se a um anel de piridina em seu átomo de nitrogênio).]

[00176] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00177] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, e misturas dos mesmos. Exemplos da base a ser usada na reação incluem hidretos de metal de álcali tais como, hidreto de sódio, e similares, carbonato tais como, carbonato de potássio, e similares.

[00178] O composto (17) é normalmente usado em uma proporção de 1 para 10 mols, e a base é normalmente usada na faixa de 1 a 10 mols com respeito a 1 mol do composto (8).

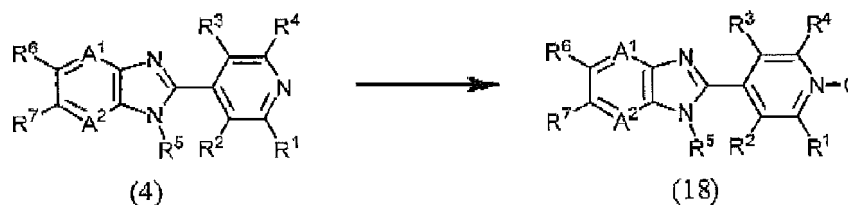
[00179] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 100°C, e o tempo de reação da mesma está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00180] Depois da conclusão da reação, o composto (4-g) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-g) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 12)

[00181] Entre os compostos, um composto (18) em que n é 1 pode ser produzido reagindo-se um composto (4) na presença de um agente

de oxidação.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00182] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00183] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem hidrocarbonetos halogenados alifáticos tais como, diclorometano, clorofórmio, e similares, ácido acético, água e misturas dos mesmos.

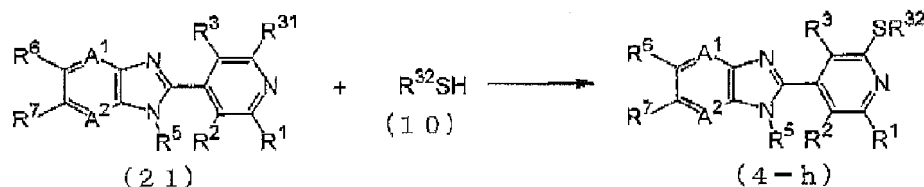
[00184] Exemplos do agente de oxidação a ser usado na reação incluem peróxidos de ácido carboxílico tais como ácido 3-cloroperbenzoico, e similares, e peróxido de hidrogênio, água e similares. O agente de oxidação é normalmente usado em uma proporção de 1 para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (4).

[00185] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 40 a 100°C, e o tempo de reação da mesma está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas. Depois da conclusão da reação, o composto (18) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tais como, a mistura reacional que é com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser lavada com uma solução aquosa de um agente de redução (por exemplo, sulfito de sódio, tiosulfato de sódio) e uma solução aquosa de uma base (por exemplo, hidrogenocarbonato de sódio) se necessário, em seguida a ser seca e concentrada. O composto isolado (18) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 21)

[00186] Entre os compostos (4), o composto (4-h) pode ser

produzido reagindo-se um composto (21) e um composto (10) na presença de uma base.



[em que,  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ ,  $\text{R}^3$ ,  $\text{R}^5$ ,  $\text{R}^6$ ,  $\text{R}^7$ ,  $\text{R}^{31}$ ,  $\text{R}^{32}$ ,  $\text{A}^1$  e  $\text{A}^2$  representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00187] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00188] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, e misturas dos mesmos.

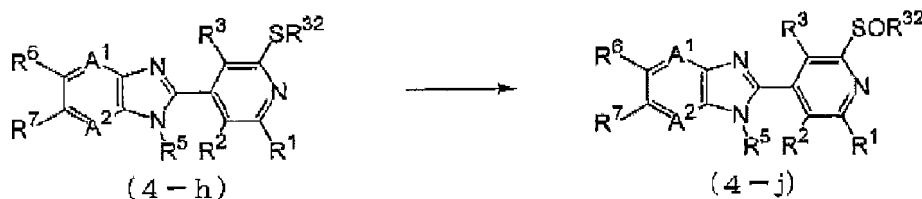
[00189] Exemplos da base a ser usada na reação incluem hidretos de metal de álcali tais como, hidreto de sódio, e similares, etc.

[00190] O composto (10) é normalmente usado em uma proporção de 1 para 10 mol, e a base é normalmente usada em uma proporção de 1 para 10 mols com respeito a 1 mol do composto (21). A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 100°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00191] Depois da conclusão da reação, o composto (4-h) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-h) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

(Método de Produção 22)

[00192] Entre os compostos (4), o composto (4-j) pode ser produzido reagindo-se o composto (4-h) e agente de oxidação.



[em que,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{32}$ ,  $A^1$  e  $A^2$  representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00193] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00194] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem hidrocarbonetos halogenados alifáticos tais como, diclorometano, clorofórmio, e similares, alcoóis tais como, metanol, etanol, e similares, éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano, e similares; ácido acético, água, e misturas dos mesmos.

[00195] Exemplos do agente de oxidação a ser usado na reação incluem periodato de sódio.

[00196] O agente de oxidação é normalmente usado em uma proporção de 1 para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (4-h).

[00197] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de  $-20$  a  $80^\circ\text{C}$ , e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 12 horas.

[00198] Depois da conclusão da reação, o composto (4-j) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tais como a mistura reacional que é com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser lavada com uma solução aquosa de um agente de redução (por exemplo, sulfito de sódio, tiosulfato de sódio) e uma solução aquosa de uma base (por exemplo, hidrogenocarbonato de sódio) se necessário, em seguida a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-j) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização e similares.

(Método de Produção 23)

[00199] Entre os compostos (4), o composto (4-k) pode ser produzido reagindo-se o composto (4-h) e o agente de oxidação.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>32</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00200] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00201] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem hidrocarbonetos halogenados alifáticos tais como, diclorometano, clorofórmio, e similares; ácido acético, água, e misturas dos mesmos.

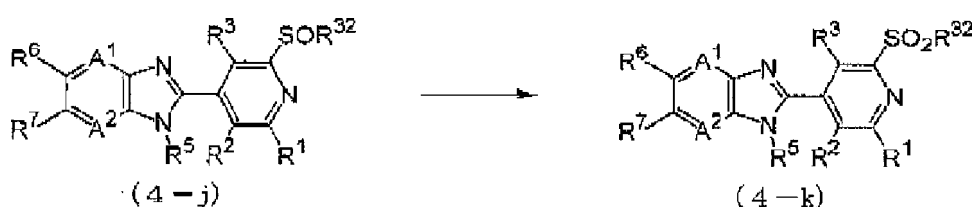
[00202] Exemplos do agente de oxidação a ser usado na reação incluem peróxidos de ácido carboxílico tais como ácido 3-cloroperbenzoico, e similares.

[00203] O agente de oxidação é normalmente usado em uma proporção de 2 a 4 mols com respeito a 1 mol do composto (4-h).

[00204] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de -20 a 30°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 12 horas. Depois da conclusão da reação, o composto (4-k) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tais como, a mistura reacional que é com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser lavada com uma solução aquosa de um agente de redução (por exemplo, sulfito de sódio, tiosulfato de sódio) e uma solução aquosa de uma base (por exemplo, hidrogenocarbonato de sódio) se necessário, em seguida a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-k) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

(Método de Produção 24)

[00205] Entre os compostos (4), o composto (4-k) pode ser produzido, por exemplo, reagindo-se o composto (4-j) e o agente de oxidação.



[em que,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{32}$ ,  $A^1$  e  $A^2$  representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00206] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00207] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem hidrocarbonetos halogenados alifáticos tais como, diclorometano, clorofórmio, e similares; ácido acético, água, e misturas dos mesmos.

[00208] Exemplos do agente de oxidação a ser usado na reação incluem peróxidos de ácido carboxílico tais como ácido 3-cloroperbenzoico, e similares.

[00209] O agente de oxidação é normalmente usado em uma proporção de 1 para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (4-j).

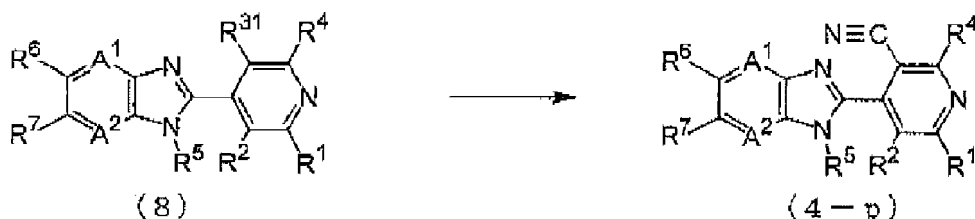
[00210] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de  $-20$  a  $30^\circ\text{C}$ , e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 12 horas.

[00211] Depois da conclusão da reação, o composto (4-k) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tais como, a mistura reacional que é com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser lavada com uma solução aquosa de um agente de redução (por exemplo, sulfito de sódio, tiosulfato de sódio) e uma solução aquosa de uma base (por exemplo, hidrogenocarbonato de sódio) se necessário, em seguida a ser seca e concentrada. O composto isolado

(4-k) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

(Método de Produção 25)

[00212] Entre os compostos (4), o composto (4-p) pode ser produzido reagindo-se o composto (8) e um cianeto.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>31</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00213] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00214] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, 1-metil-2-pirrolidinona, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, e misturas dos mesmos.

[00215] Exemplos do cianeto a ser usado na reação incluem cianeto de sódio e cianeto de potássio.

[00216] A reação é realizada, se necessário, na presença de éteres de coroa tais como, 15-coroa-5, 18-coroa-6, e similares.

[00217] O cianeto é normalmente usado em uma proporção de 1 para 3 mols, e o catalisador é normalmente usado em uma proporção de 0,01 para 0,5 mol com respeito a 1 mol do composto (8).

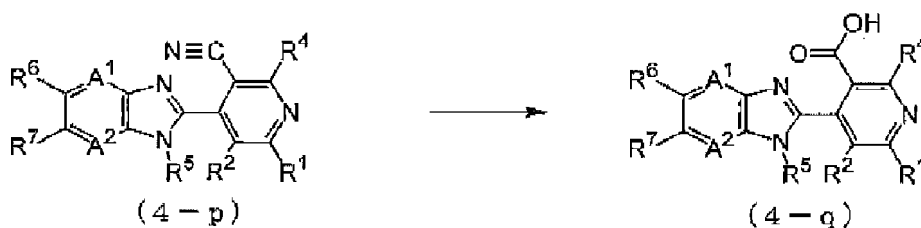
[00218] A temperatura de reação da reação normalmente está na faixa de 0 a 200°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 12 horas.

[00219] Depois da conclusão da reação, o composto (4-p) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura

reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-p) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

(Método de Produção 26)

[00220] Entre os compostos (4), o composto (4-q) pode ser produzido submetendo-se o composto (4-p) a uma reação de hidrólise na presença de uma base.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00221] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00222] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem alcoóis tais como, metanol, etanol, e similares; água, e misturas dos mesmos.

[00223] Exemplos da base a ser usada na reação incluem hidróxidos de metais de álcali ou metais alcalinoterrosos tais como, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de bário, e similares. A base normalmente é usada em uma proporção de 1 para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (4-p).

[00224] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 150°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00225] Depois da conclusão da reação, o composto (4-q) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como neutralizado com um ácido da mistura reacional, a ser filtrado para

obter um sólido ou neutralizado com um ácido da mistura reacional, a ser extraído da mistura com um solvente orgânico, em seguida a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-q) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

(Método de Produção 27)

[00226] Entre os compostos (4), o composto (4-r) pode ser produzido reagindo-se o composto (4-p) com peróxido de hidrogênio na presença de uma base.



[em que,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $A^1$  e  $A^2$  representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00227] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00228] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem sulfóxidos tais como, DMSO, e similares; água, e misturas dos mesmos.

[00229] Exemplos da base a ser usada na reação incluem hidróxidos de metais de álcali ou metais alcalinoterrosos tais como, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio, e similares, e carbonato tais como, carbonato de sódio, carbonato de potássio, e similares.

[00230] Peróxido de hidrogênio é normalmente usado em uma proporção de 1 para 5 mol, e a base é normalmente usada em uma proporção de 1 para 5 mols com respeito a 1 mol do composto (4-p).

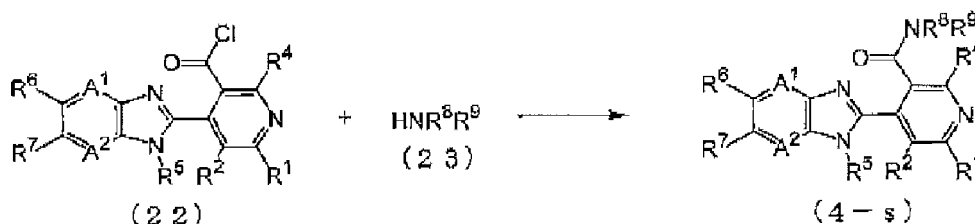
[00231] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 100°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de

0,1 a 24 horas.

[00232] Depois da conclusão da reação, o composto (4-r) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-r) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

(Método de Produção 28)

[00233] Entre os compostos (4), o composto (4-s) pode ser produzido reagindo-se um composto (22) e um composto (23).



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00234] A reação é normalmente realizada na presença de uma base, e normalmente realizada na presença de um solvente.

[00235] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como, piridina, quinolina, e similares; água, e misturas dos mesmos. Exemplos da base a ser usada na reação incluem carbonato tais como, carbonato de potássio, e similares, aminas terciárias tais como, trietilamina, diisopropiletilamina, e similares, e compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como, piridina, 4-dimetilaminopiridina, e similares.

[00236] O composto (23) é normalmente usado em uma proporção

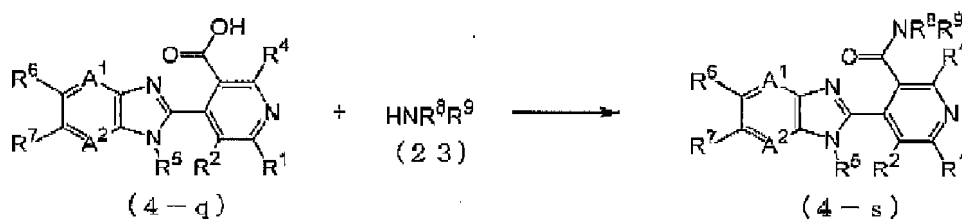
de 1 mol à quantidade em excesso, e a base normalmente é usada em uma proporção de 1 mol à quantidade em excesso com respeito a 1 mol do composto (22). No caso de uso excessivo do composto (23), a reação também pode ser realizada sem usar a base acima descrita. Quando amina terciária tais como, trietilamina, di-isopropiletilamina, e similares ou líquido que contém nitrogênio-compósitos aromáticos tais como, piridina, e similares é usado em quantidade de excesso como a base, a reação também pode ser realizada sem usar o solvente acima descrito.

[00237] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 100°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00238] Depois da conclusão da reação, o composto (4-s) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-s) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 29)

[00239] Entre os compostos (4), o composto (4-s) pode ser produzido reagindo-se o composto (4-q), um composto (23) e agente de condensação.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00240] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00241] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano, e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como, hexano, heptano, octano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como, clorobenzeno, e similares, ésteres tais como, acetato de etila, acetato de butila, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como, piridina, quinolina, e similares, e misturas dos mesmos.

[00242] O agente de condensação a ser usado na reação inclui carbodi-imidas tais como, WSC, 1,3-diciclo-hexilcarbodi-imida, e similares.

[00243] A reação é realizada, se necessário, na presença de 1-hidroxibenzotriazol.

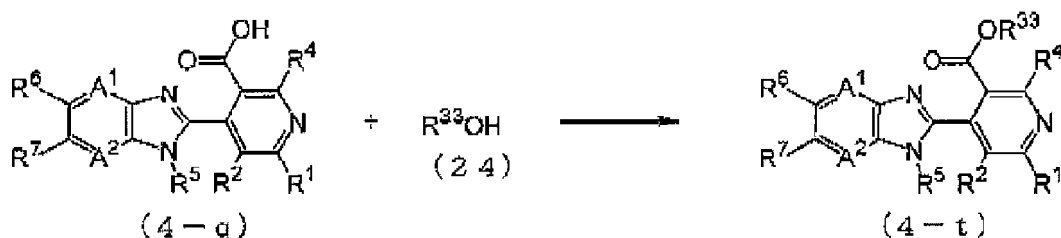
[00244] O composto (23) é normalmente usado em uma proporção de 1 para 3 mols, o agente de condensação é normalmente usado em uma proporção de 1 para 5 mols e 1-hidroxibenzotriazol é normalmente usado em uma proporção de 0,01 para 0,1 mol com respeito a 1 mol do composto (4-q).

[00245] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 100°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00246] Depois da conclusão da reação, o composto (4-q) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-s) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

(Método de Produção 30)

[00247] Entre os compostos (4), o composto (4-t) pode ser produzido reagindo-se o composto (4-q) e um composto (24) na presença de um ácido.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima, e R<sup>33</sup> representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio.]

[00248] A reação é realizada na presença de um solvente ou na ausência de um solvente.

[00249] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, 1,4-dioxano, e similares, hidrocarbonetos alifáticos tais como, hexano, heptano, octano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, hidrocarbonetos halogenados tais como, clorobenzeno, e similares, e misturas dos mesmos.

[00250] Exemplos do ácido a ser usado na reação incluem ácidos minerais tais como, ácido clorídrico, ácido sulfúrico e similares, e ácidos orgânicos tais como, ácido p-toluenossulfônico, e similares.

[00251] O composto (24) é normalmente usado em uma proporção de 1 mol à quantidade em excesso, e o ácido é normalmente usado em uma proporção de 0,01 mol para 1 mol com respeito a 1 mol do composto (4-q).

[00252] No caso do uso excessivo do composto (24), a reação também pode ser realizada sem usar o solvente acima descrito.

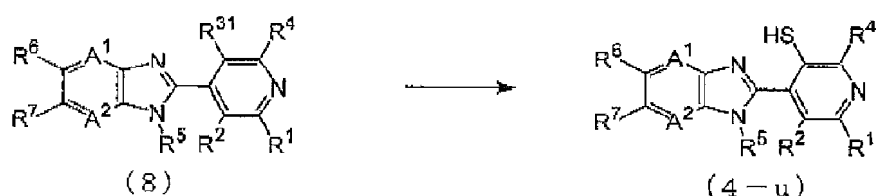
[00253] A temperatura de reação da reação está normalmente na

faixa de 0 a 200°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00254] Depois da conclusão da reação, o composto (4-t) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-t) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

(Método de Produção 31)

[00255] Entre os compostos (4), o composto (4-u) pode ser produzido reagindo-se um composto (8) com agente de sulfurização tais como, hidrossulfeto de sódio, e similares.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>31</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00256] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente. Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como, piridina, quinolina, e similares; água, e misturas dos mesmos.

[00257] O agente de sulfurização tais como, hidrossulfeto de sódio, e similares é normalmente usado em uma proporção de 1 mol para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (8).

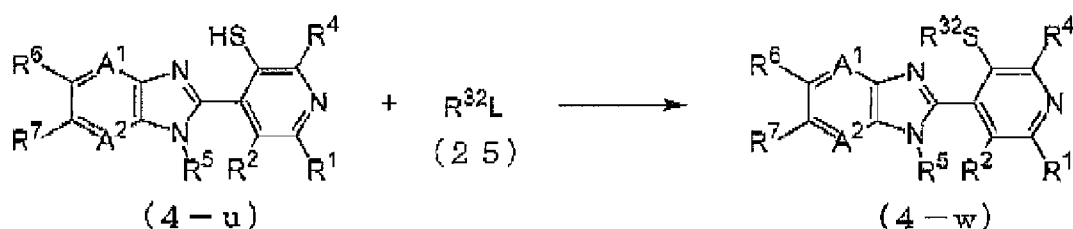
[00258] A temperatura de reação da reação está normalmente na

faixa de 0 a 150°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00259] Depois da conclusão da reação, o composto (4-u) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tais como neutralizadas com um ácido da mistura reacional, a ser filtrados para obter um sólido ou neutralizados com um ácido da mistura reacional, a ser extraídos com um solvente orgânico, em seguida a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-u) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

(Método de Produção 32)

[00260] Entre os compostos (4), o composto (4-w) pode ser produzido reagindo-se o composto (4-u) e um composto (25) na presença de uma base.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>32</sup>, A<sup>1</sup>, A<sup>2</sup> e L representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00261] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00262] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, nitrilas tais como, acetonitrila, e similares, amidas ácidas tais como, DMF, e similares, sulfóxidos tais como, DMSO, e similares, e misturas dos mesmos.

[00263] Exemplos da base a ser usada na reação incluem hidretos de metais de álcali ou metais alcalinoterrosos tais como, hidreto de

sódio, hidreto de potássio, hidreto de cálcio e similares, bases inorgânicas tais como, carbonato de sódio, carbonato de potássio e similares, ou bases orgânicas tais como, trietilamina, e similares.

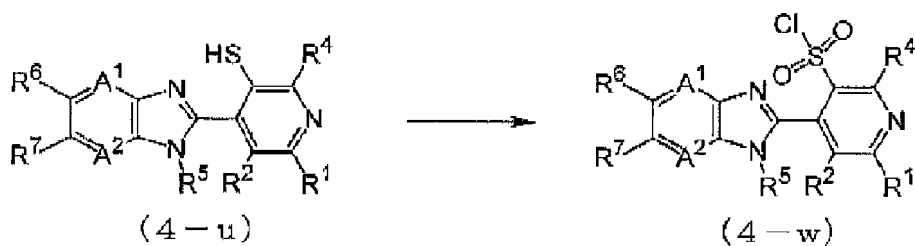
[00264] A base normalmente é usada em uma proporção de 1 para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (4-u).

[00265] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 100°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00266] Depois da conclusão da reação, o composto (4-w) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-w) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 33)

[00267] Entre os compostos (4), o composto (4-w) pode ser produzido reagindo-se o composto (4-u) com agente de oxidação tais como, nitrato de potássio, e similares e agente de cloração tais como, cloreto de trimetilsilila, e similares.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00268] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente. Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem hidrocarbonetos halogenados tais como, cloreto de metileno, clorofórmio, e similares, haletos aromáticos tais como, clorobenzeno e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e

similares, e misturas dos mesmos.

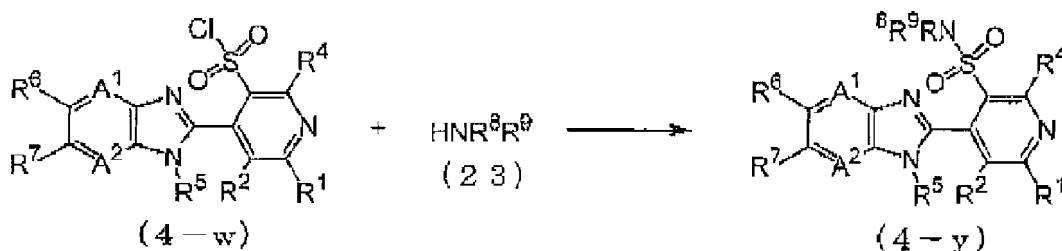
[00269] O agente de oxidação tais como, nitrato de potássio, e similares é normalmente usado em uma proporção de 1 para 5 mols, e o agente de cloração tais como, cloreto de trimetilsilila, e similares é normalmente usado em uma proporção de 1 para 5 mols com respeito a 1 mol do composto (4-u).

[00270] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 150°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00271] Depois da conclusão da reação, o composto (4-w) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-w) pode da mesma forma ser também purificado por recristalização, e similares. 15

(Método de Produção 34)

[00272] Entre os compostos (4), o composto (4-i) pode ser produzido reagindo-se o composto (4-w) e um composto (23).



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00273] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente, e normalmente realizada na presença de uma base.

[00274] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, dimetil éter de etileno glicol, 1,4-dioxano e similares, hidrocarbonetos aromáticos tais como, tolueno, xileno, e similares, e misturas dos mesmos.

[00275] Exemplos da base a ser usada na reação incluem bases inorgânicas tais como, carbonato de sódio, carbonato de potássio e similares ou bases orgânicas tais como, trietilamina, diisopropiletilamina, e similares, compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como, piridina, quinolina, e similares.

[00276] O composto (23) é normalmente usado em uma proporção de 1 mol à quantidade em excesso, e a base normalmente é usada em uma proporção de 1 mol à quantidade em excesso com respeito a 1 mol do composto (4-w).

[00277] No caso de uso excessivo do composto (23), a reação também pode ser realizada sem usar a base acima descrita.

[00278] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 100°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00279] Depois da conclusão da reação, o composto (4-i) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tal como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-i) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 35)

[00280] Entre os compostos (4), o composto (4-z) pode ser produzido reagindo-se o composto (26) e hidrogênio na presença de um catalisador de metal de transição.



[00281] A reação é normalmente realizada sob uma atmosfera de hidrogênio e na presença de um solvente.

[00282] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem hidrocarbonetos alifáticos tais como, hexano, heptano, octano, e similares, alcoóis tais como, metanol, etanol, e similares, ésteres tais como, acetato de etila, acetato de butila, e similares, e misturas dos mesmos.

[00283] Exemplos do catalisador de metal de transição a ser usado na reação incluem catalisadores de paládio tais como, carvão de paládio, e similares.

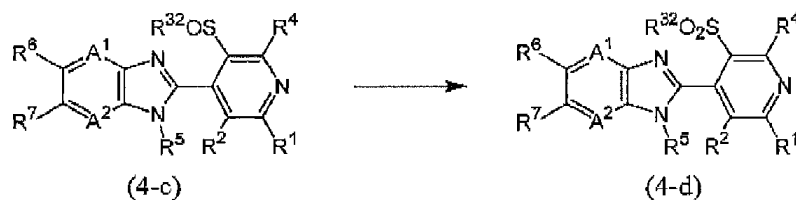
[00284] O catalisador de metal de transição é normalmente usado em uma proporção de 0,01 mol para 0,1 mol com respeito a 1 mol do composto (26).

[00285] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de 0 a 100°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00286] Depois da conclusão da reação, o composto (4-z) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tais como, a mistura reacional a ser filtrada para remover o catalisador de metal de transição, o filtrado a ser extraído com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-z) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Método de Produção 36)

[00287] Entre os compostos (4), o composto (4-d) pode ser produzido reagindo-se o composto (4-c) e o agente de oxidação.



[em que, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>32</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

[00288] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente.

[00289] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem hidrocarbonetos halogenados alifáticos tais como, diclorometano, clorofórmio, e similares; ácido acético, água, e misturas dos mesmos.

[00290] Exemplos do agente de oxidação a ser usado na reação incluem peróxidos de ácido carboxílico tais como ácido 3-cloroperbenzoico, e similares.

[00291] O agente de oxidação é normalmente usado em uma proporção de 1 para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (4-c).

[00292] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de -20 a 30°C, e o tempo de reação está normalmente na faixa de 0,1 a 12 horas.

[00293] Depois da conclusão da reação, o composto (4-d) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tais como a mistura reacional a ser extraída com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser lavada com uma solução aquosa de um agente de redução (por exemplo, sulfito de sódio, tiosulfato de sódio) e uma solução aquosa de uma base (por exemplo, hidrogenocarbonato de sódio) se necessário, em seguida a ser seca e concentrada. O composto isolado (4-d) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

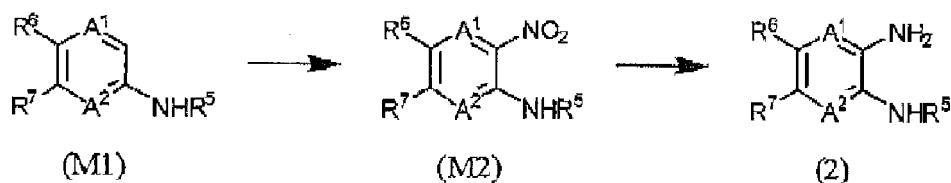
[00294] Alguns intermediários usados para produção do presente composto ativo estão comercialmente disponíveis, descritos em literaturas conhecidas, e similares, ou podem ser produzidos por métodos conhecidos por aqueles versados na técnica.

[00295] O intermediário de acordo com a presente invenção pode ser produzido, por exemplo, pelo método seguinte.

(Método de Produção de Intermediário 1)

[00296] Um composto (2) pode ser produzido por um método

mostrado no seguinte esquema.



[em que, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, A<sup>1</sup> e A<sup>2</sup> representam o mesmo significado como descrito acima.]

#### (Processo M1-1)

[00297] Um composto (M2) pode ser produzido reagindo-se um composto (M1) na presença de um agente de nitração.

[00298] A reação é normalmente realizada na presença de um solvente. Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem hidrocarbonetos halogenados alifáticos tais como, clorofórmio, e similares, ácido acético, ácido sulfúrico concentrado, ácido nítrico concentrado, água e misturas dos mesmos.

[00299] Exemplos do agente de nitração a ser usado na reação incluem ácido nítrico concentrado, e similares. O agente de nitração é normalmente usado em uma proporção de 1 para 3 mols com respeito a 1 mol do composto (M1). A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de -10 a 100°C, e o tempo de reação da mesma está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00300] Depois da conclusão da reação, o composto (M2) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tais como, a mistura reacional a ser vertida em água, a mistura a ser extraída com um solvente orgânico, em seguida a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (M2) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

#### (Processo M1-2)

[00301] Um composto (2) pode ser produzido reagindo-se o composto (M2) e hidrogênio na presença de um catalisador de

hidrogenação.

[00302] A reação é normalmente realizada sob uma atmosfera de hidrogênio de 1 a 100 atm, normalmente na presença de um solvente.

[00303] Exemplos do solvente a ser usado na reação incluem éteres tais como, THF, 1,4-dioxano, e similares, ésteres tais como, acetato de etila, acetato de butila, e similares, alcoóis tais como, metanol, etanol, e similares, água e misturas dos mesmos.

[00304] Exemplos do catalisador de hidrogenação a ser usado na reação incluem compostos de metal de transição tais como, carvão de paládio, hidróxido de paládio, níquel de raney, óxido de platina, e similares.

[00305] Hidrogênio é normalmente usado em uma proporção de 3 mols, e o catalisador de hidrogenação é normalmente usado em uma proporção de 0,001 a 0,5 mol com respeito a 1 mol do composto (M1).

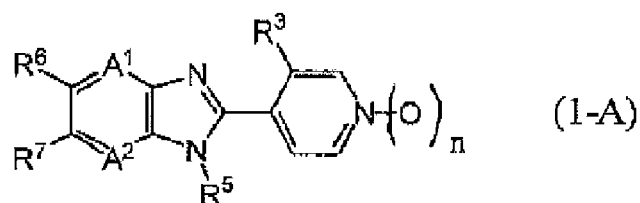
[00306] A reação também pode ser realizada com a adição de um ácido (base ou similares), se necessário.

[00307] A temperatura de reação da reação está normalmente na faixa de -20 a 100°C, e o tempo de reação da mesma está normalmente na faixa de 0,1 a 24 horas.

[00308] Depois da conclusão da reação, o composto (2) pode ser isolado submetendo-se a operações pós-tratamento tais como, a mistura reacional a ser filtrada para remover o catalisador de metal de transição, o filtrado a ser extraído com um solvente orgânico, a camada orgânica a ser seca e concentrada. O composto isolado (2) pode da mesma forma ser também purificado por cromatografia, recristalização, e similares.

[00309] A seguir, exemplos específicos do presente composto ativo são mostrados abaixo.

Composto de fórmula (1-A):



[00310] Na fórmula acima descrita (1-A)  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $A^1$ ,  $A^2$  e  $n$  são combinados como descrito nas (Tabela 1) a (Tabela 48).

Tabela 1

| $R^3$        | $R^5$ | $R^6$  | $R^7$ | $A^1$    | $A^2$    | $n$ |
|--------------|-------|--------|-------|----------|----------|-----|
| H            | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| F            | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| Cl           | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| Br           | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| I            | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| Me           | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| Et           | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| Pr           | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| iPr          | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| tBu          | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| $CH\equiv C$ | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| $CH_2=CH$    | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| $CF_3$       | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| $CF_3CF_2$   | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| MeO          | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| EtO          | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| PrO          | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| iPrO         | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| tBuO         | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| $CF_3CH_2O$  | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| $CHF_2CH_2O$ | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| $CH_2FCH_2O$ | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| $MeOCH_2O$   | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |
| $EtOCH_2O$   | Me    | $CF_3$ | H     | $=C(H)-$ | $=C(H)-$ | 0   |

Tabela 2

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeS                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeSO                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtS                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtSO                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrS                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrSO                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrS                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO                                           | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Ph                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 2-Py                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 3-Py                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 4-Py                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 1-Tz                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 1-Pz                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| H                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 1 |

Tabela 3

| R <sup>3</sup>                      | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------|----------------|-------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| F                                   | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| Cl                                  | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| MeO                                 | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| EtO                                 | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O   | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O  | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| CH <sub>2</sub> FCCH <sub>2</sub> O | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| MeS                                 | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| MeSO                                | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| MeSO <sub>2</sub>                   | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| EtS                                 | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| EtSO                                | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| EtSO <sub>2</sub>                   | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 1 |
| H                                   | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| F                                   | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| Cl                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| Br                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| I                                   | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| Me                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| Et                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| Pr                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| iPr                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| tBu                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CH≡C                                | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |

Tabela 4

| R <sup>3</sup>                       | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------|----------------|-------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| CH <sub>2</sub> =CH                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CF <sub>3</sub>                      | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>      | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeO                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtO                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| PrO                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| iPrO                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| tBuO                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O    | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O   | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O   | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeS                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeSO                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                    | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtS                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtSO                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                    | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| PrS                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| PrSO                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                    | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |

Tabela 5

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| iPrS                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO                                           | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Ph                                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 2-Py                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 3-Py                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 4-Py                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 1-Tz                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 1-Pz                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| H                                               | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| F                                               | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Cl                                              | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Br                                              | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| I                                               | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Me                                              | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Et                                              | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Pr                                              | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPr                                             | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBu                                             | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CH≡C                                            | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                             | Me             | OCF <sub>3</sub>              | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |

Tabela 6

| R <sup>3</sup>                       | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>   | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| CF <sub>3</sub>                      | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>      | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeO                                  | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtO                                  | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrO                                  | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrO                                 | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuO                                 | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O    | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O   | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O   | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeS                                  | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeSO                                 | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                    | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtS                                  | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtSO                                 | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                    | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrS                                  | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrSO                                 | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                    | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrS                                 | Me             | OCF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |

Tabela 7

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                      | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-------------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| iPrSO                                           | Me             | OCF <sub>3</sub>                    | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Me             | OCF <sub>3</sub>                    | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | OCF <sub>3</sub>                    | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | OCF <sub>3</sub>                    | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | OCF <sub>3</sub>                    | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Ph                                              | Me             | OCF <sub>3</sub>                    | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 2-Py                                            | Me             | OCF <sub>3</sub>                    | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 3-Py                                            | Me             | OCF <sub>3</sub>                    | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 4-Py                                            | Me             | OCF <sub>3</sub>                    | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 1-Tz                                            | Me             | OCF <sub>3</sub>                    | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 1-Pz                                            | Me             | OCF <sub>3</sub>                    | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| H                                               | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| F                                               | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Cl                                              | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Br                                              | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| I                                               | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Me                                              | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Et                                              | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Pr                                              | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPr                                             | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBu                                             | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CH≡C                                            | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                             | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub>                                 | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |

Tabela 8

| R <sup>3</sup>                       | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                      | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------|----------------|-------------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>      | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeO                                  | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtO                                  | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| PrO                                  | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| iPrO                                 | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| tBuO                                 | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O    | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O   | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O   | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeS                                  | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeSO                                 | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                    | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtS                                  | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtSO                                 | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                    | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| PrS                                  | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| PrSO                                 | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                    | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| iPrS                                 | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| iPrSO                                | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |

Tabela 9

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                      | R <sup>7</sup>  | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-------------------------------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                 | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                 | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                 | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                 | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Ph                                              | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                 | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| 2-Py                                            | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                 | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| 3-Py                                            | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                 | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| 4-Py                                            | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                 | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| 1-Tz                                            | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                 | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| 1-Pz                                            | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                 | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| H                                               | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| F                                               | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Cl                                              | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Br                                              | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| I                                               | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Me                                              | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Et                                              | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Pr                                              | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| iPr                                             | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| tBu                                             | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CH≡C                                            | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                             | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub>                                 | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>                 | Me             | H                                   | CF <sub>3</sub> | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |

Tabela 10

| R <sup>3</sup>                       | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup>  | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| MeO                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtO                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrO                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrO                                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuO                                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O    | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O   | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O   | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeS                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeSO                                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                    | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtS                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtSO                                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                    | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrS                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrSO                                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                    | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrS                                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO                                | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                   | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |

Tabela 11

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup>  | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| Ph                                              | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| 2-Py                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| 3-Py                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| 4-Py                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| 1-Tz                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| 1-Pz                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| H                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| F                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| Cl                                              | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| Br                                              | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| I                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| Me                                              | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| Et                                              | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| Pr                                              | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| iPr                                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| tBu                                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CH≡C                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CF <sub>3</sub>                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |
| MeO                                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C (H) -       | =C (H) -       | 0 |

Tabela 12

| R <sup>3</sup>                       | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| EtO                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrO                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrO                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuO                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O    | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O   | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O   | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeS                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeSO                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                    | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtS                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtSO                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                    | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrS                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrSO                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                    | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrS                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO                                | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                   | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S    | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |

Tabela 13

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Ph                                              | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| 2-Py                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| 3-Py                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| 4-Py                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| 1-Tz                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| 1-Pz                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| H                                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| F                                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Cl                                              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Br                                              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| I                                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Me                                              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Et                                              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Pr                                              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| iPr                                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| tBu                                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CH≡C                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub>                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| MeO                                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| EtO                                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |

Tabela 14

| R <sup>3</sup>                       | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| PrO                                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrO                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuO                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O    | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O   | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O   | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeS                                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeSO                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                    | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtS                                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtSO                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                    | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrS                                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrSO                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                    | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrS                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO                                | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                   | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S    | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO   | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |

Tabela 15

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Ph                                              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 2-Py                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 3-Py                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 4-Py                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 1-Tz                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| 1-Pz                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| H                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| F                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Cl                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Br                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| I                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Me                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Et                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Pr                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPr                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBu                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CH≡C                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub>                                 | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>                 | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeO                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtO                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| PrO                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |

Tabela 16

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| iPrO                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| tBuO                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| MeS                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| MeSO                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| EtS                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| EtSO                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| PrS                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| PrSO                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| iPrS                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| iPrSO                                           | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N -           | 0 |

Tabela 17

| R <sup>3</sup>                     | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|------------------------------------|----------------|-------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| Ph                                 | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 2-Py                               | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 3-Py                               | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 4-Py                               | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 1-Tz                               | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 1-Pz                               | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| H                                  | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| F                                  | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| Cl                                 | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| MeO                                | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| EtO                                | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O  | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| MeS                                | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| MeSO                               | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| MeSO <sub>2</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| EtS                                | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| EtSO                               | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| EtSO <sub>2</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =C(H) -        | =N-            | 1 |
| H                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| F                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Cl                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Br                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |

Tabela 18

| R <sup>3</sup>                       | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------|----------------|-------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| I                                    | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| Me                                   | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| Et                                   | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| Pr                                   | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| iPr                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| tBu                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CH≡C                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub>                      | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>      | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeO                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| EtO                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| PrO                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| iPrO                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| tBuO                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O    | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O   | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O   | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeS                                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeSO                                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |

Tabela 19

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| MeSO <sub>2</sub>                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtS                                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtSO                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| PrS                                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| PrSO                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrS                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrSO                                           | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Ph                                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 2-Py                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 3-Py                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 4-Py                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 1-Tz                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 1-Pz                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| H                                               | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| F                                               | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Cl                                              | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Br                                              | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| I                                               | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |

Tabela 20

| R <sup>3</sup>                       | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup>  | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| Me                                   | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| Et                                   | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| Pr                                   | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| iPr                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| tBu                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CH≡C                                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub>                      | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>      | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeO                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| EtO                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| PrO                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| iPrO                                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| tBuO                                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O    | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O   | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O   | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeS                                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeSO                                 | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                    | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C (H) -       | =N-            | 0 |

Tabela 21

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup>  | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| EtS                                             | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtSO                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                               | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| PrS                                             | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| PrSO                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                               | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrS                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrSO                                           | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Ph                                              | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 2-Py                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 3-Py                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 4-Py                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 1-Tz                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 1-Pz                                            | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| H                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| F                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Cl                                              | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Br                                              | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| I                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Me                                              | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =C(H) -        | =N-            | 0 |

Tabela 22

| R <sup>3</sup>                       | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| Et                                   | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| Pr                                   | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| iPr                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| tBu                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CH≡C                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub>                      | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>      | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeO                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| EtO                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| PrO                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| iPrO                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| tBuO                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O    | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O   | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O   | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeS                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeSO                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                    | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |
| EtS                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C (H) -       | =N-            | 0 |

Tabela 23

| $R^3$                                           | $R^5$ | $R^6$           | $R^7$ | $A^1$   | $A^2$ | n |
|-------------------------------------------------|-------|-----------------|-------|---------|-------|---|
| EtSO                                            | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                               | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| PrS                                             | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| PrSO                                            | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                               | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| iPrS                                            | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| iPrSO                                           | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| Ph                                              | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| 2-Py                                            | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| 3-Py                                            | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| 4-Py                                            | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| 1-Tz                                            | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| 1-Pz                                            | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| H                                               | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| F                                               | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| Cl                                              | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| Br                                              | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| I                                               | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| Me                                              | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |
| Et                                              | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =N-   | 0 |

Tabela 24

| R <sup>3</sup>                       | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| Pr                                   | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| iPr                                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| tBu                                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| CH=C                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub>                      | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>      | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| MeO                                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| EtO                                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| PrO                                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| iPrO                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| tBuO                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O    | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O   | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O   | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| MeS                                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| MeSO                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                    | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| EtS                                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |
| EtSO                                 | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =N-            | 0 |

Tabela 25

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | R |
|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| EtSO <sub>2</sub>                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| PrS                                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| PrSO                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrS                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrSO                                           | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Ph                                              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 2-Py                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 3-Py                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 4-Py                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 1-Tz                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| 1-Pz                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| H                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| F                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| Cl                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| Br                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| I                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| Me                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| Et                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| Pr                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |

Tabela 26

| R <sup>3</sup>                     | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| iPr                                | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| tBu                                | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CH≡C                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub>                    | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>    | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeO                                | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtO                                | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrO                                | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrO                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| tBuO                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O  | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| <sub>2</sub> O                     | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| <sub>2</sub> O                     | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeS                                | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeSO                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtS                                | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtSO                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |

Tabela 27

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| PrS                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrSO                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrS                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrSO                                           | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Ph                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 2-Py                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 3-Py                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 4-Py                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 1-Tz                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 1-Pz                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| H                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 1 |
| F                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 1 |
| Cl                                              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 1 |
| MeO                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 1 |
| EtO                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 1 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 1 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 1 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 1 |
| MeS                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 1 |

Tabela 28

| R <sup>3</sup>                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|---------------------------------|----------------|-------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| MeSO                            | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =N-            | =C(H) -        | 1 |
| MeSO <sub>2</sub>               | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =N-            | =C(H) -        | 1 |
| EtS                             | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =N-            | =C(H) -        | 1 |
| EtSO                            | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =N-            | =C(H) -        | 1 |
| EtSO <sub>2</sub>               | Me             | CF <sub>3</sub>               | H              | =N-            | =C(H) -        | 1 |
| H                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| F                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| Cl                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| Br                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| I                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| Me                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| Et                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| Pr                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| iPr                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| tBu                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| CH≡C                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub>                 | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| MeO                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| EtO                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| PrO                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| iPrO                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| tBuO                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |

Tabela 29

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeS                                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeSO                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtS                                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtSO                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrS                                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrSO                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrS                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrSO                                           | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Ph                                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 2-Py                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |

Tabela 30

| R <sup>3</sup>                    | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup>  | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-----------------------------------|----------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| 3-Py                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 4-Py                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 1-Tz                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 1-Pz                              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| H                                 | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| F                                 | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Cl                                | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Br                                | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| I                                 | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Me                                | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Et                                | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Pr                                | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPr                               | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| tBu                               | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CH≡C                              | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH               | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub>                   | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>   | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeO                               | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtO                               | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrO                               | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrO                              | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| tBuO                              | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O | Me             | H                             | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |

Tabela 31

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup>  | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O              | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O              | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeS                                             | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeSO                                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtS                                             | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtSO                                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrS                                             | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrSO                                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrS                                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrSO                                           | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Ph                                              | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 2-Py                                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 3-Py                                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |

Tabela 32

| R <sup>3</sup>                     | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup>  | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|------------------------------------|----------------|-----------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| 4-Py                               | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 1-Tz                               | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 1-Pz                               | Me             | H               | CF <sub>3</sub> | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| H                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| F                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Cl                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Br                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| I                                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Me                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Et                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Pr                                 | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPr                                | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| tBu                                | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CH≡C                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub>                    | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>    | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeO                                | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtO                                | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrO                                | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrO                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| tBuO                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O  | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | Et             | CF <sub>3</sub> | H               | =N-            | =C(H)-         | 0 |

Tabela 33

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O              | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> O                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeS                                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeSO                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtS                                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtSO                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrS                                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrSO                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrS                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrSO                                           | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| Ph                                              | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 2-Py                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 3-Py                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |
| 4-Py                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |

Tabela 34

| $R^3$                              | $R^5$ | $R^6$           | $R^7$ | $A^1$ | $A^2$  | n |
|------------------------------------|-------|-----------------|-------|-------|--------|---|
| 1-Tz                               | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| 1-Pz                               | Et    | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| H                                  | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| F                                  | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| Cl                                 | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| Br                                 | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| I                                  | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| Me                                 | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| Et                                 | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| Pr                                 | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| iPr                                | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| tBu                                | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| CH≡C                               | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| CH <sub>2</sub> =CH                | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| CF <sub>3</sub>                    | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>    | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| MeO                                | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| EtO                                | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| PrO                                | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| iPrO                               | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| tBuO                               | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O  | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |
| CH <sub>2</sub> FCH <sub>2</sub> O | CyPr  | CF <sub>3</sub> | H     | =N-   | =C(H)- | 0 |

Tabela 35

| R <sup>3</sup>                                  | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|-------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| MeOCH <sub>2</sub> O                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> O                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| EtOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| MeS                                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| MeSO                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| MeSO <sub>2</sub>                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| EtS                                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| EtSO                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| EtSO <sub>2</sub>                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| PrS                                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| PrSO                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| PrSO <sub>2</sub>                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| iPrS                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO                                           | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| iPrSO <sub>2</sub>                              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> S               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| Ph                                              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| 2-Py                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| 3-Py                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| 4-Py                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |
| 1-Tz                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H) -        | 0 |

Tabela 36

| R <sup>3</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| 1-Pz           | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =N-            | =C(H)-         | 0 |

Tabela 37

| R <sup>3</sup>                                   | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| HO                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| HS                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| tBuS                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| tBuSO                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| NC                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| HO(CO)                                           | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| MeO(CO)                                          | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| EtO(CO)                                          | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| H <sub>2</sub> N(CO)                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| MeHN(CO)                                         | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| EtHN(CO)                                         | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Me <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Et <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| (MeO)MeN(CO)                                     | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |

Tabela 38

| R <sup>3</sup>                                   | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------------------|----------------|-------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| HO                                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| HS                                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuS                                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuSO                                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| NC                                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| HO(CO)                                           | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeO(CO)                                          | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtO(CO)                                          | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| H <sub>2</sub> N(CO)                             | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeHN(CO)                                         | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtHN(CO)                                         | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Me <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Et <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| (MeO)MeN(CO)                                     | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | Me             | C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |

Tabela 39

| $R^3$                                            | $R^5$ | $R^6$            | $R^7$ | $A^1$   | $A^2$   | n |
|--------------------------------------------------|-------|------------------|-------|---------|---------|---|
| HO                                               | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| HS                                               | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| tBuS                                             | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| tBuSO                                            | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| NC                                               | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| HO(CO)                                           | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| MeO(CO)                                          | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| EtO(CO)                                          | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| H <sub>2</sub> N(CO)                             | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| MeHN(CO)                                         | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| EtHN(CO)                                         | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| Me <sub>2</sub> N(CO)                            | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| Et <sub>2</sub> N(CO)                            | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| (MeO)MeN(CO)                                     | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | Me    | OCF <sub>3</sub> | H     | =C(H) - | =C(H) - | 0 |

Tabela 40

| R <sup>3</sup>                                   | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>                      | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------------------|----------------|-------------------------------------|----------------|----------------|----------------|---|
| HO                                               | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| HS                                               | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| tBuS                                             | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| tBuSO                                            | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| NC                                               | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| HO(CO)                                           | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| MeO(CO)                                          | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| EtO(CO)                                          | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| H <sub>2</sub> N(CO)                             | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| MeHN(CO)                                         | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| EtHN(CO)                                         | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Me <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| Et <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| (MeO)MeN(CO)                                     | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | Me             | -CF <sub>2</sub> OCF <sub>2</sub> - |                | =C(H)-         | =C(H)-         | 0 |

Tabela 41

| R <sup>3</sup>                                   | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup>  | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| HO                                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| HS                                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuS                                             | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuSO                                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| NC                                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| HO(CO)                                           | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeO(CO)                                          | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtO(CO)                                          | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| H <sub>2</sub> N(CO)                             | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeHN(CO)                                         | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtHN(CO)                                         | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Me <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Et <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| (MeO)MeN(CO)                                     | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |

Tabela 42

| R <sup>3</sup>                                   | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| HO                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| HS                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuS                                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuSO                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| NC                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| HO(CO)                                           | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeO(CO)                                          | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtO(CO)                                          | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| H <sub>2</sub> N(CO)                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeHN(CO)                                         | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtHN(CO)                                         | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Me <sub>2</sub> N(CO)                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Et <sub>2</sub> N(CO)                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| (MeO)MeN(CO)                                     | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |

Tabela 43

| R <sup>3</sup>                                   | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| HO                                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| HS                                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuS                                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuSO                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| NC                                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| HO(CO)                                           | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeO(CO)                                          | CyPrCy         | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtO(CO)                                          | Pr             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| H <sub>2</sub> N(CO)                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeHN(CO)                                         | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| EtHN(CO)                                         | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Me <sub>2</sub> N(CO)                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| Et <sub>2</sub> N(CO)                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| (MeO)MeN(CO)                                     | CyPrCy         | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | Pr             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =C(H) -        | 0 |

Tabela 44

| R <sup>3</sup>                                   | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| HO                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| HS                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuS                                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuSO                                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| NC                                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| HO(CO)                                           | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeO(CO)                                          | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtO(CO)                                          | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| H <sub>2</sub> N(CO)                             | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeHN(CO)                                         | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtHN(CO)                                         | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Me <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Et <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| (MeO)MeN(CO)                                     | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | Me             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |

Tabela 45

| $R^3$                                            | $R^5$ | $R^6$    | $R^7$ | $A^1$    | $A^2$ | n |
|--------------------------------------------------|-------|----------|-------|----------|-------|---|
| HO                                               | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| HS                                               | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| tBuS                                             | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| tBuSO                                            | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| NC                                               | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| HO (CO)                                          | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| MeO (CO)                                         | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| EtO (CO)                                         | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| H <sub>2</sub> N (CO)                            | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| MeHN (CO)                                        | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| EtHN (CO)                                        | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| Me <sub>2</sub> N (CO)                           | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| Et <sub>2</sub> N (CO)                           | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| (MeO)MeN (CO)                                    | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | Me    | $C_2F_5$ | H     | =C (H) - | =N-   | 0 |

Tabela 46

| R <sup>3</sup>                                   | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup> | R <sup>7</sup>  | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|---|
| HO                                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| HS                                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuS                                             | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuSO                                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| NC                                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| HO(CO)                                           | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeO(CO)                                          | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtO(CO)                                          | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| H <sub>2</sub> N(CO)                             | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeHN(CO)                                         | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtHN(CO)                                         | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Me <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Et <sub>2</sub> N(CO)                            | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| (MeO)MeN(CO)                                     | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | Me             | H              | CF <sub>3</sub> | =C(H) -        | =N-            | 0 |

Tabela 47

| R <sup>3</sup>                                   | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| HO                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| HS                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuS                                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuSO                                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| NC                                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| HO(CO)                                           | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeO(CO)                                          | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtO(CO)                                          | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| H <sub>2</sub> N(CO)                             | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeHN(CO)                                         | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtHN(CO)                                         | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Me <sub>2</sub> N(CO)                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Et <sub>2</sub> N(CO)                            | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| (MeO)MeN(CO)                                     | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | Et             | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |

Tabela 48

| R <sup>3</sup>                                   | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup>  | R <sup>7</sup> | A <sup>1</sup> | A <sup>2</sup> | n |
|--------------------------------------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| HO                                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| iPrCH <sub>2</sub> O                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuCH <sub>2</sub> O                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| HS                                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuS                                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuSO                                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| tBuSO <sub>2</sub>                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> S                                | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CF <sub>3</sub> SO <sub>2</sub>                  | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO              | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| CHF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| NC                                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| HO(CO)                                           | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeO(CO)                                          | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtO(CO)                                          | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| H <sub>2</sub> N(CO)                             | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeHN(CO)                                         | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| EtHN(CO)                                         | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Me <sub>2</sub> N(CO)                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| Et <sub>2</sub> N(CO)                            | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| (MeO)MeN(CO)                                     | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |
| MeOCH <sub>2</sub>                               | CyPr           | CF <sub>3</sub> | H              | =C(H) -        | =N-            | 0 |

[00311] Nas Tabelas 1 a 48 acima descritas, Me representa um grupo metila, Et representa um grupo etila, Pr representa um grupo propila, iPr representa um grupo isopropila, tBu representa um grupo terc-butila, Ph representa um grupo fenila, 2-Py representa um grupo 2-piridila, 3-Py representa um grupo 3-piridila, 4-Py representam um grupo 4-piridila, 1-Tz representa um grupo 1,2,4-triazol-1-ila, 1-Pz representa um grupo pirazol-1-ila e CyPr representa um grupo ciclopropila.

[00312] A composição da presente invenção contém o presente composto ativo e um veículo inerte. Geralmente, a composição da presente invenção é uma formulação obtida misturando-se o presente composto ativo e um veículo inerte, tal como um veículo sólido, um veículo líquido e um veículo gasoso, e também adicionando-se um tensoativo e outro adjuvante para formulação, se necessário. A formulação inclui, por exemplo, uma emulsão, uma solução em óleo, um pó, um grânulo, um pó umectável, uma formulação fluível, um microcápsula, um aerossol, agente de fumigação, uma isca de veneno e uma formulação de resina. Na composição da presente invenção, o presente composto ativo está contido normalmente em uma quantidade de 0,01% a 95% em peso.

[00313] O veículo sólido usado para formulação incluem, por exemplo, um pó fino e um grânulo de argila (por exemplo, argila de caulim, diatomita, bentonita, argila de Fubasami e argila ácida), óxido de silício hidratado sintético, talco, cerâmica, outros minerais inorgânicos (por exemplo, sericita, quartzo, enxofre, carbono ativado, carbonato de cálcio, sílica hidratada) ou fertilizantes químicos (por exemplo, sulfato de amônio, fosfato de amônio, nitrato de amônio, ureia e cloreto de amônio).

[00314] O veículo líquido inclui, por exemplo, água, álcoois (por exemplo, metanol, etanol, álcool isopropílico, butanol, hexanol, álcool

benzílico, etileno glicol, propileno glicol, fenoxietanol), cetonas (por exemplo, acetona, metil etil cetona, ciclo-hexanona), hidrocarbonetos aromáticos (por exemplo, tolueno, xileno, etilbenzeno, dodecilbenzeno, fenilxileto, metilnaftaleno), hidrocarboneto alifático (por exemplo, hexano, ciclo-hexano, querosene, óleo leve), ésteres (por exemplo, acetato de etila, acetato de butila, mistato de isopropila, oleato de etila, adipato de di-isopropila, adipato de di-isobutila, acetato de monometil éter de propilenoglicol), nitrilas (por exemplo, acetonitrila, isobutironitrila), éteres (por exemplo, di-isopropil éter, 1,4-dioxano, dimetil éter de etileno glicol, dimetil éter de dietileno glicol, monometil éter de dietileno glicol, monometil éter de propileno glicol, monometil éter de dipropileno glicol, 3-metóxi-3-metil-1-butanol), amidas ácidas (por exemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida), hidrocarbonetos halogenados (por exemplo, diclorometano, tricloroetano, tetraclorocarbono), sulfóxidos (por exemplo, dimetilsulfóxido), propileno carbonato, e óleos vegetais (por exemplo, óleo de soja, óleo de semente de algodão).

[00315] Por exemplo, o veículo gasoso inclui, por exemplo, fluorocarbono, gás butano, gás de petróleo liquefeito (LPG), dimetil éter e dióxido de carbono.

[00316] O tensoativo inclui, por exemplo, tensoativo não ionico, tal como alquil éter de polioxietileno, alquilaril éter de polioxietileno, éster de ácido graxo de polietilenoglicol; e tensoativo aniônico, tal como sais de ácido alquilsulfônicos, sais de ácido alquilbenzenosulfônicos e sais de ácido alquilsulfônicos.

[00317] O outro adjuvante para formulação inclui, por exemplo, aglutinantes, dispersantes, corantes e estabilizadores, e especificamente por exemplo, caseína, gelatina, polissacarídeos (por exemplo, amido, goma arábica, derivados de celulose, ácido algínico), derivados de lignina, polímeros solúveis em água sintéticos (por

exemplo, álcool polivinílico, polivinilpirrolidona, ácido poliacrílico), PAP (fosfato de ácido isopropílico), BHT (2,6-di-t-butil-4-metilfenol), BHA (uma mistura de 2-t-butil-4-metoxifenol e 3-t-butil-4-metoxifenol).

[00318] O método para controlar artrópode nocivo da presente invenção é, aplicar uma quantidade eficaz do presente composto ativo diretamente a um artrópode nocivo e/ou habitats de um artrópode nocivo (por exemplo, planta, solo, em recinto fechado, e no corpo de animais). O presente composto ativo é normalmente usado como a composição da presente invenção para o método para controlar um artrópode nocivo da presente invenção.

[00319] Quando a composição da presente invenção for usada para um controle de um artrópode nocivo na agricultura, a quantidade de aplicação normalmente é 1 a 10.000 g assim como o presente composto ativo por 10.000 m<sup>2</sup>. Quando a composição da presente invenção for uma formulação de emulsões, pós umectáveis ou fluíveis, ela é normalmente aplicada depois de uma diluição com água para ter uma concentração de ingrediente ativa de 0,01 a 10.000 ppm. Quando a composição da presente invenção for uma formulação de grânulos ou pós, ela é normalmente aplicada como tal.

[00320] Estas formulações e a solução aquosa diluída da formulação pode ser pulverizada diretamente à planta a ser protegida de um artrópode nocivo, e podem ser aplicadas ao solo para controlar o artrópode nocivo que vive em um solo.

[00321] Além disso, as formulações de resina de folhas ou em forma de tiras podem ser aplicadas por um método tal como enrolar ao redor das plantas, estender nos arredores das plantas e dispor sobre a superfície do solo na base da planta.

[00322] Quando a composição da presente invenção for usada para um controle de um artrópode nocivo dentro em recinto fechado, a quantidade de aplicação normalmente é 0,01 a 1.000 mg assim como

o presente composto ativo por 1 m<sup>2</sup> no caso de aplicação para superfície plana, e 0,01 a 500 mg assim como o presente composto ativo por 1 m<sup>3</sup> no caso de aplicação por área. Quando a composição da presente invenção for uma formulação de emulsões, pós umectáveis ou fluíveis, ela é normalmente aplicada depois de uma diluição com água para ter uma concentração de ingrediente ativa de 0,1 a 1.000 ppm. Quando a composição da presente invenção for uma formulação de soluções em óleo, aerossóis, agentes de fumigação e iscas de veneno, ela é normalmente aplicada como tal.

[00323] A composição da presente invenção pode ser uma mistura com ou juntamente com outros inseticidas, acaricidas, nematicidas, fungicidas, reguladores de crescimento de planta, herbicidas e sinergistas.

[00324] Exemplos de ingredientes ativos do inseticida, do acaricida, do nematicida, do fungicida, do regulador de crescimento de planta, do herbicida e do sinergista, são mostrados abaixo.

#### (1) Compostos de fósforo orgânicos

[00325] Acefato, fosfeto de alumínio, butatiofos, cadusafos, cloretoxifos, clorfeninfos, clorpirifos, clorpirifos-metila, cianofos: CYAP, diazinona, DCIP (éter diclorodi-isopropílico), diclofentiona: ECP, diclorvos (DDVP), dimetoato, dimetilinfos, dissulfotona, EPN, etiona, etoprofos, etrinfos, fentiona: MPP, fenitrotona: MEP, fostiazato, formotiona, fosfeto de hidrogênio, isofenfos, isoxationa, malationa, messulfenfos, metidationa: DMTP, monocrotofos, naled (BRP), oxideprofos: ESP, parationa, fosadona, fosmete (PMP), pirimifos-metila, piridafentona, quinalfos, fentoato: PAP, profenofos, propafos, protiofos, piraclorfos, salitiona, sulprofos, tebupirinfos, temefos, tetraclorvinfos, terbufos, tiometona, triclorfona: DEP, vamidotona, forato, cadusafos;

#### (2) Compostos de carbamato

[00326] Alanicarbe, bendiocarbe, benfuracarbe, BPMC, carbaril, carbofurano, carbossulfano, cloetocarbe, etiofencarbe, fenobucarbe, fenotiocarbe, fenoxicarbe, furatiocarbe, isoprocarbe: MIPC, metolcarbe, metomil, metiocarbe, NAC, oxamil, pirimicarbe, propoxur: PHC, XMC, tiodicarbe, xililcarbe, aldicarbe;

### (3) Compostos de piretroide

[00327] Acrinatrina, aletrina, benflutrina, beta-ciflutrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cialotrina, cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofemprox, fempropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenoprox, flumetrina, fluvalinato, halfemprox, imiprotrina, permetrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigma-cipermetrina, silafluofeno, teflutrina, tralometrina, transflutrina, tetrametrina, fenotrina, cifenotrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, lambda-cialotrina, gama-cialotrina, furametrina, tau-fluvalinato, metoflutrina, proflutrina, dimeflutrina, (EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)benzila, (EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metilbenzila e (1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)ciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)benzila;

### (4) Compostos de Nereistoxina

[00328] Cartape, bensultape, tiociclam, monossultape, bissultape;

### (5) Compostos de Neonicotinoide

[00329] Imidacloprida, nitempiram, acetamiprida, tiametoxam, tiacloprida, dinotefurano, clotianidina;

### (6) Compostos de Benzoilureia

[00330] Clorfluazurona, bistriflurona, diafentiurona, diflubenzurona, fluazurona, flucicloxurona, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona, teflubenzurona, triflumurona, triazurona;

### (7) Compostos de fenilpirazol

[00331] Acetoprol, etiprol, fipronil, vaniliprol, piriprol, pirafluprol;

(8) Toxinas Bt

[00332] Esporos vivos derivados de toxinas cristalinas produzidas por *Bacilo thuringiensis* e uma mistura dos mesmos;

(9) Compostos de hidrazina

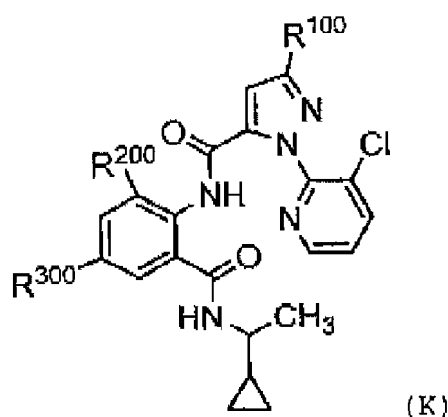
[00333] Cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida;

(10) Compostos de cloro orgânicos

[00334] Aldrina, dieldrina, dienoclor, endossulfan, metoxiclor;

(11) Outros ingredientes ativos dos inseticidas

[00335] Óleo de máquina, sulfato de nicotina, avermectina-B, bromopropilato, buprofezina, clorfenapir, ciantraniliprol, ciromazina, D-D (1,3-Dicloropropeno), benzoato de emamectina, fenazaquina, flupirazofos, hidropreno, metopreno, indoxacarbe, metoxadiazona, milbemicina-A, pimetozina, piridalila, piriproxifeno, espinosade, sulfluramide, tolfempirade, triazamato, flubendiamida, lepimectina, ácido arsênico, benclotiaz, cianamida de cálcio, polissulfeto de cálcio, clordano, DDT, DSP, flufenerim, flonicamide, flurimfeno, formetanato, metam-amônio, metam-sódio, brometo de metila, oleato de potássio, protrifembute, espiromesifeno, sulfoxaflor, enxofre, metaflumizona, espirotetramate, pirifluquinazona, espinatoram, clorantraniliprol, tralopirila, ciantraniliprol, qualquer composto representado pela seguinte fórmula (K);



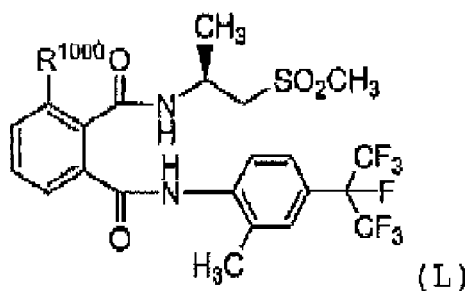
[00336] em que

[00337] R100 representa cloro, bromo ou um grupo trifluorometila,

[00338] R200 representa cloro, bromo ou um grupo metila,

[00339] R300 representa cloro, bromo ou um grupo ciano,

[00340] e qualquer composto representado pela seguinte fórmula (L);



[00341] em que

[00342] R1000 representa cloro, bromo ou iodo,

[00343] Ingrediente ativos dos acaricidas:

[00344] Acequinocila, amitraz, benzoximato, bifenaato, bromopropilato, quinometionate, clorobenzilato, CPCBS (clorfensona), clofentezina, ciflumetofeno, dicofol, etoxazol, óxido de fembutatina, fenotiocarbe, fempiroximato, fluacripirim, fluproxifeno, hexitiazox, propargita: BPPS, polinactinas, piridabeno, pirimidifeno, tebufempirade, tetradifona, espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramate, amidoalumete, cienopirafeno.

[00345] Ingredientes ativos dos nematicidas:

[00346] DCIP, fostiazato, cloridrato de levamisol, metilisotiocianato, tartarato de morantel, imiciafos.

[00347] Ingredientes ativos dos fungicidas:

[00348] Compostos fungicidas de azol tais como propiconazol, prothioconazol, triadimenol, procloraz, penconazol, tebuconazol, flusilazol, diniconazol, bromuconazol, epoxiconazol, difenoconazol, ciproconazol, metconazol, triflumizol, tetraconazol, miclobutanila, fenbuconazol, hexaconazol, fluquinconazol, triticonazol, bitertanol,

imazalila e flutriafol;

[00349] Compostos fungicidas de amina cíclica tais como, fenpropimorfe, tridemorfe e fenpropidina;

[00350] Compostos fungicidas de benzimidazol tais como, carbendezim, benomila, tiabendazol e tiofanato-metila;

[00351] Procimidona; ciprodinila; pirimetanila; dietofencarbe; tiuram; fluazinam; mancozebe; iprodiona; vinclozolina; clorotalonila; captano; mepanipirim;

[00352] fenpiclonil/fludioxonil; diclofluanide; folpete; cresoxim-metila; azoxistrobina; trifloxistrobina; fluoxastrobina; picoxistrobina; piraclostrobina; dimoxistrobina; piribencarbe; espiroxamina; quinoxifeno; fenexamida; famoxadona; fenamidona; zoxamida; etaboxam; amisulbrom; iprovalicarbe; bentiavalicarbe); ciazofamida; mandipropamida; boscalide; pentiopirade; metrafenona; fluopirano; bixafeno; ciflufenamida; proquinazida; isotianila, tiadinila.

[00353] Ingredientes ativos dos herbicidas: (1) Compostos herbicidas de ácido fenoxigraxo

[00354] 2,4-PA, MCP, MCPB, fenotiol, mecoprope, fluroxipir, triclopir, clomeprope e naproanilida.

(2) compostos herbicidas de ácido benzóico

[00355] 2,3,6-TBA, dicamba, clopiralide, picloram, aminopiralide, quincloraco e quinmeraco.

(3) Compostos herbicidas de ureia

[00356] diurona, linurona, clortolurona, isoproturona, fluometurona, isourona, tebutiurona, metabenzthiazurona, cumilurona, daimurona e metil-daimurona.

(4) Compostos herbicidas de triazina

[00357] atrazina, ameturina, cianazina, simazina, propazina, simetrina, dimetametrina, prometrina, metribuzina, indaziflam e triaziflam.

(5) Compostos herbicidas de bupiridínio paraquate e diquate.

(6) Compostos herbicidas de hidroxibenzonitrila

[00358] bromoxinila e ioxinila.

(7) Compostos herbicidas de dinitroanilina

[00359] pendimetalina, prodiamina e trifluralina.

(8) Compostos herbicidas de fósforo orgânico

[00360] amiprofos-metila, butamifos, bensulida, piperofos, anilofos, glifosato, glufosinato e bialafos.

(9) Compostos herbicidas de carbamato

[00361] di-alato, tri-alato, EPTC, butilato, bentiocarbe, esprocarbe, molinato, dimepiperato, *swep*, clorprofam, fenmedifam, fenisofam, piributicarbe e asulam;

(10) Compostos herbicidas de amida ácida

[00362] propanila, propizamida, bromobutida e etobenzanide,

(11) Compostos herbicidas de cloroacetanilida

[00363] acetoclor, alaclor, butaclor, dimetenamide, propaclor, metazaclor, metolaclor, pretilaclor, tenilclor e petoxamide.

(12) Compostos herbicidas de difenil éter

[00364] acifluorfenó-sódio, bifenox, oxifluorfenó, lactofenó, fomesafenó, clometoxinila e aclonifenó.

(13) Compostos herbicidas de imida cíclica

[00365] oxadiazona, cinidona-etila, carfentrazona-etila, surfentrazona, flumicloraco-pentila, flumioxazina, piraflufenó-etila, oxadiargila, pentoxazona, flutiacete-metila, butafenacila, benzfendizona e saflufenacila.

(14) Compostos herbicidas de pirazol

[00366] benzofenape, pirazolato, pirazoxifenó, topramezona e pirasulfotol.

(15) Compostos herbicidas de tricetona

[00367] isoxaflutol, benzobiciclona, sulcotriona, mesotriona,

tembotriona e tefuriltriona.

(16) Compostos herbicidas de ácido ariloxifenooxipropiônico

[00368] clodinafope-propargila, cialofope-butila, diclofope-metila, fenoxaprope-etila, fluazifope-butila, haloxifope-metila e quizalofope-etila e metamifol.

(17) Compostos herbicidas de trioneoxima

[00369] aloxidim-sódio, setoxidim, butrooxidim, cletodim, cloproxidim, cicloxidim, tepraloxidim, tralcoxidim e profoxidim.

(18) Compostos herbicidas de sulfonilureia

[00370] clorsulfurona, sulfometurona-metila, metsulfurona-metila, clorimurona-etila, tribenurona-metila, triassulfurona, bensulfurona-metila, tifensulfurona-metila, pirazossulfurona-etila, pirimissulfurona-metila, nicossulfurona, amidossulfurona, cinossulfurona, imazossulfurona, rinsulfurona, halossulfurona-metila, prossulfurona, etametsulfurona-metila, triflussulfurona-metila, flazassulfurona, ciclossulfamurona, flupirsulfurona, sulfossulfurona, azinsulfurona, etoxissulfurona, oxassulfurona, iodossulfurona-metil-sódio, foransulfurona, mesossulfurona-metila, trifloxissulfurona, tritossulfurona, ortossulfamurona, flucetossulfurona e propirissulfurona.

(19) Compostos herbicidas de imidazolinona

[00371] imazametabenz-metila, imazametapir, imazamox, imazapir, imazaquina, e imazetapir.

(20) Compostos herbicidas de sulfonamida

[00372] flumetsulam, metossulam, diclossulam, florassulam, cloransulam-metila, penoxsulam e piroxsulam.

(21) Compostos herbicidas de ácido pirimidiniloxibenzoico

[00373] piritiobaco-sódio, bispiribaco-sódio, piriminobaco-metila, piribenzoxim, piriftalida e pirimissulfano.

(22) Outros compostos herbicidas

[00374] Bentazona, bromacila, terbacila, clortiamida, isoxabeno,

dinosebe, amitrol, cinmetilina, tridifano, dalapona, diflufenzopir-sódio, ditiopir, tiazopir, flucarbazona-sódio, propoxicarbeazona-sódio, mefenacete, flufenacete, fentrazamida, cafenstrol, indanofano, oxaziclomefona, benfuresato, ACN, piridato, cloridazona, norflurazona, flurtamona, diflufenicano, picolinafeno, beflubutamida, clomazona, amicarbeazona, pinoxadeno, piraclonila, piroxassulfona, tienicarbeazona-metila, aminociclopiraclor, ipfencarbeazona e metiozolina.

[00375] Ingredientes ativos dos sinergistas:

[00376] Butóxido de piperonila, sesamex, sulfóxido, N-(2-etil-hexil)-8,9, 10-trinorborn-5-eno-2, 3-dicarbeóxi-imida (MGK 264), N-declimidazol, WARF-antirresistente, TBPT, TPP, IBP, PSCP, iodeto de metila (CH3I), t-fenilbutenona, maleato de dietila, DMC, FDMC, ETP e ETN.

[00377] Artrópode nocivo contra o qual, o presente composto ativo tem uma atividade, inclui, por exemplo, insetos nocivos e acarinos nocivos. Exemplos específicos destes artrópodes nocivos incluem o seguinte.

#### Hemípteros:

[00378] Gafanhotos de planta (Delphacidae) tais como gafanhoto de planta marrom pequeno (*Laodelphax striatellus*), gafanhoto de planta de arroz marrom (*Nilaparvata lugens*), e gafanhoto de planta de arroz de fundo branco (*Sogatella furcifera*); gafanhotos de folhas (Deltocephalidae) tais como gafanhoto de folha de arroz verde (*Nephotettix cincticeps*), gafanhoto de folha de arroz verde (*Nephotettix virescens*), e gafanhoto de folha de chá verde (*Empoasca onukii*); pulgões (Aphididae) tais como pulgão de algodão (*Aphis gossypii*), pulgão de pêssago verde (*Myzus persicae*), pulgão de repolho (*Brevicoryne brassicae*), pulgão de espireia (*Aphis spiraeicola*), pulgão de batata (*Macrosiphum euphorbiae*), pulgão de dedaleira

(*Aulacorthum solani*), pulgão de pássaro-cerejeira de aveia (*Rhopalosiphum padi*), pulgão de plantas cítricas tropical (*Toxoptera citricidus*), e pulgão cor de ameixa farináceo (*Hyalopterus pruni*); percevejos fedorentos (*Pentatomidae*) tais como percevejo fedorento verde (*Nezara antennata*), percevejo do feijão (*Riptortus clavetus*), percevejo do arroz (*Leptocorisa chinensis*), percevejo espinhudo de mancha branca (*Eysarcoris parvus*), e percevejo fedorento (*Halyomorpha mista*); moscas brancas (*Aleyrodidae*) tais como mosca branca de estufa (*Trialeurodes vaporariorum*), mosca branca de batata doce (*Bemisia tabaci*), mosca branca da folha prata (*Bemisia argentifolii*), mosca branca de plantas cítricas (*Dialeurodes citri*), e mosca branca espinhenta de plantas cítricas (*Aleurocanthus spiniferus*); cochonilhas (*Coccidae*) tais como cochonilhas vermelhas da Califórnia (*Aonidiella aurantii*), cochonilha de San José (*Comstockaspis perniciosus*), cochonilha das plantas cítricas do norte (*Unaspis citri*), cochonilha da cera vermelha (*Ceroplastes rubens*), cochonilha acolchoado cotonígera (*Icerya purchasi*), percevejo farináceo Japonês (*Planococcus kraunhiae*), percevejo farináceo *Cosmstock* (*Pseudococcus longispinis*), e cochonilha branca do pessegueiro (*Pseudaulacaspis pentagona*); percevejo atacador (*Tingidae*); percevejos tais como *Cimex lectularius*; piolho saltador das plantações (*Psyllidae*).

#### Lepidópteros:

[00379] Traças *Pyralid* (*Pyralidae*) tais como broca de talo de arroz (*Chilo suppressalis*), broca de arroz amarelo (*Tryporyza incertulas*), enrolador de folhas de arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), enrolador de folhas de algodão (*Notarcha derogata*), traça de fubá (*Plodia interpunctella*), broca do milho oriental (*Ostrinia furnacalis*), larva de teias do repolho (*Hellula undalis*), e larvas de teias do capim-do-campo (*Pediasia teterrellus*); traças *owlet* (*Noctuidae*) tais como lagarta

comum (*Spodoptera litura*), lagarta dos cereais de beterraba (*Spodoptera exigua*), lagarta dos cereais (*Pseudaletia separata*), lagarta dos cereais de repolho (*Mamestra brassicae*), lagarta preta (*Agrotis ipsilon*), semilarva da beterraba (*Plusia nigrisigna*), *Thoricoplusia spp.*, *Heliothis Spp.*, e *Helicoverpa spp.*; borboletas brancas (*Pieridae*) tais como branca comum (*Pieris rapae*); traças tortrix (*Tortricidae*) tal como *Adoxophyes spp.*, traça de fruta oriental (*Grapholita molesta*), broca da vagem do feijão de soja (*Leguminivora glycinivorella*), lagarta da vagem do feijão azúqui (*Matsumuraeses azukivora*), traça tortrix da fruta de verão (*Adoxophyes orana fasciata*), tortrix do chá pequena (*Adoxophyes honmai.*), tortrix do chá oriental (*Homona magnanima*), tortrix da macieira (*Archips fuscocupreanus*), e traça de maçã verde (*Cydia pomonella*); bicho mineiro da pústula da folha (*Gracillariidae*) tal como enrolador de folhas de chá (*Caloptilia theivora*), e bicho mineiro da folha da maçã (*Phyllonorycter ringoneella*); Carposinidae tal como traça do fruto do pessegueiro (*Carposina niponensis*); traças *lyonetiid* (*Lyonetiidae*) tal como *Lyonetia spp.*; mariposas do tufo de grama (*Lymantriidae*) tais como *Lymantria spp.*, e *Euproctis spp.*; traças *yponomeutid* (*Yponomeutidae*) tal como mariposa com marcas em forma de losango no dorso (*Plutella xylostella*); traças *gelechiid* (*Gelechiidae*) tal como lagarta rosada do algodoeiro (*Pectinophora gossypiella*), e traça do tubérculo da batata (*Phthorimaea operculella*); mariposa tigrina e aliados (*Arctiidae*) tais como larva de teias do outono (*Hyphantria cunea*); traças de *tineid* (*Tineidae*) tal como traça de tecidos de fabricação de malas (*Tinea translucens*), e traça de tecidos de rede (*Tineola bisselliella*).

#### Tisanópteros:

[00380] Tripes (*Thripidae*) tais como tripes das frutas cítricas amarelas (*Frankliniella occidentalis*), tripes do melão (*Thrips palmi*), tripes do chá amarelo (*Scirtothrips dorsalis*), tripes da cebola (*Thrips*

*tabaci*), tripes das flores (*Frankliniella intonsa*).

#### Dípteros:

[00381] Culices tais como mosquito comum (*Culex pipiens palens*), *Culex tritaeniorhynchus*, e *Culex quinquefasciatus*; *Aedes* spp. tal como mosquito de febre amarela (*Aedes aegypti*), e mosquito de tigre Asiático (*Aedes albopictus*); *Anopheles* spp. tal como *Anopheles sinensis*; quironomídeos (Chironomidae); moscas domésticas (Muscidae) tais como *Musca domestica*, e *Muscina stabulans*; larvas de mosca (Calliforidae); moscas varejeiras (Sarcofagidae); moscas domésticas pequenas (Fanniidae); moscas anthomyiid (Anthomyiidae) tal como mosca da semente do milho (*Deli platura*), e mosca da cebola (*Delia antiqua*); moscas de folha minada (Agromyzidae) tal como folha minada de arroz (*Agromiza oryzae*), folha minada de arroz pequeno (*Hydrellia griseola*), folha minada de tomate (*Liriomyza sativae*), folha minada de legume (*Liriomyza trifolii*), e folha minada de ervilha de jardim (*Chromatomyia horticola*); moscas de gota (Chloropidae) tal como larva de inseto do talo de arroz (*Chlorops oryzae*); mosca das frutas (Tephritidae) tal como mosca de melão (*Dacus cucurbitae*), e mosca das frutas do Mediterrâneo (*Ceratitis capitata*); Drosophilidae; moscas corcundas (Phoridae) tal como *Megaselia spiracularis*; moscas de traça (Psychodidae) tal como *Clogmia albipunctata*; Simuliidae; Tabanidae tal como mutuca (*Tabanus trigonus*); moscas de estábulo.

#### Coleópteros:

[00382] Lagartas da raiz do milho (*Diabrotica* spp.) tal como lagarta da raiz do milho Ocidental (*Diabrotica virgifera virgifera*), e lagarta da raiz do milho Sulista (*Diabrotica undecimpunctata howardi*); escaravelhos (Scarabaeidae) tal como escaravelho da cor do cobre (*Anomala cuprea*), besouro do feijão-soja (*Anomala rufocuprea*), e besouro japonês (*Popillia japonica*); gorgulhos tal como gorgulho do milho (*Sitophilus zeamais*), gorgulho aquático do arroz (*Lissorhoptrus*

*oryzophilus*), gorgulho do feijão de azuki (*Callosobruchus chinensis*), gorgulho do arroz (*Echinocnemus squameus*), gorgulho do algodão (*Anthonomus grandis*), e percevejo caçador (*Sphenophorus venatus*); besouros *darkling* (*Tenebrionidae*) tal como lagarta amarelo (*Tenebrio molitor*), e besouro da farinha de trigo vermelho (*Tribolium castaneum*), besouros de folha (*Chrysomelidae*) tal como besouro da folha de arroz (*Oulema oryzae*), besouro das folhas da cucúrbita (*Aulacophora femoralis*), besouro de pulga listrado (*Phyllotreta striolata*), e besouro de batata do Colorado (*Leptinotarsa decemlineata*), besouros *dermestid* (*Dermestidae*) tal como besouro de carpete variado (*Anthrenus verbasci*), e besouro de pele de animal (*Dermestes maculatus*); besouros de velório (*Anobiidae*) tal como besouro de cigarro (*Lasioderma serricorne*); *Epilachna* tal como Joaninha de vinte e oito manchas (*Epilachna vigintioctopunctata*); besouros de casca (*Scolitidae*) tal como besouro de pó de mourão (*Lyctus brunneus*), e besouro do broto do pinheiro (*Tomicus piniperda*); besouros de pó de mourão falsos (*Bostrichidae*); besouros aranha (*Ptinidae*); besouros de antena longa (*Cerambycidae*) tal como besouro longicórneo de manchas brancas (*Anoplophora malasiaca*); besouro de estalo (*Agriotes spp.*); *Paederus fuscipens*.

#### Ortópteros:

[00383] Gafanhoto Asiático (*Locusta migratoria*), grilo toupeira africano (*Gryllotalpa africana*), gafanhoto do arroz (*Oxya yezoensis*), gafanhoto do arroz (*Oxya japonica*), Gryllidae.

#### Himenópteros:

[00384] Formigas (Formicidae) tal como formiga do faraó (*Monomorium pharaonis*), formiga negra (*Formica fusca japonica*), formiga de casa preta (*Ochetellus glaber*), *Pristomirmex pungens*, *Pheidole noda*, formiga cortante da folha (*Acromirmex spp.*), e formiga do fogo (*Solenopsis spp.*); vespões (*Vespidae*); vespas *bethylid*

(Betylidae); mosca serra (*Tentredinidae*) tal como mosca serra do Repolho (*Athalia rosae*), e *Athalia japonica*.

Blattodea:

[00385] Barata alemã (*Blattella germanica*), barata marrom enfumaçada (*Periplaneta fuliginosa*), barata americana (*Periplaneta americana*), *Periplaneta brunnea*, barata oriental (*Blatta orientalis*);

Ácaros:

[00386] Ácaros aranha (Tetranychidae) tais como ácaros aranha de duas manchas (*Tetranychus urticae*), ácaro aranha Kanzawa (*Tetranychus kanzawai*), ácaro vermelho das plantas cítricas (*Panonychus citri*), ácaro vermelho europeu (*Panonychus ulmi*), e *Oligonychus* spp.; ácaros eriophyid (*Eriophyidae*) tais como ácaro da ferrugem das plantas cítricas rosado (*Aculops pelekassi*), *Phyllocoptruta citri*, ácaro da ferrugem do tomate (*Aculops lycopersici*), ácaro do chá roxo (*Calacarus carinatus*), ácaro da ferrugem do chá rosado (*Acaphylla theavagran*), *Eriophyes chibaensis* e ácaro da ferrugem da maçã (*Aculus schlechtendali*); ácaros tarsonemid (*Tarsonemidae*) tal como ácaro largo (*Poliphagotarsonemus latus*); ácaros aranha falsos (*Tenuipalpidae*) tal como *Brevipalpus phoenicis*; *Tuckerellidae*; carrapatos (*Ixodidae*) tais como *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Dermacentor taiwanicus*, carrapato de cão americano (*Dermacentor variabilis*), *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, carrapato de perna preta (*Ixodes scapularis*), carrapato estrela solitário (*Amblyomma americanum*), *Boophilus microplus*, e *Rhipicephalus sanguineus*; *Psoroptidae* tais como ácaro de orelha (*Otodectes cynotis*); ácaros de coceira (*Sarcoptidae*) tal como *Sarcoptes scabiei*; ácaros de folicle (*Demodicidae*) tal como ácaro de folicle de cachorro (*Demodex canis*); ácaros acarídeos (*Acaridae*) tais como ácaros de mofo (*Tyrophagus putrescentiae*), e *Tyrophagus similis*; ácaros de poeira doméstica (*Pyroglyphidae*) tais como

Dermatophagoides farinae, e Dermatophagoides pteronyssinus; ácaros cheyletídeos (Cheyletidae) tais como Cheyletus eruditus, Cheyletus malaccensis, e Cheyletus moorei; ácaros parasitóides (Dermanyssidae) tal como ácaro de rato tropical (Ornithonyssus bacoti), ácaros de ave do norte (Ornithonyssus sylviarum), e ácaros vermelhos de ave doméstica (Dermanyssus gallinae); bichos-de-pé (Trombiculidae) tal como Leptotrombidium akamushi; aranhas (Araneae) tal como aranha de folhagem japonesa (Chiracantium japonicum), aranha de costas vermelha (Latrodectus hasseltii).

[00387] No método de controle da presente invenção, insetos nocivos hemípteros são mencionados como um artrópode nocivo que mostra um alto efeito do composto da presente invenção.

[00388] A composição da presente invenção pode ser usada em glebas cultivadas nas quais, "culturas" mostradas abaixo são cultivadas.

#### "Culturas"

[00389] Culturas agrícolas: milho, arroz, trigo, cevada, centeio, aveia, sorgo, algodão, soja, amendoim, sarrazina, beterraba açúcareira, semente de colza, girassol, cana de açúcar, tabaco;

[00390] Legumes: legumes Solanaceae (berinjela, tomate, pimenta verde, pimenta picante, batata), legumes Cucurbitaceae (pepino, abóbora, abobrinha, melancia, melão), legumes Cruciferae (rabanete japonês, nabo, raiz-forte, couve-rábano, repolho chinês, repolho, mostarda marrom, brócolis, couve-flor), legumes Compositae (bardana, crisântemo de guirlanda, alcachofra, alface), legumes Liliaceae (cebola galesa, cebola, alho, aspargos), legumes Umbelliferae (cenoura, salsa, aipo, pastinaca), legumes Chenopodiaceae (espinafre, acelga suíça), legumes Labiatae (manjerição japonês, hortelã, manjerição), morango, batata-doce, inhame, aroid;

[00391] Árvores frutíferas: frutas pomáceas (maçã, pêra comum, pêra japonesa, marmelo chinês, marmelo), frutas carnudas com caroço (pêssego, ameixa, nectarina, ameixa japonesa, cereja, abricó, ameixa seca), plantas cítricas (mandarim de Satsuma, laranja, limão, lima, toronja), noz (castanha, noz, avelã, amêndoa, pistache, noz de cajueiro, noz de macadâmia), frutas de bago (mirtilo, arando, amora-preta, framboesa), uva, fruto do diospireiro, azeitona, loquat, banana, café, tâmara, palma de coco, palma de óleo;

[00392] Árvores diferentes de árvores frutíferas: chá, amora, árvores de rua (árvore de freixo, bétula, corniso, eucalipto, ginkgo, lilás, árvore de bordo, carvalho, álamo, cercis, goma doce chinesa, plátano, zelkova, árvore-da-vida japonesa, árvore de abeto, cicuta japonesa, junípero agulha, pinheiro, espruce, teixo, olmo, castanha da índia), viburno doce, Podocarpus macrophyllus, cedro japonês, cipreste japonês, cróton, árvore com haste, hawthorn chinês.

[00393] Gramado: zoysia (grama de gramado japonês, grama mascarene), grama Bermuda (Cynodon dactylon), grama torcida (grama torcida rasteira, Agrostis stolonifera, Agrostis tenuis), capim-do-campo (capim-do-campo Kentucky, capim-do-campo áspero), festuca (festuca alta, festuca de mascar, festuca rasteira), azevém (joio, azevém perene), panasco, capim-rabo-de-rato;

[00394] Outros: flores (rosa, cravo, crisântemo, Eustoma grandiflorum Shinnery (genciana do campo), gipsófila, gérbera, cravo-de-defunto de vaso de flores, sálvia, petunia, verbena, tulipa, áster, genciana, flor-de-lis, amor perfeito, ciclâmen, orquídea, flor-de-lis do vale, alfazema, tronco, couve ornamental, primula, poinsetia, gladiolo, catleia, margarida, verbena, cimbídio, begônia), planta de folhagem; etc..

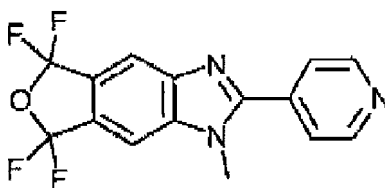
[00395] As "culturas" incluem culturas geneticamente modificadas.

### EXEMPLOS

[00396] A presente invenção também será descrita em detalhes abaixo por exemplos de produção, exemplos de preparação e exemplos de teste, porém a presente invenção não está limitada a estes exemplos.

#### Exemplo de Produção 1

[00397] Uma mistura de 0,59 g de 1,1,3,3-tetrafluoro-N-metil-1,3-dihidroisobenzofuran-5,6-diamina, 0,63 g de hidróxi-piridin-4-il-metanossulfonato de sódio e 5 ml de DMF foi agitada durante 1 hora, ao mesmo tempo que aquecendo a 120°C. Depois de resfriar em temperatura ambiente, uma solução aquosa de carbonato de hidrogênio de sódio saturada foi vertida, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. As camadas orgânicas combinadas foram secas em sulfato de magnésio, em seguida, concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,71 g de 5,5,7,7-tetrafluoro-1-metil-2-(piridin-4-il)-5,7-dihidro-1H-furo[3', 4': 4, 5]benzo[1,2-d]imidazol (em seguida, chamado Presente composto ativo 1).

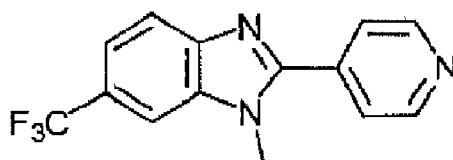


#### Presente composto ativo 1

[00398] <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ: 58,90-8,87 (m, 2 H), 8,08 (s, 1 H), 7,74-7,70 (m, 3 H), 4,03 (s, 3H)

#### Exemplo de Produção 2

[00399] 1-metil-2-(piridin-4-il)-6-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 2) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 1, usando N2-metil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina em vez de 1,1,3,3-tetrafluoro-N-metil-1,3-di-hidroisobenzofuran-5,6-diamina.

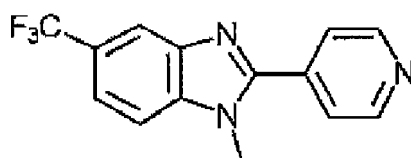


### Presente composto ativo 2

[00400]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,85 (dd,  $J = 4,4, 1,5$  Hz, 2 H), 7,93 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,75-7,71 (m, 3 H), 7,61 (dd,  $J = 8,7, 1,3$  Hz, 1 H), 3,99 (s, 3 H)

### Exemplo de Produção 3

[00401] 1-metil-2-(piridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 3) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 1, usando N1-metil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina em vez de 1,1,3,3-tetrafluoro-N-metil-1,3-di-hidroisobenzofuran-5,6-diamina.



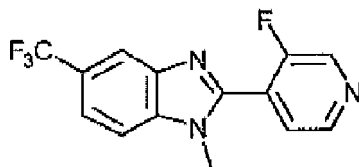
### Presente composto ativo 3

[00402]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,86-8,84 (m, 2 H), 8,14-8,13 (m, 1 H), 7,74-7,71 (m, 2 H), 7,66-7,62 (m, 1 H), 7,53 (d,  $J = 8,0$  Hz, 1 H), 3,98 (s, 3H)

### Exemplo de Produção 4

[00403] Uma mistura de 1,90 g de N1-metil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina, 1,49 g de 3-fluoropiridina-4-carbaldeído, 3,12 g de bissulfito de sódio e 20 ml de DMF foi agitada durante 1,5 hora, ao mesmo tempo que aquecendo a  $80^\circ\text{C}$ , em seguida, foi agitada durante 2 horas, ao mesmo tempo que aquecendo a  $120^\circ\text{C}$ . Depois de arrefecer em temperatura ambiente, uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada foi vertida, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. As camadas orgânicas combinadas foram secas em

sulfato de magnésio, em seguida concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 1,83 g de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 4).

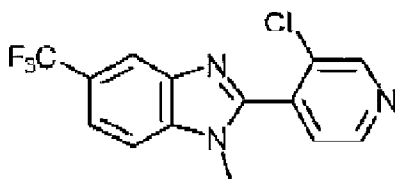


#### Presente composto ativo 4

[00404]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,73-8,71 (m, 1 H), 8,68-8,65 (m, 1 H), 8,15 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 7,72 (t,  $J = 5,4$  Hz, 1 H), 7,65 (dd,  $J = 8,7, 0,7$  Hz, 1 H), 7,56 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 3,85 (d,  $J = 2,9$  Hz, 3H)

#### Exemplo de Produção 5

[00405] 2-(3-cloropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 5) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 4, usando 3-cloropiridina-4-carbaldeído em vez de 3-fluoropiridina-4-carbaldeído.



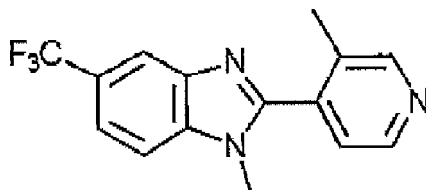
#### Presente composto ativo 5

[00406]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,83 (s, 1 H), 8,72 (dd,  $J = 4,8, 0,5$  Hz, 1 H), 8,15-8,13 (m, 1 H), 7,66 (dd,  $J = 8,6, 1,6$  Hz, 1 H), 7,57-7,53 (m, 2 H), 3,77 (s, 3H)

#### Exemplo de Produção 6

[00407] Uma mistura de 0,38 g de N1-metil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina, 0,33 g de ácido 3-metilisonicotínico, 0,46 g de WSC e 10 ml de piridina foi agitada durante 5 horas, ao mesmo tempo que aquecendo a  $120^\circ\text{C}$ .

[00408] Depois de arrefecer em temperatura ambiente, água foi vertida, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. As camadas orgânicas combinadas foram secas em sulfato de magnésio, em seguida, concentradas sob pressão reduzida. Ao resíduo foi adicionado uma mistura de 0,57 g de monohidrato de ácido p-toluenossulfônico e 10 ml de tolueno, e a mistura foi agitada durante 1 hora, ao mesmo tempo que aquecendo a 80°C, e agitada durante 2 horas, ao mesmo tempo que aquecendo a 120°C. Depois de arrefecer em temperatura ambiente, uma solução aquosa de carbonato de hidrogênio de sódio saturada foi vertida, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. As camadas orgânicas combinadas foram secas em sulfato de magnésio, em seguida, concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,48 g de 1-metil-2-(3-metilpiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 6).

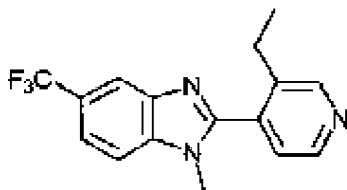


#### Presente composto ativo 6

[00409]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,70 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 8,64 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,13-8,12 (m, 1 H), 7,66-7,62 (m, 1 H), 7,54-7,51 (m, 1 H), 7,33 (d,  $J = 4,6$  Hz, 1 H), 3,72 (s, 3 H), 2,33 (s, 3H)

#### Exemplo de Produção 7

[00410] 2-(3-etilpiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 7) (0,47 g) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 6, usando ácido 3-etilisonicotínico em vez de ácido 3-metilisonicotínico.

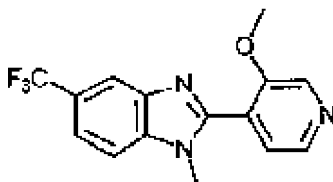


#### Presente composto ativo 7

[00411]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,73 (s, 1 H), 8,64 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,13-8,12 (m, 1 H), 7,66-7,62 (m, 1 H), 7,52 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,29 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 3,70 (s, 3 H), 2,69 (q,  $J = 7,6$  Hz, 2 H), 1,13 (t,  $J = 7,6$  Hz, 3H)

#### Exemplo de Produção 8

[00412] Em uma mistura de 0,30 g de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e 10 ml de DMF foi adicionado 0,16 g de metóxido de sódio sob resfriamento com gelo, em seguida, a mistura foi aquecida em temperatura ambiente e agitada durante 1,5 hora. Uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada foi vertida, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. As camadas orgânicas combinadas foram secas em sulfato de magnésio, em seguida, concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,28 g de 2-(3-metoxipiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 8).



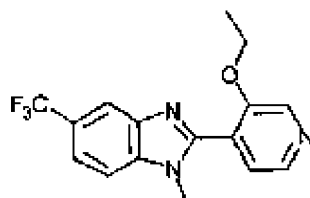
#### Presente composto ativo 8

[00413]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,53 (s, 1,0 H), 8,48 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1,0 H), 8,11 (s, 1,0 H), 7,61 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1,0 H), 7,53 (d,  $J = 4,6$  Hz, 1,0 H), 7,51 (d,  $J = 8,9$  Hz, 1,0 H), 3,98 (s, 3,0 H), 3,73 (s, 3,0 H)

#### Exemplo de Produção 9

[00414] 2-(3-etoxipiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol

(em seguida, chamado presente composto ativo 9) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 8, usando etóxido de sódio em vez de metóxido de sódio.

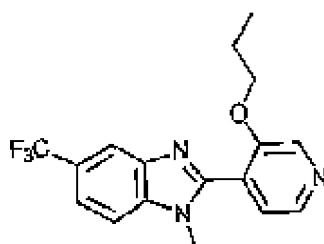


#### Presente composto ativo 9

[00415]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,50 (s, 1 H), 8,45 (d,  $J = 4,6$  Hz, 1 H), 8,12-8,11 (m, 1 H), 7,62 (dd,  $J = 8,5, 1,5$  Hz, 1 H), 7,54 (d,  $J = 4,6$  Hz, 1 H), 7,52 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 4,24 (q,  $J = 7,0$  Hz, 2 H), 3,75 (s, 3 H), 1,37 (t,  $J = 7,0$  Hz, 3H)

#### Exemplo de Produção 10

[00416] Em uma mistura de 0,36 g de 1-propanol e 6 ml de DMF foi adicionado 0,24 g de 60% hidreto de sódio (oleoso) sob resfriamento com gelo, e a mistura foi agitada durante 10 minutos. 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (0,35 g) foi adicionado, em seguida, a mistura foi aquecida em temperatura ambiente e também agitada durante 1 hora. Uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada foi vertida, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. As camadas orgânicas combinadas foram secas em sulfato de magnésio, em seguida, concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,36 g de 1-metil-2-(3-propoxipiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 10).

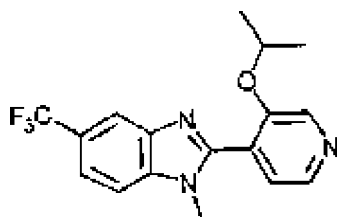


#### Presente composto ativo 10

[00417]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,51 (s, 1 H), 8,45 (d,  $J = 4,7$ , 1 H), 8,11 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 7,62 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 7,54 (d,  $J = 4,7$  Hz, 1 H), 7,52 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 4,11 (t,  $J = 6,6$  Hz, 2 H), 3,74 (d,  $J = 0,7$  Hz, 3 H), 1,80-1,69 (m, 2 H), 0,91 (t,  $J = 7,2$  Hz, 3H)

#### Exemplo de Produção 11

[00418] 2-(3-isopropoxipiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 11) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-propanol em vez de 1-propanol.

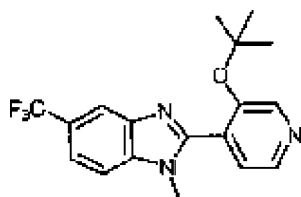


#### Presente composto ativo 11

[00419]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,51 (s, 1 H), 8,43 (dd,  $J = 4,8$ , 1,6 Hz, 1 H), 8,12 (s, 1 H), 7,62 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,55 (dd,  $J = 4,8$ , 1,3 Hz, 1 H), 7,52 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 4,72-4,64 (m, 1 H), 3,75 (d,  $J = 2,0$  Hz, 3 H), 1,29 (dd,  $J = 6,1$ , 1,7 Hz, 6H)

#### Exemplo de Produção 12

[00420] 2-(3-terc-butoxipiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 12) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando álcool terc-butílico em vez de 1-propanol.



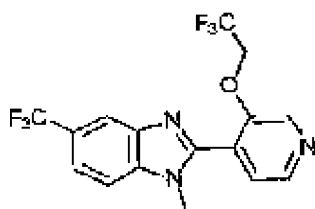
#### Presente composto ativo 12

[00421]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,58 (s, 1 H), 8,54 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,13-8,10 (m, 1 H), 7,64-7,59 (m, 2 H), 7,53 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 3,77

(s, 3 H), 1,12 (s, J = 4,8, 1,6 Hz, 9H)

### Exemplo de Produção 13

[00422] 1-metil-2-[3-(2,2,2-trifluoroetóxi)-piridin-4-il]-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 13) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2,2,2-trifluoroetanol em vez de 1-propanol.

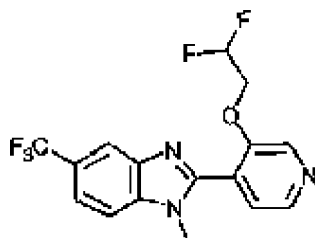


### Presente composto ativo 13

[00423]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,59 (d, J = 4,6 Hz, 1 H), 8,55 (s, 1 H), 8,12 (s, 1 H), 7,66-7,60 (m, 2 H), 7,54 (d, J = 8,5 Hz, 1 H), 4,47 (q, J = 7,9 Hz, 2 H), 3,76 (s, 3H)

### Exemplo de Produção 14

[00424] 2-[3-(2,2-difluoroetóxi)-piridin-4-il]-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 14) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2,2-difluoroetanol em vez de 1-propanol.



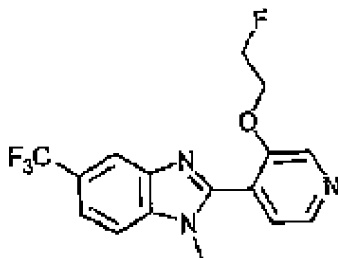
### Presente composto ativo 14

[00425]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,56 (d, J = 4,6 Hz, 1 H), 8,52 (s, 1 H), 8,13-8,11 (m, 1 H), 7,66-7,62 (m, 1 H), 7,60 (d, J = 4,6 Hz, 1 H), 7,54 (d, J = 8,0 Hz, 1 H), 5,97 (tt, J = 54,7, 3,9 Hz, 1 H), 4,37 (td, J = 13,0, 3,9 Hz, 2 H), 3,75 (s, 3H)

### Exemplo de Produção 15

[00426] 2-[3-(2-fluoroetóxi)-piridin-4-il]-1-metil-5-trifluorometil-1H-

benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 15) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-fluoroetanol em vez de 1-propanol.

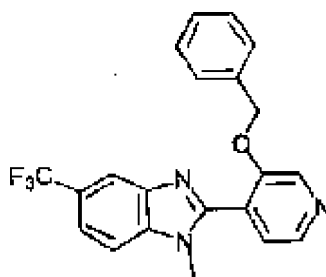


#### Presente composto ativo 15

[00427]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,52 (s, 1 H), 8,50 (s, 1 H), 8,13-8,10 (m, 1 H), 7,63 (dd,  $J = 8,5, 1,4$  Hz, 1 H), 7,60 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 7,53 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 4,75-4,60 (m, 2 H), 4,44-4,33 (m, 2 H), 3,76 (s, 3H)

#### Exemplo de Produção 16

[00428] 2-(3-benziloxipiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 16) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando álcool benzílico em vez de 1-propanol.



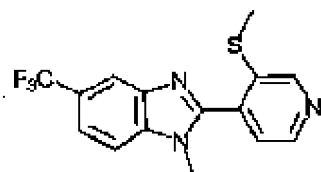
#### Presente composto ativo 16

[00429]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,58 (s, 1 H), 8,47 (d,  $J = 4,6$  Hz, 1 H), 8,12 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 7,60 (dd,  $J = 8,5, 1,5$  Hz, 1 H), 7,57 (d,  $J = 4,6$  Hz, 1 H), 7,46 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,32-7,22 (m, 5 H), 5,21 (s, 2 H), 3,69 (s, 3H)

#### Exemplo de Produção 17

[00430] 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 17) foi

obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 8, usando sal de sódio de metil mercaptano em vez de metóxido de sódio.

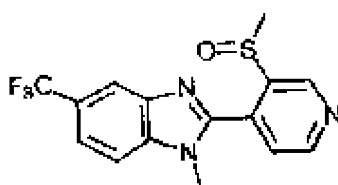


#### Presente composto ativo 17

[00431]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,70 (s, 1 H), 8,60 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,15-8,13 (m, 1 H), 7,64 (dd,  $J = 8,5, 1,7$  Hz, 1 H), 8,53 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 8,38 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,74 (s, 3 H), 2,47 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 18

[00432] Em uma mistura de 0,49 g de 1-metil-2-(3-metiltiopiridina-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol, 5 ml de metanol e 10 ml de água foi adicionado 0,65 g de periodato de sódio sob resfriamento com gelo, em seguida, a mistura foi agitada durante 1 hora a 40°C. Depois de arrefecer em temperatura ambiente, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução aquosa de tiosulfato de sódio saturada foram vertidas, e a mistura foi extraída três vezes com clorofórmio. As camadas orgânicas combinadas foram secas em sulfato de magnésio, em seguida, concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,48 g de 2-(3-metanossulfinilpiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 18).



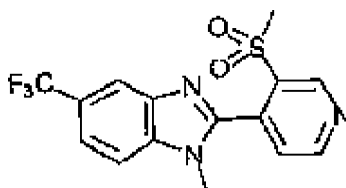
#### Presente composto ativo 18

[00433]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,51 (s, 1 H), 8,96 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H),

8,14-8,12 (m, 1 H), 7,68 (dd,  $J = 8,8, 1,3$  Hz, 1 H), 7,57 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,48 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,91 (s, 3 H), 3,18 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 19

[00434] Em uma mistura de 0,60 g de 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e 9 ml de clorofórmio foi adicionado 1,40 g de ácido m-cloroperbenzoico a 69% sob resfriamento com gelo, em seguida, a mistura foi agitada durante 2 horas em temperatura ambiente. Depois disso, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução aquosa de tiosulfato de sódio saturada foram vertidas, e a mistura foi extraída três vezes com clorofórmio. As camadas orgânicas combinadas foram secas em sulfato de magnésio, em seguida, concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,52 g de 2-(3-metanossulfonilpiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 19).

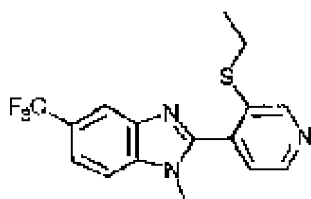


#### Presente composto ativo 19

[00435]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,45 (s, 1 H), 9,09 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,08 (s, 1 H), 7,66 (d,  $J = 8,2$  Hz, 1 H), 7,55 (d,  $J = 8,2$  Hz, 1 H), 7,51 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,68 (s, 3 H), 3,34 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 20

[00436] 2-(3-etiltiopiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 20) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 8, usando sal de sódio de etil mercaptano em vez de metóxido de sódio.

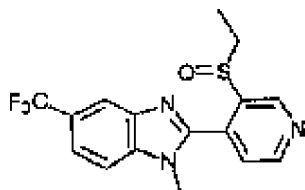


#### Presente composto ativo 20

[00437]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,76 (s, 1 H), 8,62 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,14-8,12 (m, 1 H), 7,65-7,62 (m, 1 H), 7,53 (dd,  $J = 8,7, 0,5$  Hz, 1 H), 7,41 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,72 (d,  $J = 0,5$  Hz, 3 H), 2,87 (q,  $J = 7,2$  Hz, 2 H), 1,23 (t,  $J = 7,2$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 21

[00438] 2-(3-etanossulfinilpiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 21) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 18, usando 2-(3-etiltiopiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol em vez de 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.



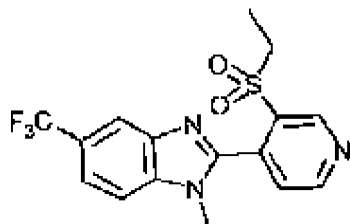
#### Presente composto ativo 21

[00439]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,40 (s, 1 H), 8,95 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,12-8,10 (m, 1 H), 7,68 (dd,  $J = 8,8, 1,3$  Hz, 1 H), 7,57 (d,  $J = 8,8$  Hz, 1 H), 7,49 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 3,89 (s, 3 H), 3,56-3,46 (m, 1 H), 3,21-3,10 (m, 1 H), 1,39 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 22

[00440] 2-(3-etanossulfonilpiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 22) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 19, usando 2-(3-etiltiopiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol

em vez de 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.

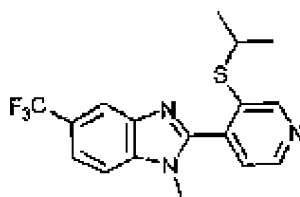


#### Presente composto ativo 22

[00441]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,38 (s, 1 H), 9,08 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,09-8,06 (m, 1 H), 7,66 (dd,  $J = 8,4, 1,3$  Hz, 1 H), 7,54 (d,  $J = 8,4$  Hz, 1 H), 7,51 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 3,67 (s, 3 H), 3,45 (q,  $J = 7,4$  Hz, 2 H), 1,29 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 23

[00442] 2-(3-isopropiltiopiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 23) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-propanotiol em vez de 1-propanol.



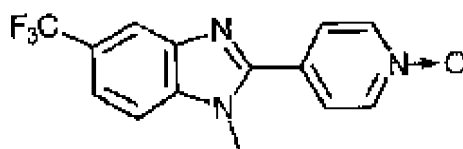
#### Presente composto ativo 23

[00443]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,83 (s, 1 H), 8,66 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,14-8,11 (m, 1 H), 7,64 (dd,  $J = 8,4, 1,3$  Hz, 1 H), 7,53 (d,  $J = 8,4$  Hz, 1 H), 7,45 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,70 (s, 3 H), 3,31 (sep,  $J = 6,7$  Hz, 1 H), 1,17 (d,  $J = 6,7$  Hz, 6H)

#### Exemplo de Produção 24

[00444] Em uma mistura de 0,42 g de 1-metil-2-(piridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e 8 ml de clorofórmio foi adicionado 0,52 g de ácido m-cloroperbenzoico a 69%, em seguida, a mistura foi agitada durante 2 horas, ao mesmo tempo que aquecendo a  $60^\circ\text{C}$ .

Depois de arrefecer em temperatura ambiente, à mistura reacional foi adicionado uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturado, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,36 g de 1-metil-2-(1-oxipiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 24).

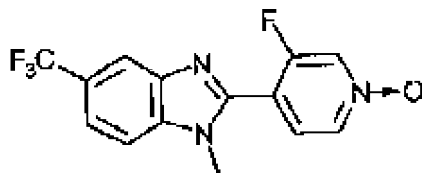


#### Presente composto ativo 24

[00445]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,35 (dd,  $J = 5,3, 1,9$  Hz, 2 H), 8,11 (s, 1 H), 7,80-7,77 (m, 2 H), 7,64-(dd,  $J = 8,5, 1,4$  Hz, 1 H), 7,52 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 4,00 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 25

[00446] 2-(3-fluoro-1-oxipiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 25) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 24, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol em vez de 1-metil-2-(piridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.



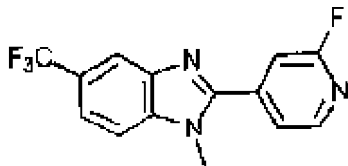
#### Presente composto ativo 25

[00447]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,31 (dd,  $J = 5,4, 1,6$  Hz, 1 H), 8,22-8,19 (m, 1 H), 8,13-8,11 (m, 1 H), 7,72 (dd,  $J = 8,3, 6,9$  Hz, 1 H), 7,67-7,63 (m, 1 H), 7,55 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 3,86 (d,  $J = 2,7$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 26

[00448] 2-(2-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-

benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 26) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 4, usando 2-fluoropiridina-4-carbaldeído em vez de 3-fluoropiridina-4-carbaldeído.

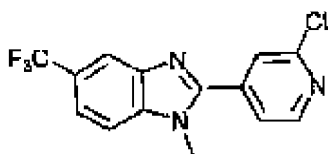


#### Presente composto ativo 26

[00449]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,45 (dd,  $J = 5,1, 0,7$  Hz, 1 H), 8,14 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 7,67-7,63 (m, 2 H), 7,54 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,40-7,38 (m, 1 H), 4,00 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 27

[00450] 2-(2-cloropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 27) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 4, usando 2-cloropiridina-4-carbaldeído em vez de 3-fluoropiridina-4-carbaldeído.



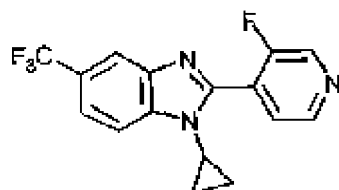
#### Presente composto ativo 27

[00451]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,61 (dd,  $J = 5,1, 0,7$  Hz, 1 H), 8,13 (t,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 7,79 (dd,  $J = 1,5, 0,7$  Hz, 1 H), 7,66 (dd,  $J = 5,1, 1,5$  Hz, 1 H), 7,64 (d,  $J = 1,0$  Hz, 1 H), 7,54 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 3,99 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 28

[00452] 1-ciclopropil-2-(3-fluoropiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 28) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 6, usando N-1-ciclopropil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina em vez de N-1-metil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina e usando ácido 3-

fluoroisonicotínico em vez de ácido 3-metilisonicotínico.

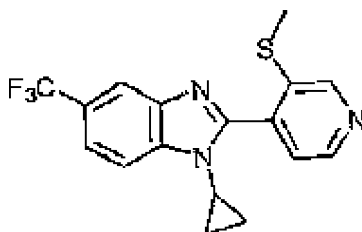


#### Presente composto ativo 28

[00453]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,70 (d,  $J = 2,0$  Hz, 1 H), 8,64 (dd,  $J = 4,9$ , 1,0 Hz, 1 H), 8,12-8,11 (m, 1 H), 7,76-7,70 (m, 2 H), 7,63 (dd,  $J = 8,7$ , 1,3 Hz, 1 H), 3,67-3,59 (m, 1 H), 1,13-1,06 (m, 2 H), 0,74-0,67 (m, 2H)

#### Exemplo de Produção 29

[00454] 1-ciclopropil-2-(3-metilpiridina-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 29) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 4, usando 1-ciclopropil-2-(3-fluoropiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando sal de sódio de metil mercaptano em vez de metóxido de sódio.



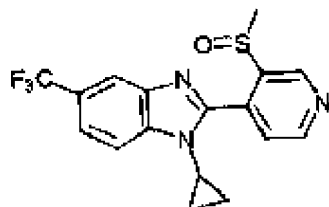
#### Presente composto ativo 29

[00455]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,70 (s, 1 H), 59 (dd,  $J = 4,8$ , 0,5 Hz, 1 H), 8,13-8,10 (m, 1 H), 7,73 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,64-7,60 (m, 1 H), 7,40 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,57-3,50 (m, 1 H), 2,49 (s, 3 H), 1,03-0,96 (m, 2 H), 0,76-0,70 (m, 2H)

#### Exemplo de Produção 30

[00456] 1-ciclopropil-2-(3-metanossulfonilpiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 30)

foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 18, usando 1-ciclopropil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol em vez de 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.

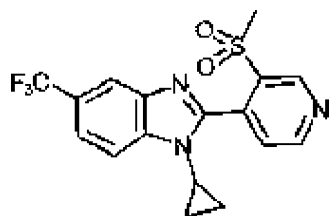


#### Presente composto ativo 30

[00457]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,52 (s, 1 H), 8,94 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,09 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 7,76 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 7,72 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 7,66 (dd,  $J = 8,6, 1,6$  Hz, 1 H), 3,63-3,57 (m, 1 H), 3,21 (s, 3 H), 1,34-1,23 (m, 1 H), 1,14-1,05 (m, 1 H), 1,01-0,93 (m, 1 H), 0,67-0,59 (m, 1H)

#### Exemplo de Produção 31

[00458] 1-ciclopropil-2-(3-metanossulfonilpiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 31) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 19, usando 1-ciclopropil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol em vez de 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.

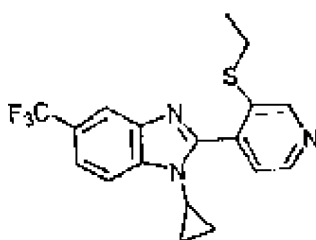


#### Presente composto ativo 31

[00459]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,45 (s, 1 H), 9,06 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,06-8,04 (m, 1 H), 7,75 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 7,66-7,62 (m, 1 H), 7,56 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,50 (s, 3 H), 3,43-3,37 (m, 1 H), 0,97-0,93 (m, 4H)

#### Exemplo de Produção 32

[00460] 1-ciclopropil-2-(3-etiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 32) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 4, usando 1-ciclopropil-2-(3-fluoropiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando sal de sódio de etil mercaptano em vez de metóxido de sódio.

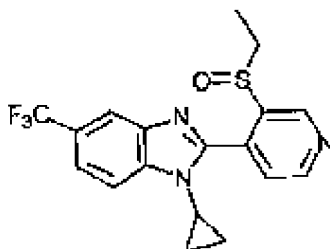


#### Presente composto ativo 32

[00461] <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8,77 (s, 1 H), 8,61 (d, J = 4,8 Hz, 1 H), 8,12-8,09 (m, 1 H), 7,73 (d, J = 8,7 Hz, 1 H), 7,62 (dd, J = 8,7, 1,6 Hz, 1 H), 7,42 (d, J = 4,8 Hz, 1 H), 3,58-3,52 (m, 1 H), 2,90 (q, J = 7,4 Hz, 2 H), 1,23 (t, J = 7,4 Hz, 3 H), 0,98 (dd, J = 12,8, 7,0 Hz, 2 H), 0,74-0,67 (m, 2H)

#### Exemplo de Produção 33

[00462] 1-ciclopropil-2-(3-etanosulfonilpiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 33) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 18, usando 1-ciclopropil-2-(3-etiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol em vez de 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.

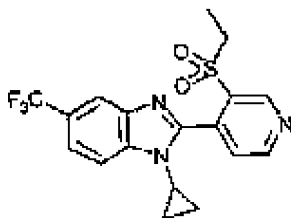


Presente composto ativo 33

[00463]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,41 (s, 1 H), 8,93 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,08 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 7,77-7,74 (m, 1 H), 7,71 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 7,68-7,64 (m, 1 H), 3,64-3,53 (m, 2 H), 3,24-3,14 (m, 1 H), 1,43 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H), 1,32-1,23 (m, 1 H), 1,13-1,05 (m, 1 H), 0,97-0,89 (m, 1 H), 0,67-0,60 (m, 1H)

Exemplo de Produção 34

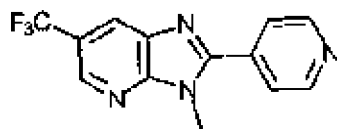
[00464] 1-ciclopropil-2-(3-etanossulfonilpiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 34) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 19, usando 1-ciclopropil-2-(3-etiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol em vez de 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.

Presente composto ativo 34

[00465]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,38 (s, 1 H), 9,05 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,05-8,03 (m, 1 H), 7,74 (dd,  $J = 8,5, 0,5$  Hz, 1 H), 7,65-7,62 (m, 1 H), 7,56 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,65 (q,  $J = 7,4$  Hz, 2 H), 3,43-3,36 (m, 1 H), 1,33 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H), 0,97-0,92 (m, 4H)

Exemplo de Produção 35

[00466] 3-metil-2-(piridin-4-il)-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 35) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 1, usando N2-metil-5-trifluorometilpiridina-2,3-diamina em vez de 1,1,3, 3-tetrafluoro-N-metil-1,3-di-hidroisobenzofuran-5,6-diamina.

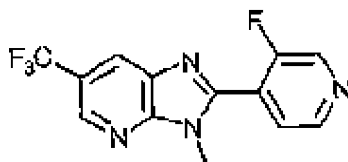


#### Presente composto ativo 35

[00467]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,88 (dd,  $J = 4,5, 1,7$  Hz, 2 H), 8,75 (d,  $J = 1,9$  Hz, 1 H), 8,35 (d,  $J = 1,9$  Hz, 1 H), 7,79 (dd,  $J = 4,5, 1,7$  Hz, 2 H), 4,09 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 36

[00468] Uma mistura de 5,51 g de N2-metil-5-trifluorometilpiridina2,3-diamina, 6,10 g de ácido 3-fluoroisonicotínico, 8,28 g de WSC e 58 ml de piridina foi agitada durante 3 horas, ao mesmo tempo que aquecendo a  $120^\circ\text{C}$ . Depois de arrefecer em temperatura ambiente, água foi vertida, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. As camadas orgânicas combinadas foram secas em sulfato de magnésio, em seguida, concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 6,77 g de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 36).



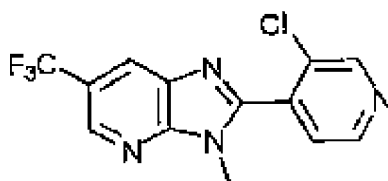
#### Presente composto ativo 36

[00469]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,77 (s, 1 H), 8,76 (s, 1 H), 8,69 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,37 (s, 1 H), 7,72-7,71 (m, 1 H), 3,94 (d,  $J = 2,7$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 37

[00470] 2-(3-cloropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 37) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 36, usando ácido 3-cloroisonicotínico em vez de ácido 3-

fluoroisonicotínico.

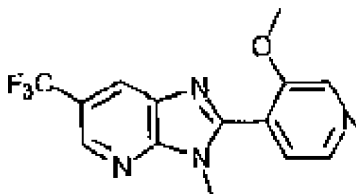


#### Presente composto ativo 37

[00471]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,86 (s, 1 H), 8,78-8,76 (m, 1 H), 8,74 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,37 (t,  $J = 1,0$  Hz, 1 H), 7,54 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 3,85 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 38

[00472] 2-(3-metoxipiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b] piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 38) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 8, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.



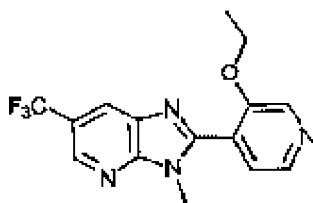
#### Presente composto ativo 38

[00473]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,73 (d,  $J = 1,9$  Hz, 1 H), 8,56 (s, 1 H), 8,50 (d,  $J = 4,7$  Hz, 1 H), 8,33 (d,  $J = 1,9$  Hz, 1 H), 7,53 (d,  $J = 4,7$  Hz, 1 H), 4,40 (s, 3 H), 3,82 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 39

[00474] 2-(3-etoxipiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 39) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 8, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-

benzimidazol e usando etóxido de sódio em vez de metóxido de sódio.

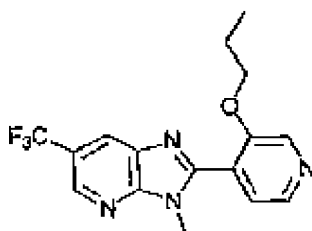


#### Presente composto ativo 39

[00475]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,73 (d,  $J = 1,3$  Hz, 1 H), 8,57 (s, 1 H), 8,47 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,33 (d,  $J = 1,3$  Hz, 1 H), 7,54 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1H)-, 4,27 (q,  $J = 7,0$  Hz, 2 H), 3,84 (s, 3 H), 1,38 (t,  $J = 7,0$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 40

[00476] 3-metil-2-(3-propoxipiridin-4-il)-6-trifluoroxnetil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 40) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.



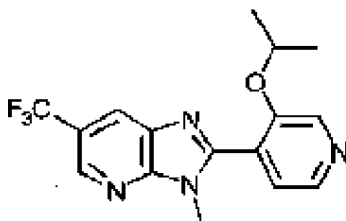
#### Presente composto ativo 40

[00477]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,74-8,72 (m, 1 H), 8,54 (s, 1 H), 8,47 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,34-8,32 (m, 1 H), 7,53 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 4,14 (t,  $J = 6,8$  Hz, 2 H), 3,83 (s, 3 H), 1,81-1,71 (m, 2 H), 0,92 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 41

[00478] 2-(3-isopropoxipiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 41) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-

imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando 2-propanol em vez de 1-propanol.

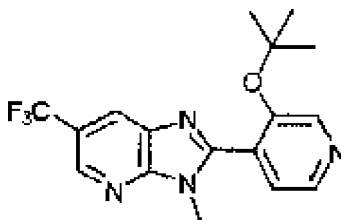


#### Presente composto ativo 41

[00479]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,74-8,72 (m, 1 H), 8,53 (s, 1 H), 8,44 (d,  $J = 4,6$  Hz, 1 H), 8,34-8,32 (m, 1 H), 7,54 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 4,78-4,72 (m, 1 H), 3,84 (s, 3 H), 1,32 (s, 3 H), 1,31 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 42

[00480] 2-(3-terc-butoxipiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 42) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridina-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando álcool terc-butílico em vez de 1-propanol.



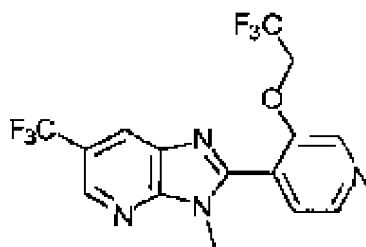
#### Presente composto ativo 42

[00481]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,75-8,72 (m, 1 H), 8,61 (s, 1 H), 8,56 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,35-8,32 (m, 1 H), 7,60 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,87 (s, 3 H), 1,15 (s, 9H)

#### Exemplo de Produção 43

[00482] 3-metil-2-[3-(2,2,2-trifluoroetóxi)-piridin-4-il]-6-trifluorometil-

3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 43) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando 2,2,2-trifluoroetanol em vez de 1-propanol.

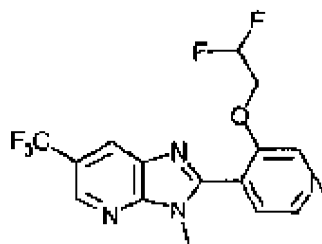


#### Presente composto ativo 43

[00483]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,76 (d,  $J = 1,9$  Hz, 1 H), 8,62 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,57 (s, 1 H), 8,35 (d,  $J = 1,9$  Hz, 1 H), 7,61 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 4,52 (q,  $J = 7,9$  Hz, 2 H), 3,85 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 44

[00484] 2-[3-(2,2-difluoroetóxi)-piridin-4-il]-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 44) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando 2,2-difluoroetanol em vez de 1-propanol.



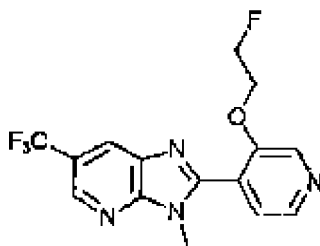
#### Presente composto ativo 44

[00485]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,76-8,74 (m, 1 H), 58 (d,  $J = 4,6$  Hz, 1

H), 8,55 (s, 1 H), 8,34-8,33 (m, 1 H), 7,58 (d, J = 4,9 Hz, 1 H), 5,98 (tt, J = 54,6, 3,8 Hz, 1 H), 4,38 (td, J = 12,9, 3,8 Hz, 2 H), 3,84 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 45

[00486] 2-[3-(2-fluoroetóxi)-piridin-4-il]-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 45) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando 2-fluoroetanol em vez de 1-propanol.

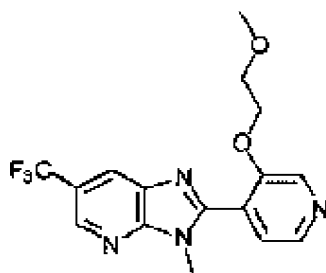


#### Presente composto ativo 45

[00487] <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8,76-8,73 (m, 1 H), 8,54 (t, J = 4,8 Hz, 2 H), 8,34-8,32 (m, 1 H), 7,58 (dd, J = 4,8, 0,6 Hz, 1 H), 4,76-4,73 (m, 1 H), 4,64-4,61 (m, 1 H), 4,47-4,44 (m, 1 H), 4,41-4,37 (m, 1 H), 3,86 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 46

[00488] 2-[3-(2-metoxietóxi)-piridin-4-il]-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado composto 46) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando 2-metoxietanol em vez de 1-propanol.

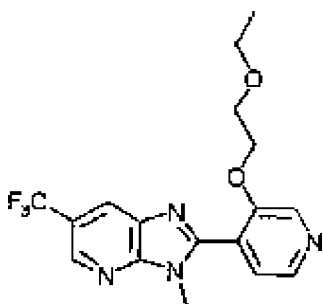


#### Presente composto ativo 46

[00489]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,74-8,72 (m, 1 H), 8,56 (s, 1 H), 8,49 (d,  $J = 4,3$  Hz, 1 H), 8,34-8,32 (m, 1 H), 7,56 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 4,33-4,29 (m, 2 H), 3,87 (s, 3 H), 3,67-3,64 (m, 2 H), 3,32 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 47

[00490] 2-[3-(2-etoxietóxi)-piridin-4-il]-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 47) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando 2-etoxietanol em vez de 1-propanol.

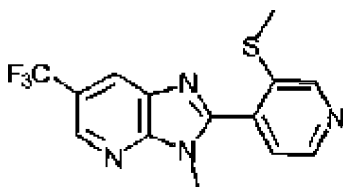


#### Presente composto ativo 47

[00491]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,74-8,72 (m, 1 H), 8,56 (s, 1 H), 8,49 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,33-8,31 (m, 1 H), 7,56 (d,  $J = 4,6$  Hz, 1 H), 4,34-4,29 (m, 2 H), 3,88 (s, 3 H), 3,71-3,66 (m, 2 H), 3,45 (q,  $J = 7,0$  Hz, 2 H), 1,14 (t,  $J = 7,0$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 48

[00492] 3-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 48) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 8, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando sal de sódio de metil mercaptano em vez de metóxido de sódio.

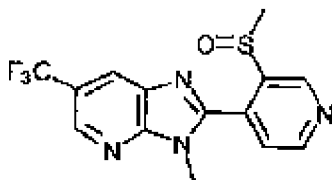


#### Presente composto ativo 48

[00493]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,75 (d,  $J = 1,4$ , 1 H), 8,73 (s, 1 H), 8,62 (d,  $J = 4,9$ , 1 H), 8,36 (d,  $J = 1,4$ , 1 H), 7,37 (d,  $J = 4,9$ , 1 H), 3,82 (s, 3 H), 2,51 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 49

[00494] 2-(3-metanossulfonilpiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 49) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 18, usando 3-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.

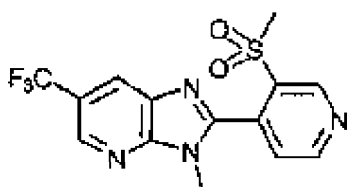


#### Presente composto ativo 49

[00495]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,55 (s, 1 H), 9,00 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,80-8,79 (m, 1 H), 8,38-8,37 (m, 1 H), 7,55 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 4,02 (s, 3 H), 3,20 (s, 3 H)

Exemplo de Produção 50

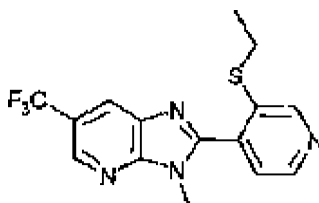
[00496] 2-(3-metanossulfonilpiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 50) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 19, usando 3-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.

Presente composto ativo 50

[00497]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,47 (s, 1 H), 9,12 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,79-8,77 (m, 1 H), 8,32-8,31 (m, 1 H), 7,52 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,77 (s, 3 H), 3,36 (s, 3 H)

Exemplo de Produção 51

[00498] 2-(3-etiltiopiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 51) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 8, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando sal de sódio de etil mercaptano em vez de metóxido de sódio.

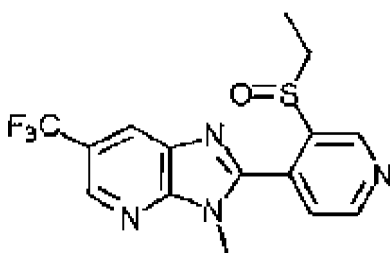
Presente composto ativo 51

[00499]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,79 (s, 1 H), 8,76-8,75 (m, 1 H), 8,65 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,35 (d,  $J = 2,0$  Hz, 1 H), 7,40 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz,

1 H), 3,81 (s, 3 H), 2,92 (q, J = 7,4 Hz, 2 H), 1,26 (t, J = 7,4 Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 52

[00500] 2-(3-etanossulfonilpiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 52) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 18, usando 2-(3-etiltiopiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.

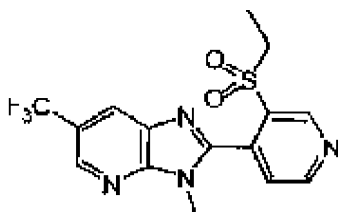


#### Presente composto ativo 52

[00501] <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ: 9,43 (s, 1 H), 8,98 (dd, J=5,1, 0,7 Hz, 1 H), 8,81-8,78 (m, 1 H), 8,37-8,34 (m, 1 H), 7,55 (d, J = 5,1 Hz, 1 H), 4,00 (s, 3 H), 3,58-3,48 (m, 1 H), 3,24-3,13 (m, 1 H), 1,42 (t, J = 7,5 Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 53

[00502] 2-(3-etanossulfonilpiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo [4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 53) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 19, usando 2-(3-etiltiopiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 1-metil-2-(3-metiltiopiridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.



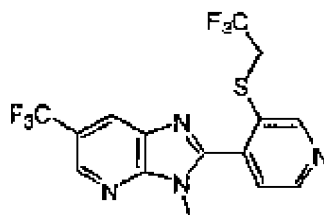
#### Presente composto ativo 53

[00503] <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ: 9,40 (s, 1 H), 9,11 (d, J = 4,9 Hz, 1 H),

8,79-8,76 (m, 1 H), 8,32-8,30 (m, 1 H), 7,52 (dd, J = 4,9, 0,7 Hz, 1 H), 3,76 (s, 3 H), 3,47 (q, J = 7,4 Hz, 2 H), 1,32 (t, J = 7,4 Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 54

[00504] 3-metil-2-[3-(2,2,2-trifluoroetiltio)piridin-4-il]-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 54) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 10, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol e usando 2,2,2-trifluoroetanotiol em vez de 1-propanol.

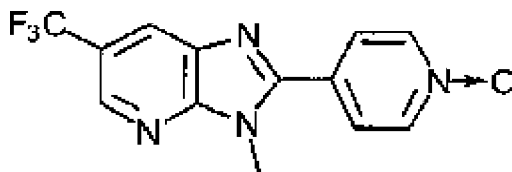


#### Presente composto ativo 54

[00505]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,01 (s, 1 H), 8,80 (d, J = 5,0 Hz, 1 H), 8,79-8,77 (m, 1 H), 8,38-8,36 (m, 1 H), 7,46 (d, J = 5,0 Hz, 1 H), 3,80 (s, 3 H), 3,42 (q, J = 9,5 Hz, 2H)

#### Exemplo de Produção 55

[00506] 3-metil-2-(1-oxipiridin-4-il)-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 55) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 24, usando 3-metil-2-(piridin-4-il)-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 1-metil-2-(piridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.



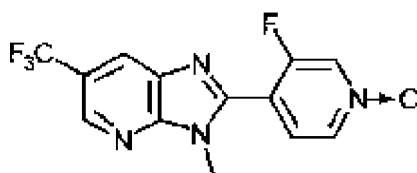
#### Presente composto ativo 55

[00507]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,74 (s, 1 H), 8,37 (d, J = 6,5 Hz, 2 H),

8,33 (s, 1 H), 7,88 (d, J = 6,5 Hz, 2 H), 4,12 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 56

[00508] 2-(3-fluorol-oxipiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 56) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 24, usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 1-metil-2-(piridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.



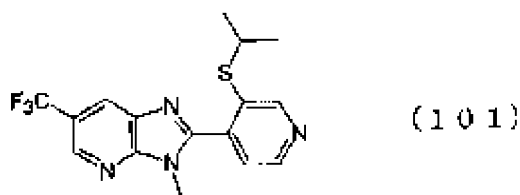
#### Presente composto ativo 56

[00509]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,77 (d, J = 1,2 Hz, 1 H), 8,35 (d, J = 2,0 Hz, 1 H), 8,33 (dd, J = 5,6, 1,7 Hz, 1 H), 8,24-8,20 (m, 1 H), 7,73 (dd, J = 8,5, 6,8 Hz, 1 H), 3,96 (d, J = 3,2 Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 101

[00510] Em uma mistura de 0,20 g do presente composto ativo 36, 20,08 g de propanotiol e 1 ml de DMF foi adicionado 0,08 g de hidreto de sódio a 60% (oleoso) sob resfriamento com água, e a mistura foi agitada durante 3 horas em temperatura ambiente. Depois disso, uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada foi vertida na mistura reacional, e a mistura foi extraída com t-butil metil éter.

[00511] A camada orgânica foi lavada sequencialmente com uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e uma solução aquosa de cloreto de sódio saturada, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O sólido resultante foi lavado com hexano, para obter 0,17 g de um composto de fórmula (101):



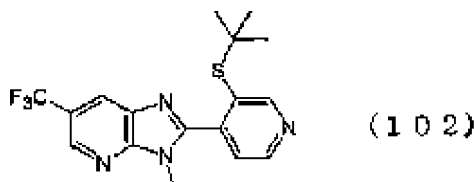
(em seguida, chamado presente composto ativo 101).

#### Presente composto ativo 101

[00512]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,85 (m, 1 H), 8,75 (m, 1 H), 8,68 (d, J = 4,9 Hz, 1 H), 8,34 (m, 1 H), 7,43 (dd, J = 4,9, 0,7 Hz, 1 H), 3,79 (s, 3 H), 3,40-3,33 (m, 1 H), 1,20 (d, J = 6,8 Hz, 6H).

#### Exemplo de Produção 102

[00513] Um composto (0,19 g) de fórmula (102):



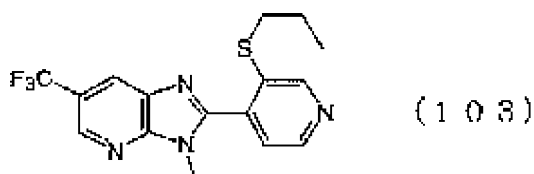
(em seguida, chamado presente composto ativo 102) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 101, usando 0,09 g de 2-metil-2-propanotiol em vez de 2-propanotiol.

#### Presente composto ativo 102

[00514]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,97 (m, 1 H), 8,81 (d, J = 4,9 Hz, 1 H), 8,75 (m, 1 H), 8,34 (m, 1 H), 7,55 (dd, J = 4,9, 0,7Hz), 3,76 (s, 3 H), 1,13 (s, 9H).

#### Exemplo de Produção 103

[00515] Um composto (0,22 g) de fórmula (103):



(em seguida, chamado presente composto ativo 103) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 101, usando 0,08 g de 1-propanotiol em vez de 2-propanotiol.

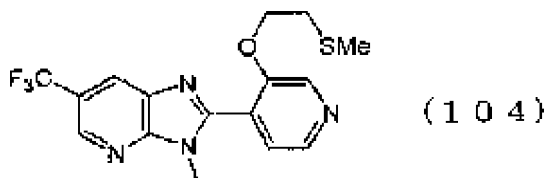
Presente composto ativo 103

[00516]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,79 (m, 1 H), 8,75 (m, 1 H), 8,64 (d, J = 4,9 Hz, 1 H), 8,35 (m, 1 H), 7,39 (dd, J = 4,9, 0,7 Hz), 3,81 (s, 3 H), 2,86 (t, J = 7,3 Hz, 2 H), 1,63-1,56 (m, 2 H), 0,94 (t, J = 7,3 Hz, 3 H).

Exemplo de Produção 104

[00517] Em uma mistura de 0,20 g do presente composto ativo 36, 0,09 g de 2-(metiltio)etanol e 1 ml de DMF, foi adicionado 0,04 g de hidreto de sódio a 60% (oleoso) sob resfriamento com gelo, e a mistura foi agitada durante 4 horas sob resfriamento com gelo. Depois disso, uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada foi vertida na mistura reacional, e a mistura foi extraída com t-butil metil éter.

[00518] A camada orgânica foi lavada sequencialmente com uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada e uma solução aquosa de cloreto de sódio saturada, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O sólido resultante foi lavado com hexano, para obter 0,22 g de um composto de fórmula (104):



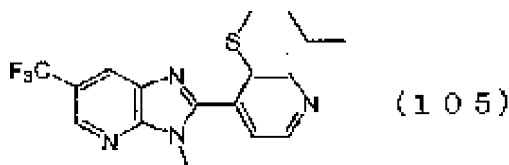
(em seguida, chamado presente composto ativo 104).

Presente composto ativo 104

[00519]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,73 (m, 1 H), 8,55 (s, 1 H), 8,50 (d, J = 4,9 Hz, 1 H), 8,32 (m, 1 H), 7,54 (d, J = 4,6 Hz, 1 H), 4,34 (t, J = 6,5 Hz, 2 H), 3,87 (s, 3 H), 2,79 (t, J = 6,6 Hz, 2 H), 2,01 (s, 3 H).

Exemplo de Produção 105

[00520] Um composto (0,23 g) de fórmula (105):



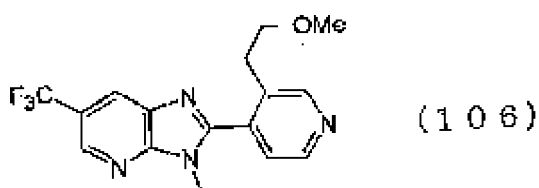
(em seguida, chamado presente composto ativo 105) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 101, usando 0,09 g de 1-butanotiol em vez de 2-propanotiol.

Presente composto ativo 105

[00521]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,78 (s, 1 H), 8,75 (m, H), 8,64 (d, J = 4,8 Hz, 1 H), 8,35 (m, 1 H), 7,39 (d, J = 4,8 Hz, 1 H), 3,81 (s, 3 H), 2,89 (t, J = 7,5 Hz, 2 H), 1,57-1,51 (m, 2 H), 1,39-1,30 (m, 2 H), 0,85 (t, J = 7,4 Hz, 3 H).

Exemplo de Produção 106

[00522] Em uma mistura de 0,18 g de ácido 3-metoxiisonicotínico e 2 ml de piridina, foram adicionados 0,32 g de WSC e 0,20 g de N2-metil-5-trifluorometilpiridina-2,3-diamina sequencialmente, e a mistura foi refluxada com aquecimento durante 6 horas. Depois disso, a esta mistura foi adicionado 0,20 g de WSC, e a mistura foi refluxada com aquecimento durante 4 horas. A mistura reacional foi permitida resfriar em temperatura ambiente, em seguida, água foi vertida, e a mistura foi extraída com t-butil metil éter. A camada orgânica foi lavada sequencialmente com água, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução aquosa de cloreto de sódio saturada, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em camada fina preparativa em sílica-gel para obter 0,15 g de um composto de fórmula (106):



(em seguida, chamado presente composto ativo 106).

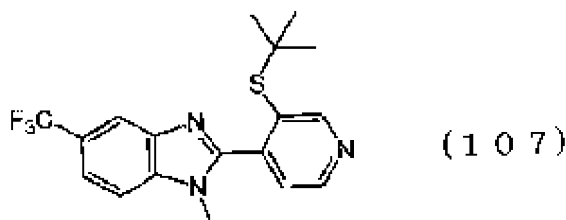
Presente composto ativo 106

[00523]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,90 (s, 1 H), 8,79 (d, J = 5,1 Hz, 1 H), 8,75 (m, 1 H), 8,34 (m, 1 H), 7,38 (d, J = 5,6 Hz, 1 H), 4,55 (s, 2 H),

3,80 (s, 3 H), 3,22 (s, 3 H).

#### Exemplo de Produção 107

[00524] Em uma mistura de 0,20 g do presente composto ativo 4, 0,09 g de 2-metil-2-propanotiol e 1 ml de DMF, foi adicionado 0,04 g de hidreto de sódio a 60% (oleoso) sob resfriamento com gelo, e a mistura foi agitada durante 2 horas sob resfriamento com gelo. Depois disso, a mistura foi aquecida em temperatura ambiente e agitada durante 1 hora. Na mistura reacional, foi vertido água sob resfriamento com gelo, e a mistura foi extraída com t-butil metil éter. A camada orgânica foi lavada sequencialmente com água e uma solução aquosa de cloreto de sódio saturada, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O sólido resultante foi lavado com hexano para obter 0,19 g de um composto de fórmula (107):



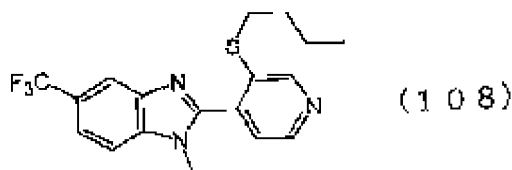
(em seguida, chamado presente composto ativo 107).

#### Presente composto ativo 107

[00525]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,94 (m, 1 H), 8,78 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,12 (m, 1 H), 7,64 (dd,  $J = 8,5, 1,5$  Hz, 1 H), 7,58 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 7,53 (d,  $J = 8,3$ Hz), 3,67 (s, 3 H), 1,11 (s, 9H).

#### Exemplo de Produção 108

[00526] Um composto (0,15 g) de fórmula (108):



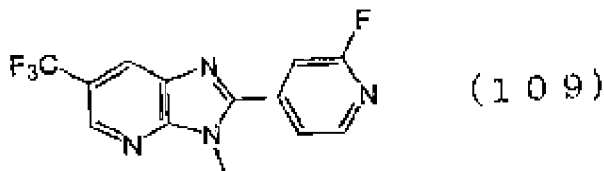
(em seguida, chamado presente composto ativo 108) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 107, usando 0,09 g de 1-butanotiol em vez de 2-metil-2-propanotiol.

Presente composto ativo 108

[00527]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,76 (s, 1 H), 8,61 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,13 (m, 1 H), 7,64 (dd,  $J = 8,4, 1,3$  Hz, 1 H), 7,53 (d,  $J = 8,3$  Hz, 1 H), 7,40 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 3,72 (s, 3 H), 2,84 (t,  $J = 7,4$  Hz, 2 H), 1,55-1,49 (m, 2 H), 1,37-1,28 (m, 2 H), 0,84 (t, 3H).

Exemplo de Produção 109

[00528] Em uma mistura de 1,00 g de N2-metil-5-trifluorometilpiridina-2,3-diamina, 0,78 g de ácido 2-fluoroisonicotínico e 5 ml de piridina foi adicionado 1,50 g de WSC, e a mistura foi refluxada com aquecimento durante 2 horas. A mistura reacional foi resfriada em temperatura ambiente, em seguida, água foi vertida. O cristal gerado foi filtrado, em seguida, lavado com água e seco sob pressão reduzida para obter 1,44 g de um composto de fórmula (109):



(em seguida, chamado presente composto ativo 109).

Presente composto ativo 109

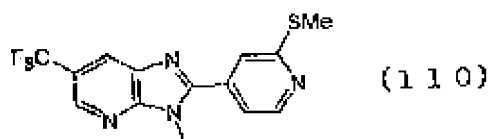
[00529]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,77-8,76 (m, 1 H), 8,49-8,48 (m, 1 H), 8,37-8,36 (1H, m), 7,72-7,70 (m, 1 H), 7,47-7,46 (m, 1 H), 4,11 (s, 3 H).

Exemplo de Produção 110

[00530] Em uma mistura de 0,70 g do presente composto ativo 109 e 2 ml de THF foi adicionado 0,18 g de sal de sódio de metil mercaptano sob resfriamento com gelo, e a mistura foi agitada durante 1 hora em temperatura ambiente. À mistura reacional foi adicionado 0,08 g de sal de sódio de metil mercaptano, e a mistura foi agitada durante 5 horas, depois disso, 2 ml de DMF foram adicionados, e a mistura foi agitada durante 1 hora, e água foi vertida sob resfriamento com gelo.

[00531] O cristal gerado foi filtrado, em seguida, lavado com água e

seco sob pressão reduzida, para obter 0,61 g de um composto de fórmula (110):



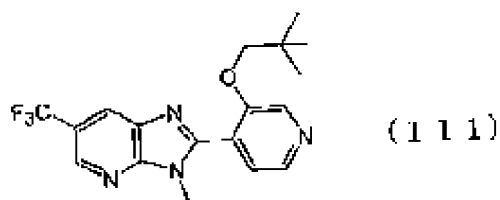
(em seguida, chamado presente composto ativo 110).

#### Presente composto ativo 110

[00532]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,74 (d,  $J = 1,2$  Hz, 1 H), 8,66 (dd,  $J = 5,1, 0,6$  Hz, 1 H), 8,34 (d,  $J = 1,2$  Hz, 1 H), 7,65 (dd,  $J = 1,5, 0,7$  Hz, 1 H), 7,42 (dd,  $J = 5,1, 1,5$  Hz, 1 H), 4,06 (s, 3 H), 2,65 (s, 3 H).

#### Exemplo de Produção 111

[00533] Um composto (0,17 g) de fórmula (111):



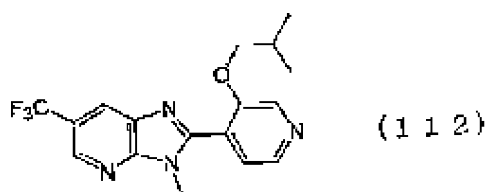
(em seguida, chamado presente composto ativo 111) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 104, usando 0,09 g de 2,2-dimetil-1-propanol em vez de 2-(metiltio)etanol.

#### Presente composto ativo 111

[00534]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,73 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 8,53 (s, 1 H), 8,47 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,33 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 7,49 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 3,83 (s, 3 H), 3,81 (s, 2 H), 0,85 (s, 9H).

#### Exemplo de Produção 112

[00535] Um composto (0,21 g) de fórmula (112):



(em seguida, chamado presente composto ativo 112) foi obtido de

acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 104, usando 0,07 g de 2-metil-1-propanol em vez de 2-(metiltio)etanol.

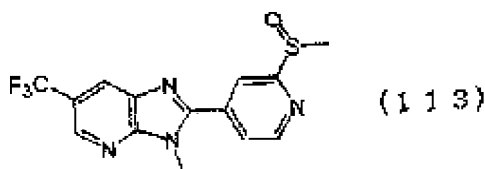
Presente composto ativo 112

[00536]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,73 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 8,53 (s, 1 H), 8,47 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,33 (d,  $J = 2,0$  Hz, 1 H), 7,51 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 3,94 (d,  $J = 6,6$  Hz, 2 H), 3,83 (s, 3 H), 2,05-1,95 (m, 1 H), 0,88 (d,  $J = 6,8$  Hz, 6H).

#### Exemplo de Produção 113

[00537] Em uma mistura de 0,20 g do presente composto ativo 110, 3 ml de metanol, 1 ml de água e 0,4 ml de THF, foi adicionado 0,16 g de periodato de sódio, e a mistura foi agitada durante 8 horas a cerca de 60°C.

[00538] Depois disso, a mistura reacional foi permitida resfriar em temperatura ambiente, e água foi vertida sob resfriamento com gelo. O cristal depositado foi filtrado, lavado com água, em seguida, dissolvido em clorofórmio e lavado sequencialmente com uma solução aquosa de tiosulfato de sódio saturada, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e solução salina, seco em sulfato de sódio, em seguida, concentrado sob pressão reduzida. O sólido gerado foi lavado com t-butil metil éter, para obter 0,17 g de um composto de fórmula (113):



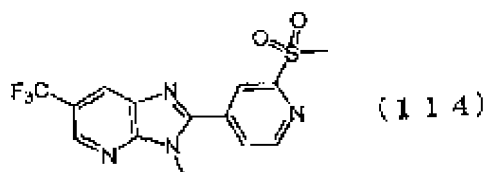
(em seguida, chamado presente composto ativo 113).

#### Presente composto ativo 113

[00539]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,87 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 8,77 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 8,49 (dd,  $J = 1,7, 0,7$  Hz, 1 H), 8,37 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 7,99 (dd,  $J = 4,9, 1,7$  Hz, 1 H), 4,16 (3H, s), 2,95 (3H, s).

#### Exemplo de Produção 114

[00540] O presente composto ativo 110 (0,20 g) foi dissolvido em 2 ml de clorofórmio, e 0,39 g de ácido m-cloroperbenzoico a 65% foi adicionado sob resfriamento com gelo, e a mistura foi agitada durante 4 horas em temperatura ambiente. A mistura reacional foi diluída com clorofórmio, em seguida, lavada sequencialmente com uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada, uma solução aquosa de tiosulfato de sódio saturada e solução salina, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O sólido resultante foi lavado com hexano, para obter 0,18 g de um composto de fórmula (114):



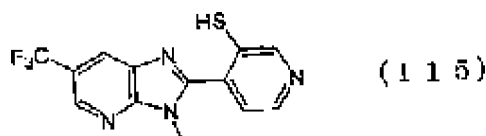
(em seguida, chamado presente composto ativo 114).

#### Presente composto ativo 114

[00541]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,98 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 8,79 (d,  $J = 1,2$  Hz, 1 H), 8,58 (dd,  $J = 1,5, 0,7$  Hz, 1 H), 8,39 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 8,14 (dd,  $J = 5,0, 1,6$  Hz, 1 H), 4,15 (s, 3 H), 3,33 (s, 3 H).

#### Exemplo de Produção 115

[00542] O presente composto ativo 36 (5,0 g) foi dissolvido em 20 ml de DMF, e 3,38 g de hidrossulfeto de sódio a 70% foram adicionados, e a mistura foi agitada durante 5 horas a cerca de  $80^\circ\text{C}$ . A mistura reacional foi permitida resfriar em temperatura ambiente, em seguida, vertida em água gelada, e ácido clorídrico concentrado foi adicionado até que o pH alcançasse aproximadamente 3. O cristal depositado foi filtrado, em seguida, lavado com água e seco sob pressão reduzida, para obter 5,2 g de um composto de fórmula (115):



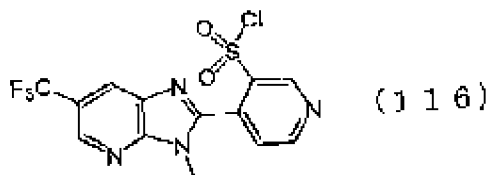
(em seguida, chamado presente composto ativo 115).

Presente composto ativo 115

[00543]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,79-8,77 (m, 2 H), 8,59 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,38 (d,  $J = 2,0$  Hz, 1 H), 7,39 (d,  $J = 5,0$ , 1 H), 4,37 (brs, 1 H), 3,91 (s, 3 H).

Exemplo de Produção 116

[00544] Em uma mistura de 0,40 g do presente composto ativo 115, 0,52 g de nitrato de potássio e 8 ml de clorofórmio foi adicionado 0,70 g de cloreto de trimetilsilila, e a mistura foi refluxada com aquecimento durante 5 horas. A mistura reacional foi permitida resfriar em temperatura ambiente, diluída com clorofórmio. O sólido foi filtrado, e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida, para obter 0,36 g de um composto de fórmula (116):



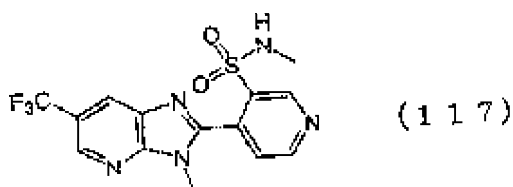
(em seguida, chamado presente composto ativo 116).

Presente composto ativo 116

[00545]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,54 (s, 1 H), 9,18 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,79 (m, 1 H), 8,38 (m, 1 H), 7,60 (d,  $J = 4,9$ , 1 H), 3,76 (s, 3 H).

Exemplo de Produção 117

[00546] O presente composto ativo 116 (0,15 g) foi suspenso em 2 ml de THF, e 0,1 g de uma solução aquosa de metilamina a 40% foi adicionada, e a mistura foi agitada durante 2 horas em temperatura ambiente. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida, e o resíduo resultante foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel, para obter 95 mg de um composto de fórmula (117):



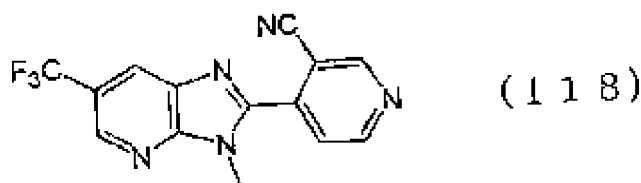
(em seguida, chamado presente composto ativo 117).

Presente composto ativo 117

[00547]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,39 (d,  $J = 0,5$  Hz, 1 H), 9,07 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,79 (m, 1 H), 8,33 (m, 1 H), 7,52 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 6,29 (brq,  $J = 5,0$  Hz, 1 H), 3,87 (s, 3 H), 2,81 (d,  $J = 5,4$  Hz, 3 H).

Exemplo de Produção 118

[00548] Em uma mistura de 4,5 g do presente composto ativo 36, 0,40 g de 18-coroa-6-éter e 25 ml de THF, foi adicionado 0,89 g de cianeto de sódio, e a mistura foi refluxada com aquecimento durante 1 hora. A mistura reacional foi permitida resfriar em temperatura ambiente, em seguida, água fria foi vertida sob resfriamento com gelo. O cristal gerado foi filtrado, dissolvido em acetato de etila, em seguida, sílica-gel e carbono ativado foram adicionados, e filtração foi realizada. O filtrado foi concentrado sob pressão reduzida, para obter 3,49 g de um composto de fórmula (118):



(em seguida, chamado presente composto ativo 118).

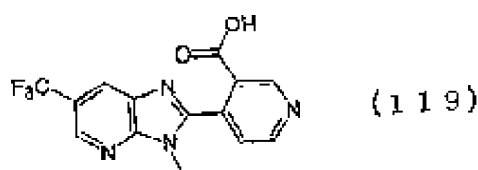
Presente composto ativo 118

[00549]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,16 (s, 1 H), 9,05 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,81 (m, 1 H), 8,44 (m, 1 H), 7,73 (dd,  $J = 5,1, 0,7$  Hz, 1 H), 4,01 (s, 3 H).

Exemplo de Produção 119

[00550] O presente composto ativo 118 (2,46 g) foi suspenso em 30 ml de etanol, e 15 ml de uma solução aquosa de hidróxido de sódio a

2N foram adicionados, e a mistura foi refluxada com aquecimento durante 5 horas. A mistura reacional foi permitida resfriar em temperatura ambiente, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi dissolvido em água, lavado com tolueno, e ácido clorídrico concentrado foi adicionado até que o pH alcançasse aproximadamente 2. O cristal gerado foi filtrado, em seguida, lavado com água e seco sob pressão reduzida, para obter 2,35 g de um composto de fórmula (119):



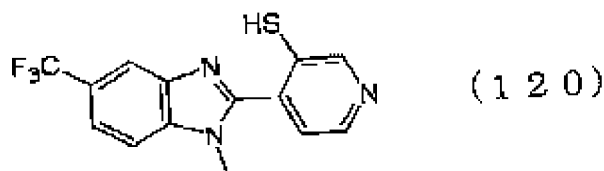
(em seguida, chamado presente composto ativo 119).

#### Presente composto ativo 119

[00551]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{DMSO-D}_6$ )  $\delta$ : 13,66 (brs, 1 H), 9,25 (d,  $J = 0,5$  Hz, 1 H), 9,01 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,83 (d,  $J = 1,4$  Hz, 1 H), 8,59 (d,  $J = 1,4$  Hz, 1 H), 7,77 (dd,  $J = 5,0, 0,6$  Hz, 1 H), 3,65 (s, 3 H).

#### Exemplo de Produção 120

[00552] Um composto (0,88 g) de fórmula (120):



(em seguida, chamado presente composto 120) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 115, usando 1,0 g do presente composto ativo 4 em vez do presente composto ativo 36.

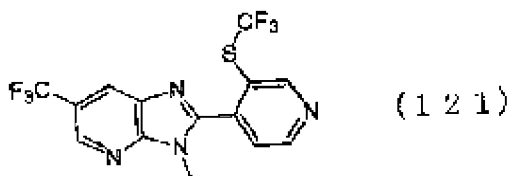
#### Presente composto ativo 120

[00553]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,76 (d,  $J = 0,5$  Hz, 1 H), 8,57 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,15 (m, 1 H), 7,66 (dd,  $J = 8,5, 1,2$  Hz, 1 H), 7,55 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,36 (dd,  $J = 4,9, 0,5$  Hz, 1 H), 3,81 (s, 3 H).

#### Exemplo de Produção 121

[00554] O presente composto ativo 115 (0,15 g) foi suspenso em 1

ml de THF, e 0,05 g de hidreto de sódio a 60% (oleoso) foi adicionado sob resfriamento com gelo, e a mistura foi agitada durante 10 minutos. À mistura, foram adicionados 0,63 g de trifluorometanossulfonato de S-(trifluorometil) dibenzotiofênio e 1 ml de THF, e a mistura foi agitada durante noite e dia em temperatura ambiente. Na mistura reacional foi vertido água, e a mistura foi extraída com clorofórmio, em seguida, a camada orgânica foi lavada sequencialmente com uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e água, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em camada fina preparativa em sílica-gel, para obter 69 mg de um composto de fórmula (121):



(em seguida, chamado presente composto ativo 121).

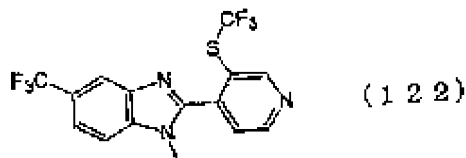
#### Presente composto ativo 121

[00555]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,15 (s, 1 H), 8,94 (d, J = 4,9 Hz, 1 H), 8,79 (m, 1H), 8,38 (m, 1 H), 7,58 (dd, J = 5,0, 0,6 Hz, 1 H), 3,82 (s, 3 H).

#### Exemplo de Produção 122

[00556] O presente composto ativo 120 (0,15 g) foi suspenso em 2 ml de THF, e 0,03 g de hidreto de sódio a 60% (oleoso) foi adicionado, e a mistura foi agitada durante 15 minutos. A esta mistura foi adicionado 0,27 g de S-(trifluorometil)dibenzotiofênio-3-sulfonato, e a mistura foi agitada durante 8 horas em temperatura ambiente. Na mistura reacional foi vertido água, e a mistura foi extraída com clorofórmio, em seguida, a camada orgânica foi lavada sequencialmente com uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e água, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a

cromatografia em camada fina preparativa em sílica-gel, para obter 96 mg de um composto de fórmula (122):



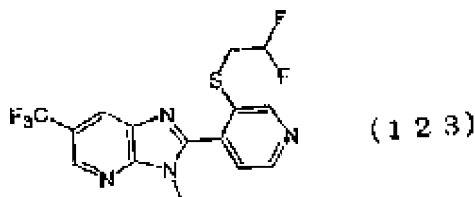
(em seguida, chamado presente composto ativo 122).

Presente composto ativo 122

[00557]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,12 (s, 1 H), 8,91 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,15-8,14 (m, 1 H), 7,67 (dd,  $J = 8,4, 1,3$  Hz, 1 H), 7,56-7,54 (m, 2 H), 3,74 (s, 3 H).

Exemplo de Produção 123

[00558] O presente composto ativo 115 (0,15 g) foi suspenso em 2 ml de DMF, e 0,04 g de hidreto de sódio a 60% (oleoso) foi adicionado, e a mistura foi agitada durante 5 minutos a aproximadamente 50°C. A esta mistura foi adicionado 0,18 g de 1,1-difluoro-2-iodoetano, e a mistura foi agitada durante 3 horas. A mistura reacional foi permitida resfriar em temperatura ambiente, água foi vertida, e a mistura foi extraída com t-butil metil éter, em seguida, a camada orgânica foi lavada sequencialmente com uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução aquosa de cloreto de sódio saturada, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel, para obter 0,10 g de um composto de fórmula (123):



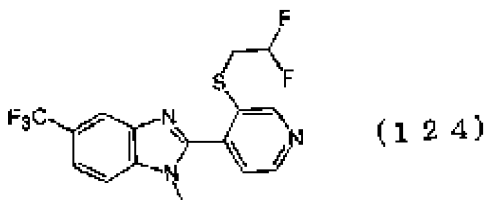
(em seguida, chamado presente composto ativo 123).

Presente composto ativo 123

[00559]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,96 (s, 1 H), 8,77-8,76 (m, 2 H), 8,37 (d,  $J = 2,0$  Hz, 1 H), 7,45 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 5,83 (tt,  $J = 56,0, 4,3$  Hz, 1 H), 3,80 (s, 3 H), 3,19 (td,  $J = 15,1, 4,1$  Hz, 2H).

#### Exemplo de Produção 124

[00560] Um composto (0,10 g) de fórmula (124):



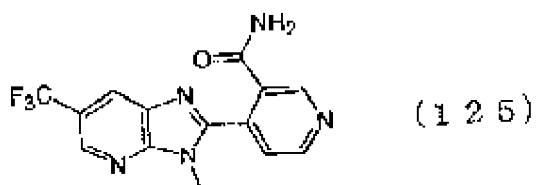
(em seguida, chamado presente composto ativo 124) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 123, usando 0,15 g do presente composto ativo 120 em vez do presente composto ativo 115.

#### Presente composto ativo 124

[00561]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,94 (s, 1 H), 8,74 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,14 (m, 1 H), 7,66 (dd,  $J = 8,5, 1,5$  Hz, 1 H), 7,55 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,45 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 5,80 (tt,  $J = 56, 4,2$  Hz, 1 H), 3,72 (s, 3 H), 3,15 (td,  $J = 15,2, 4,2$  Hz, 2H).

#### Exemplo de Produção 125

[00562] O presente composto ativo 118 (0,15 g) foi suspenso em 2 ml de metanol, e 0,5 ml de uma solução aquosa de hidróxido de sódio a 2N e 0,3 ml de uma solução aquosa de peróxido de hidrogênio a 30% foram adicionados, e a mistura foi agitada durante 1 hora em temperatura ambiente. Na mistura reacional, água foi vertida, e a mistura foi extraída com clorofórmio, em seguida, a camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa de tiosulfato de sódio saturada, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em camada fina preparativa em sílica-gel, para obter 29 mg de um composto de fórmula (125):



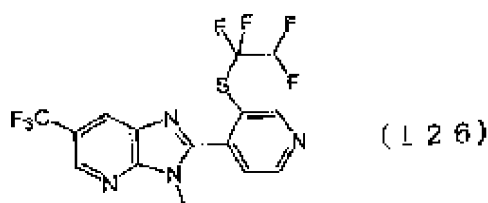
(em seguida, chamado presente composto ativo 125).

Presente composto ativo 125

[00563]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,15 (s, 1 H), 8,92 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,76 (m, 1 H), 8,31 (m, 1 H), 7,46 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 6,82 (brs, 1 H), 5,85 (brs, 1 H), 3,81 (s, 3 H).

Exemplo de Produção 126

[00564] O presente composto ativo 115 (0,20 g) foi suspenso em 3 ml de DMF, e 0,05 g de hidreto de sódio a 60% (oleoso) foi adicionado sob resfriamento com água, e a mistura foi agitada durante 5 minutos em temperatura ambiente. À mistura foi adicionado 0,16 g de 1-bromo-1,1,2,2-tetrafluoroetano, e a mistura foi agitada durante noite e dia em temperatura ambiente. Na mistura reacional, foi vertido água sob resfriamento com gelo, e a mistura foi extraída com t-butil metil éter. A camada orgânica foi lavada sequencialmente com água e uma solução aquosa de cloreto de sódio saturada, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O sólido resultante foi lavado com t-butil metil éter, para obter 0,16 g de um composto de fórmula (126):



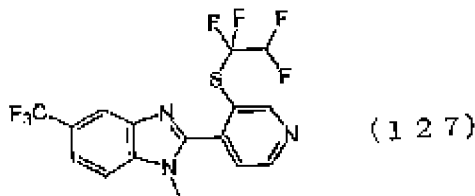
(em seguida, chamado presente composto ativo 126).

Presente composto ativo 126

[00565]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,13 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 8,93 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,78 (m, 1 H), 8,38 (m, 1 H), 7,56 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 5,77 (tt,  $J = 53,5, 2,9$  Hz, 1 H), 3,80 (s, 3 H).

Exemplo de Produção 127

[00566] Um composto (0,22 g) de fórmula (127):



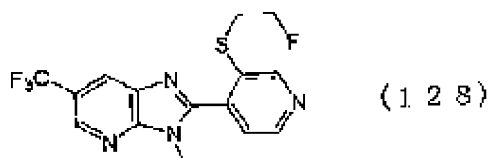
(em seguida, chamado presente composto ativo 127) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 126, usando 0,20 g do presente composto ativo 120 em vez do presente composto ativo 115.

Presente composto ativo 127

[00567]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,10 (s, 1 H), 8,90 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,14 (s, 1 H), 7,67 (dd,  $J = 8,5, 1,2$  Hz, 1 H), 7,56-7,54 (m, 2 H), 5,76 (tt,  $J = 53,5, 3,2$  Hz, 1 H), 3,72 (s, 3 H).

Exemplo de Produção 128

[00568] Um composto (0,21 g) de fórmula (128):



(em seguida, chamado presente composto ativo 128) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 126, usando 0,16 g de 1-bromo-2-fluoroetano em vez de 1-bromo-1,1,2,2-tetrafluoroetano,.

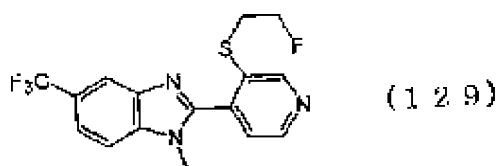
Presente composto ativo 128

[00569]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,90 (s, 1 H), 8,76 (d,  $J = 2,0$  Hz, 1 H), 8,72 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,35 (d,  $J = 2,0$  Hz, 1 H), 7,43 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 4,49 (dt,  $J = 46,9, 6,0, 2$  Hz), 3,81 (s, 3 H), 3,14 (dt,  $J = 20,7, 6,1$  Hz, 2H).

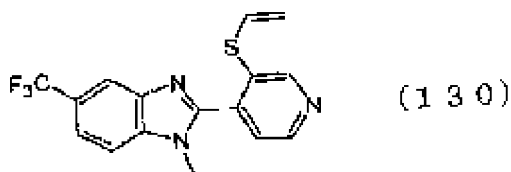
Exemplo de Produção 129 e Exemplo de Produção 130

[00570] O presente composto ativo 120 (0,20 g) foi suspenso em 3

ml de DMF, e 0,05 g de hidreto de sódio a 60% (oleoso) foi adicionado sob resfriamento com água, e a mistura foi agitada durante 10 minutos em temperatura ambiente. À mistura foi adicionado 0,16 g de 1-bromo-2-fluoroetano, e a mistura foi agitada durante 8 horas em temperatura ambiente, e permitida repousar durante a noite em temperatura ambiente. Na mistura reacional, foi vertido água sob resfriamento com gelo, e o cristal gerado foi filtrado, em seguida, lavado com água e seco sob pressão reduzida. O cristal resultante foi submetido a cromatografia em camada fina preparativa em sílica-gel, para obter 0,12 g de um composto de fórmula (129):



(em seguida, chamado presente composto ativo 129) e 50 mg de um composto de fórmula (130):



(em seguida, chamado presente composto ativo 130).

#### Presente composto ativo 129

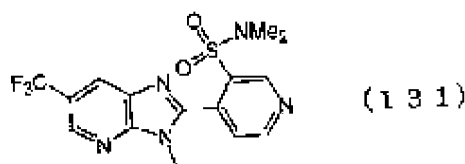
[00571]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,87 (s, 1 H), 8,69 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,12 (m, 1 H), 7,63 (dd,  $J = 8,5, 1,7$ , 1 H), 7,54 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,44 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 4,46 (dt,  $J = 46,8, 6,1$  Hz, 2 H), 3,72 (s, 3 H), 3,09 (dt,  $J = 21,0, 6,0$  Hz, 2H).

#### Presente composto ativo 130

[00572]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,79 (s, 1 H), 8,67 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,13 (m, 1 H), 7,63 (dd,  $J = 8,5, 1,2$  Hz, 1 H), 7,52 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,45 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 6,41 (dd,  $J = 16,5, 9,4$  Hz, 1 H), 5,44 (d,  $J = 16,6$  Hz, 1 H), 5,40 (d,  $J = 9,5$  Hz, 1 H), 3,74 (s, 3 H).

#### Exemplo de Produção 131

[00573] O presente composto ativo 116 (0,16 g) foi suspenso em 3 ml de THF, e 0,2 ml de uma solução aquosa de dimetilamina a 50% foi adicionada, e a mistura foi agitada durante 2 horas em temperatura ambiente. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida, e o resíduo resultante foi submetido a cromatografia em camada fina preparativa em sílica-gel, para obter 73 mg de um composto de fórmula (131):



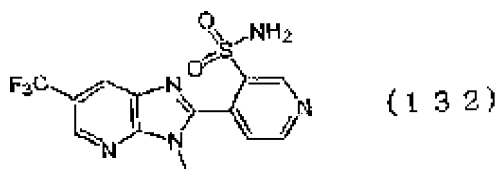
(em seguida, chamado presente composto ativo 131).

#### Presente composto ativo 131

[00574]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,30 (s, 1 H), 9,00 (d, J = 4,9 Hz, 1 H), 8,76 (d, J = 1,2 Hz, 1 H), 8,29 (d, J = 1,5 Hz, 1 H), 7,49 (d, J = 4,9 Hz, 1 H), 3,73 (s, 3 H), 2,73 (s, 6H).

#### Exemplo de Produção 132

[00575] O presente composto ativo 116 (0,18 g) foi suspenso em 3 ml de THF, e 0,2 ml de água amoniacal a 28% foi adicionado, e a mistura foi agitada durante 2 horas em temperatura ambiente. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida, e o resíduo resultante foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel, para obter 74 mg de um composto de fórmula (132):



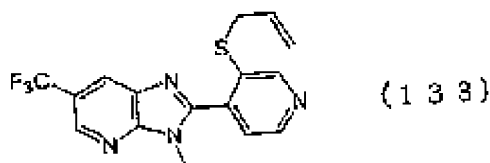
(em seguida, chamado presente composto ativo 132).

#### Presente composto ativo 132

[00576]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,47 (s, 1 H), 9,07 (d, J = 4,9 Hz, 1 H), 8,80 (d, J = 1,7 Hz, 1 H), 8,33 (d, J = 2,0 Hz, 1 H), 7,53 (d, J = 4,9 Hz, 1 H), 6,25 (brs, 2 H), 3,89 (s, 3 H).

Exemplo de Produção 133

[00577] Um composto (0,13 g) de fórmula (133):



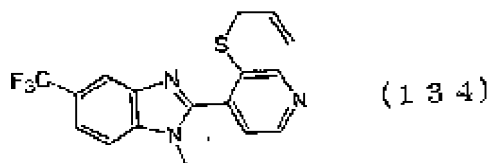
(em seguida, chamado presente composto ativo 133) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 126, usando 0,16 g de 3-bromo-1-propeno em vez de 1-bromo-1,1,2,2-tetrafluoroetano.

Presente composto ativo 133

[00578]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,79 (s, 1 H), 8,75 (d,  $J = 1,2$  Hz, 1 H), 8,66 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,36 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 7,41 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 5,79-5,68 (m, 1 H), 5,11 (dd,  $J = 12,6, 1,1$  Hz, 1 H), 5,08 (dd,  $J = 5,5, 1,1$  Hz, 1 H), 3,81 (s, 3 H), 3,48 (dt,  $J = 6,9, 1,1$  Hz, 2H).

Exemplo de Produção 134

[00579] Um composto (0,12 g) de fórmula (134):



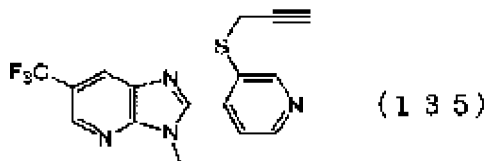
(em seguida, chamado presente composto ativo 134) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 126, usando 0,20 g do presente composto ativo 120 em vez do presente composto ativo 115 e usando 0,16 g de 3-bromo-1-propeno em vez de 1-bromo-1,1,2,2-tetrafluoroetano.

Presente composto ativo 134

[00580]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,77 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 8,64 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,14 (m, 1 H), 7,64 (dd,  $J = 8,5, 1,2$  Hz, 1 H), 7,53 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,42 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 5,77-5,67 (m, 1 H), 5,12-5,05 (m, 2 H), 3,72 (s, 3 H), 3,44 (dt,  $J = 7,0, 1,1$  Hz, 2H).

Exemplo de Produção 135

[00581] Um composto (70 mg) de fórmula (135):



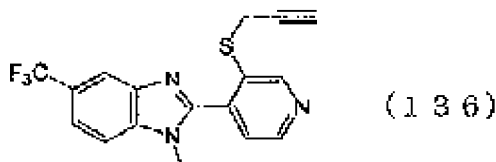
(em seguida, chamado presente composto ativo 135) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 126, usando 0,16 g de 3-bromo-1-propina em vez de 1-bromo-1,1,2,2-tetrafluoroetano.

#### Presente composto ativo 135

[00582]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,98 (d,  $J = 0,5$  Hz, 1 H), 8,76 (m, 1 H), 8,74 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,35 (m, 1 H), 7,44 (dd,  $J = 5,5, 0,6$  Hz, 1 H), 3,82 (s, 3 H), 3,59 (d,  $J = 2,7$  Hz, 2 H), 2,23 (t,  $J = 2,6$  Hz, 1H).

#### Exemplo de Produção 136

[00583] Um composto (45 mg) de fórmula (136):



(em seguida, chamado presente composto ativo 136) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 126, usando 0,20 g do presente composto ativo 120 em vez do presente composto ativo 115 e usando 0,16 g de 3-bromo-1-propina em vez de 1-bromo-1,1,2,2-tetrafluoroetano.

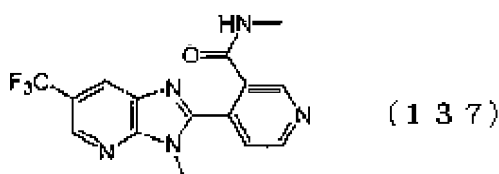
#### Presente composto ativo 136

[00584]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,95 (s, 1 H), 8,71 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,13 (m, 1 H), 7,64 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,53 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,44 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 3,73 (s, 3 H), 3,55 (d,  $J = 2,4$  Hz, 2 H), 2,21 (t,  $J = 2,6$  Hz, 1H).

#### Exemplo de Produção 137

[00585] O presente composto ativo 119 (0,15 g) foi suspenso em 3 ml de clorofórmio, e uma gota de DMF e 0,29 g de cloreto de oxalila

foram adicionados sob resfriamento com gelo, e a mistura foi agitada durante 15 minutos em temperatura ambiente. A mistura foi concentrada sob pressão reduzida, o resíduo foi suspenso em 3 ml de THF, e 0,2 ml de uma solução aquosa de metilamina a 40% foi adicionado sob resfriamento com gelo, e a mistura foi agitada durante 1 hora em temperatura ambiente. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida, e o resíduo foi submetido a cromatografia em camada fina preparativa em sílica-gel, para obter 34 mg de um composto de fórmula (137):



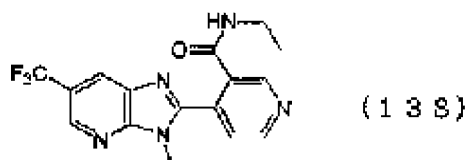
(em seguida, chamado presente composto ativo 137).

#### Presente composto ativo 137

[00586]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,03 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 8,85 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,76 (d,  $J = 1,2$  Hz, 1 H), 8,29 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 7,41 (d,  $J = 5,0, 0,6$  Hz, 1 H), 7,25 (brs, 1 H), 3,80 (s, 3 H), 2,86 (d,  $J = 4,9$  Hz, 3 H).

#### Exemplo de Produção 138

[00587] O presente composto ativo 119 (0,15 g) foi suspenso em 3 ml de clorofórmio, e uma gota de DMF e 0,12 g de cloreto de oxalila foram adicionados sob resfriamento com água, e a mistura foi agitada durante 2 horas em temperatura ambiente, e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi suspenso em 2,5 ml de THF, que foi em seguida adicionado a uma mistura de 0,5 ml de uma solução aquosa de etilamina a 70% e 2,5 ml de THF, e a mistura foi agitada durante 1 hora. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida, e o resíduo foi submetido a cromatografia em camada fina preparativa em sílica-gel, para obter 0,10 g de um composto de fórmula (138):



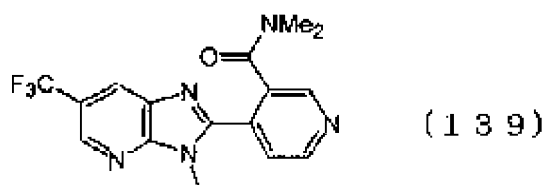
(em seguida, chamado presente composto ativo 138).

Presente composto ativo 138

[00588]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,09 (s, 1 H), 8,91 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,75 (m, 1 H), 8,30 (m, 1 H), 7,46 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 6,47 (brs, 1 H), 3,80 (s, 3 H), 3,34-3,27 (m, 2 H), 1,00 (t,  $J = 7,2$  Hz, 3 H).

Exemplo de Produção 139

[00589] Um composto (93 mg) de fórmula (139):



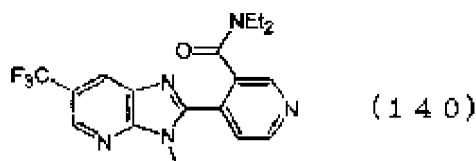
(em seguida, chamado presente composto ativo 139) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 138, usando uma solução aquosa de dimetilamina a 50% em vez da solução aquosa de etilamina a 70%.

Presente composto ativo 139

[00590]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,87 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,80 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 8,73 (m, 1 H), 8,28 (m, 1 H), 7,53 (dd,  $J = 5,1, 0,7$  Hz, 1 H), 3,89 (s, 3 H), 3,01 (s, 3 H), 3,00 (s, 6H).

Exemplo de Produção 140

[00591] Um composto (83 mg) de fórmula (140):



(em seguida, chamado presente composto ativo 140) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 138, usando

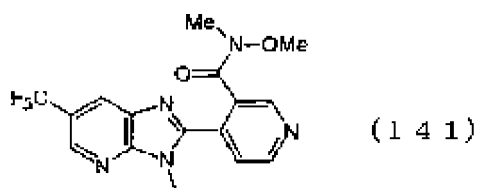
0,5 ml de dietilamina em vez da solução aquosa de etilamina a 70%.

Presente composto ativo 140

[00592]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,86 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,79 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 8,73 (m, 1 H), 8,24 (m, 1 H), 7,52 (dd,  $J = 5,1, 0,7$  Hz, 1 H), 3,89 (s, 3 H), 3,42 (q,  $J = 7,0$  Hz, 2 H), 3,31 (q,  $J = 7,2$  Hz, 2 H), 1,15 (t,  $J = 7,2$  Hz, 3 H), 0,96 (t,  $J = 7,1$  Hz, 3 H).

Exemplo de Produção 141

[00593] Em uma mistura de 1,0 g do presente composto ativo 119, 0,30 g de cloridrato de N-metoximetano amina, 20 mg de 1-hidroxibenzotriazol e 10 ml de piridina foi adicionado 0,71 g de WSC, e a mistura foi agitada durante 5 horas em temperatura ambiente. Na mistura reacional, água foi vertida, e a mistura foi extraída com acetato de etila, em seguida, a camada orgânica foi lavada com água, seca em sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. O sólido resultante foi lavado com hexano, para obter 0,13 g de um composto de fórmula (141):



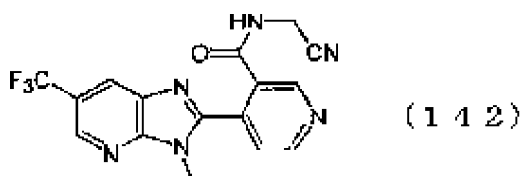
(em seguida, chamado presente composto ativo 141).

Presente composto ativo 141

[00594]  $^1\text{H}$ -RMN- $(\text{CDCl}_3)$   $\delta$ : 8,95 (brs, 1 H), 8,89 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,73 (m, 1 H), 8,30 (m, 1 H), 7,54 (dd,  $J = 5,1, 0,7$  Hz, 1 H), 3,91 (s, 3 H), 3,56 (brs, 3 H), 3,23 (s, 3 H).

Exemplo de Produção 142

[00595] Um composto (0,12 g) de fórmula (142):



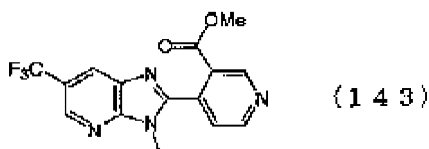
(em seguida, chamado presente composto ativo 142) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 141, usando 0,06 g de cloridrato de 2-aminoacetonitrila em vez de cloridrato de N-metoximetano amina.

#### Presente composto ativo 142

[00596]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,19 (d,  $J = 0,7$  Hz, 2 H), 8,96 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,79 (d,  $J = 1,2$  Hz, 1 H), 8,37 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 8,14 (brt,  $J = 5,6$  Hz, 1 H), 7,47 (dd,  $J = 5,0, 0,6$  Hz, 1 H), 4,23 (d,  $J = 5,9$  Hz, 2 H), 3,87 (s, 3 H).

#### Exemplo de Produção 143

[00597] O presente composto ativo 119 (0,20 g) foi suspenso em 10 ml de metanol, e uma gota de ácido sulfúrico concentrado foi adicionada, e a mistura foi refluxada com aquecimento durante 10 horas. A mistura reacional foi concentrada sob pressão reduzida, e ao resíduo foi adicionada uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada, e a mistura foi extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel, para obter 46 mg de um composto de fórmula (143):



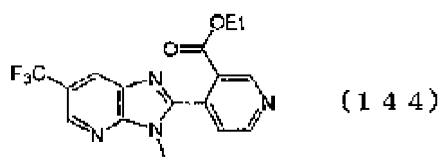
(em seguida, chamado presente composto ativo 143).

#### Presente composto ativo 143

[00598]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,40 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 8,99 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,74 (m, 1 H), 8,31 (m, 1 H), 7,52 (dd,  $J = 5,0, 0,6$  Hz, 1 H), 3,81 (s, 3 H), 3,71 (s, 3 H).

#### Exemplo de Produção 144

[00599] Um composto (0,16 g) de fórmula (144):



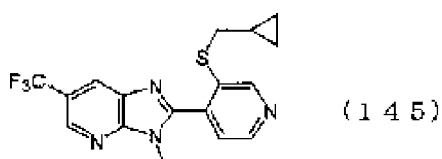
(em seguida, chamado presente composto ativo 144) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 143, usando etanol em vez de metanol.

Presente composto ativo 144

[00600]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,41 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1 H), 8,99 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,74 (m, 1 H), 8,31 (m, 1 H), 7,52 (dd,  $J = 4,9, 0,7$  Hz, 1 H), 4,23 (q,  $J = 7,2$  Hz, 2 H), 3,70 (s, 3 H), 1,10 (t,  $J = 7,1$  Hz, 3H).

#### Exemplo de Produção 145

[00601] O presente composto ativo 115 (0,31 g) foi suspenso em 3 ml de DMF, e 0,07 g de hidreto de sódio a 60% (oleoso) foi adicionado sob resfriamento com água, e a mistura foi agitada durante 5 minutos em temperatura ambiente. À mistura, foi adicionado 0,27 g de (bromometil)ciclopropano, e a mistura foi agitada durante 1 hora em temperatura ambiente. Na mistura reacional, foi vertida uma solução aquosa de cloreto de sódio saturada, e a mistura foi extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa de cloreto de sódio saturada, seca em sulfato de magnésio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia líquida preparativa de média pressão, para obter 0,17 g de um composto de fórmula (145):



(em seguida, chamado presente composto ativo 145).

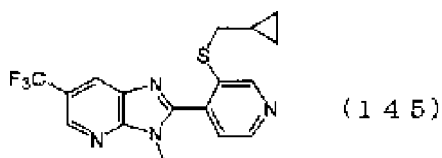
Presente composto ativo 145

[00602]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,83 (s, 1 H), 8,75 (m, 1 H), 8,65 (d,  $J =$

5,1 Hz, 1 H), 8,35 (m, 1 H), 7,40 (dd, J = 4,9, 0,6 Hz, 1H), 3,82 (s, 3 H), 2,82 (d, J = 7,1 Hz, 2 H), 0,99-0,89 (m, 1 H), 0,56-0,51 (m, 2 H), 0,18-0,14 (m, 2H).

#### Exemplo de Produção 146

[00603] O presente composto ativo 120 (0,31 g) foi suspenso em 3 ml de DMF, e 0,07 g de hidreto de sódio a 60% (oleoso) foi adicionado sob resfriamento com água, e a mistura foi agitada durante 5 minutos em temperatura ambiente. À mistura foi adicionado 0,27 g de (bromometil)ciclopropano, e a mistura foi agitada durante 1 hora em temperatura ambiente. Na mistura reacional foi vertida uma solução aquosa de cloreto de sódio saturada, e a mistura foi extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa de cloreto de sódio saturada, seca em sulfato de magnésio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia líquida preparativa de média pressão, para obter 0,19 g de um composto de fórmula (146):



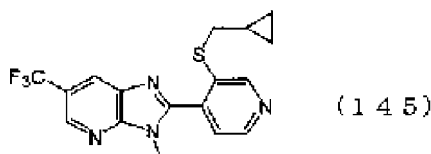
(em seguida, chamado presente composto ativo 146).

#### Presente composto ativo 146

[00604]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,81 (s, 1 H), 8,63 (d, J = 4,8 Hz, 1 H), 8,13 (s, 1 H), 7,64 (dd, J = 8,6, 1,3 Hz, 1 H), 7,53 (d, J = 8,6 Hz, 1 H), 7,41 (dd, J = 4,9, 0,6 Hz, 1 H), 3,73 (s, 3 H), 2,77 (d, J = 7,1 Hz, 2 H), 0,96-0,86 (m, 1 H), 0,53-0,49 (m, 2 H), 0,16-0,12 (m, 2H).

#### Exemplo de Produção 147

[00605] Um composto (73 mg) de fórmula (147):



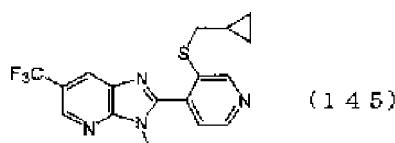
(em seguida, chamado presente composto ativo 147) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 145, usando 0,28 g de 1-bromo-2-metoxietano em vez de (bromometil)ciclopropano.

Presente composto ativo 147

[00606]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,87 (d,  $J = 0,5$  Hz, 1 H), 8,75 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 8,67 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,35 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 7,40 (dd,  $J = 4,9, 0,6$  Hz, 1 H), 3,81 (s, 3 H), 3,51 (t,  $J = 6,2$  Hz, 2 H), 3,28 (s, 3 H), 3,07 (t,  $J = 6,2$  Hz, 2H).

#### Exemplo de Produção 148

[00607] Um composto (0,17 g) de fórmula (148):



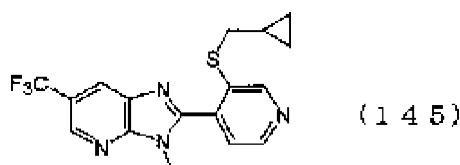
(em seguida, chamado presente composto ativo 148) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 146, usando 0,28 g de 1-bromo-2-metoxietano em vez de (bromometil)ciclopropano.

Presente composto ativo 148

[00608]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,85 (s, 1 H), 8,65 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,12 (s, 1 H), 7,64 (dd,  $J = 8,6, 1,3$  Hz, 1 H), 7,53 (d,  $J = 8,3$  Hz, 1 H), 7,42 (dd,  $J = 4,9, 0,6$  Hz, 1 H), 3,72 (s, 3 H), 3,47 (t,  $J = 6,2$  Hz, 2 H), 3,26 (s, 3 H), 3,01 (t,  $J = 6,3$  Hz, 2H).

#### Exemplo de Produção 149

[00609] Um composto (82 mg) de fórmula (149):



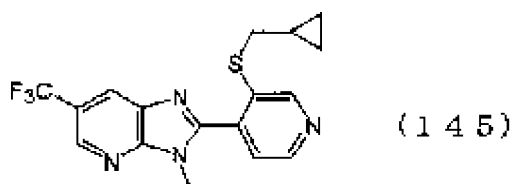
(em seguida, chamado presente composto ativo 149) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 145, usando 0,27 g de bromociclobutano em vez de (bromometil)ciclopropano.

Presente composto ativo 149

[00610]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,75 (m, 1 H), 8,63 (s, 1 H), 8,61 (d, J = 4,8 Hz, 1 H), 8,36 (m, 1 H), 7,37 (dd, J = 4,9, 0,6 Hz, 1 H), 3,99-3,89 (m, 1 H), 3,82 (s, 3 H), 2,47-2,42 (m, 2 H), 2,05-1,96 (m, 2H).

Exemplo de Produção 150

[00611] Um composto (51 mg) de fórmula (150):



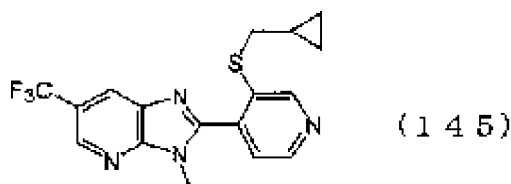
(em seguida, chamado presente composto ativo 150) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 146, usando 0,27 g de bromociclobutano em vez de (bromometil)ciclopropano.

Presente composto ativo 150

[00612]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,61 (s, 1 H), 8,58 (d, J = 5,1 Hz, 1 H), 8,14 (m, 1 H), 7,64 (d, J = 8,6 Hz, 1 H), 7,53 (d, J = 8,6 Hz, 1 H), 7,38 (d, J = 4,8 Hz, 1 H), 3,93-3,85 (m, 1 H), 3,73 (s, 3 H), 2,46-2,39 (m, 2 H), 2,07-1,92 (m, 4H).

Exemplo de Produção 151

[00613] Um composto (0,13 g) de fórmula (151):



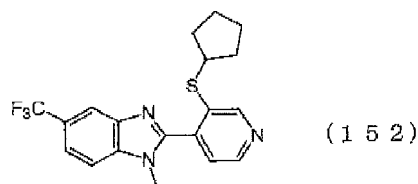
(em seguida, chamado presente composto ativo 151) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 145, usando 0,30 g de bromociclopentano em vez de (bromometil)ciclopropano

Presente composto ativo 151

[00614]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,82 (s, 1 H), 8,75 (m, 1 H), 8,63 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,35 (m, 1 H), 7,38 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,80 (s, 3 H), 3,63-3,56 (m, 1 H), 2,04-1,98 (m, 2 H), 1,72-1,64 (m, 2 H), 1,59-1,48 (m, 4H).

#### Exemplo de Produção 152

[00615] Um composto (0,30 g) de fórmula (152):



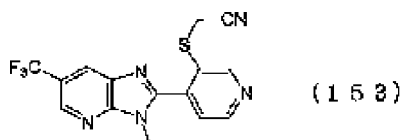
(em seguida, chamado presente composto ativo 152) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 146, usando 0,30 g de bromociclopentano em vez de (bromometil)ciclopropano.

Presente composto ativo 152

[00616]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,80 (m, 1 H), 8,61 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,13 (m, 1 H), 7,63 (dd,  $J = 8,3, 1,3$  Hz, 1 H), 7,53 (d,  $J = 8,6$  Hz, 1 H), 7,39 (dd,  $J = 4,8, 0,8$  Hz, 1 H), 3,71 (s, 3 H), 3,58-3,52 (m, 1 H), 2,05-1,95 (m, 2 H), 1,72-1,62 (m, 2 H), 1,60-1,46 (m, 4H).

#### Exemplo de Produção 153

[00617] Um composto (0,23 g) de fórmula (153):



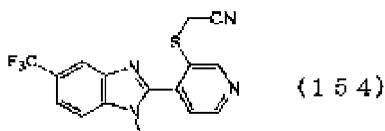
(em seguida, chamado presente composto ativo 153) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 145, usando 0,24 g de bromoacetona nitrila em vez de (bromometil)ciclopropano.

Presente composto ativo 153

[00618]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,09 (s, 1 H), 8,89 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,78 (d,  $J = 1,3$  Hz, 1 H), 8,36 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 7,51 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,84 (s, 3 H), 3,71 (s, 2H).

Exemplo de Produção 154

[00619] Um composto (0,24 g) de fórmula (154):



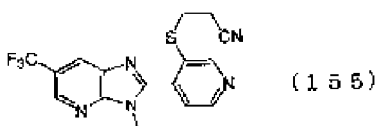
(em seguida, chamado presente composto ativo 154) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 146, usando 0,24 g de bromoacetonitrila em vez de (bromometil)ciclopropano.

Presente composto ativo 154

[00620]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,06 (m, 1 H), 8,86 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,13 (m, 1 H), 7,67 (dd,  $J = 8,5, 1,1$  Hz, 1 H), 7,56 (d,  $J = 8,3$  Hz, 1 H), 7,49 (dd,  $J = 4,9, 0,6$  Hz, 1 H), 3,76 (s, 3 H), 3,69 (s, 2H).

Exemplo de Produção 155

[00621] Um composto (0,19 g) de fórmula (155):



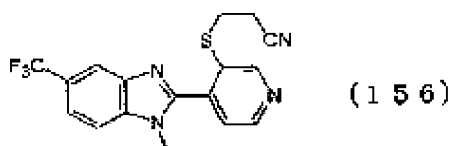
(em seguida, chamado presente composto ativo 155) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 145, usando 0,27 g de 3-bromopropionitrila em vez de (bromometil)ciclopropano.

Presente composto ativo 155)

[00622]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,94 (d,  $J = 0,5$  Hz, 1 H), 8,80 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,78 (d,  $J = 1,3$  Hz, 1 H), 8,36 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 7,48 (dd,  $J = 4,8, 0,5$  Hz, 1 H), 3,81 (s, 3 H), 3,04 (t,  $J = 7,1$  Hz, 2 H), 2,56 (t,  $J = 6,9$  Hz, 2H).

Exemplo de Produção 156

[00623] Um composto (0,16 g) de fórmula (156):



(em seguida, chamado presente composto ativo 156) foi obtido de

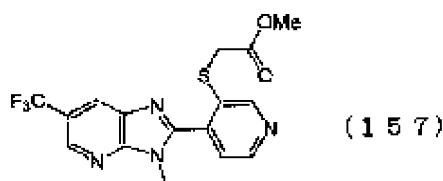
acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 146, usando 0,27 g de 3-bromopropionitrila em vez de (bromometil)ciclopropano.

Presente composto ativo 156

[00624]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,92 (m, 1 H), 8,78 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,12 (m, 1 H), 7,66 (dd,  $J = 8,5, 1,4$  Hz, 1 H), 7,55 (d,  $J = 8,6$  Hz, 1 H), 7,49 (dd,  $J = 4,8, 0,8$  Hz, 1 H), 3,73 (s, 3 H), 2,98 (t,  $J = 6,9$  Hz, 2 H), 2,52 (t,  $J = 6,9$  Hz, 2H).

Exemplo de Produção 157

[00625] Um composto (0,13 g) de fórmula (157):



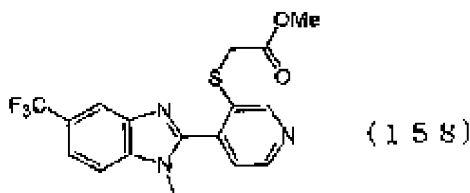
(em seguida, chamado presente composto ativo 157) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 145, usando 0,31 g de 2-bromoacetato de metila em vez de (bromometil)ciclopropano.

Presente composto ativo 157

[00626]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,90 (d,  $J = 0,5$  Hz, 1 H), 8,76 (d,  $J = 1,3$  Hz, 1 H), 8,72 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 8,36 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 7,42 (dd,  $J = 4,9, 0,6$  Hz, 1 H), 3,83 (s, 3 H), 3,67 (s, 3 H), 3,64 (s, 2H).

Exemplo de Produção 158

[00627] Um composto (94 mg) de fórmula (158):



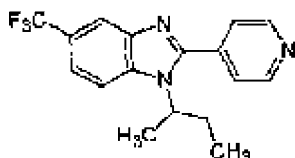
(em seguida, chamado presente composto ativo 158) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 146, usando 0,31 g de 2-bromoacetato de metila em vez de (bromometil)ciclopropano.

Presente composto ativo 158

[00628]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,87 (m, 1 H), 8,70 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,13 (m, 1 H), 7,65 (dd,  $J = 8,6, 1,3$  Hz, 1 H), 7,54 (d,  $J = 8,3$  Hz, 1 H), 7,43 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,74 (s, 3 H), 3,64 (s, 3 H), 3,60 (s, 2H).

#### Exemplo de Produção 201

[00629] Uma mistura de 0,76 g de N1-sec-butil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina, 0,84 g de hidróxi-piridin-4-il-metanossulfonato de sódio e 17 ml de DMF foi agitada durante 1 hora a  $120^\circ\text{C}$ . A mistura reacional foi arrefecida em temperatura ambiente. Na mistura reacional, foi vertida uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel, para obter 0,91 g de 1-sec-butil-2-piridin-4-il-5-trifluorometil-1H-benzimidazol



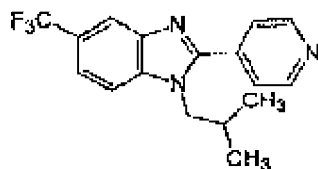
(em seguida, chamado presente composto ativo 201).

#### Presente composto ativo 201

[00630]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,83 (dd,  $J = 4,4, 1,7$  Hz, 2 H), 8,12 (s, 1 H), 7,72 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,58-7,54 (m, 3 H), 4,54-4,44 (m, 1 H), 2,25-2,12 (m, 1 H), 1,99-1,87 (m, 1 H), 1,99-1,88 (m, 1 H), 1,74 (d,  $J = 6,8$  Hz, 3 H), 0,66 (t,  $J = 7,3$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 202

[00631] 1-isobutil-2-piridin-4-il-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 202) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 201, usando N1-isobutil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina em vez de N1-sec-butil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina.

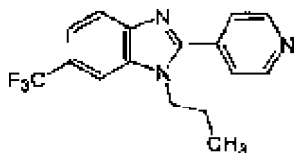


#### Presente composto ativo 202

[00632]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,83 (dd,  $J = 4,4, 1,6$  Hz, 2 H), 8,12 (s, 1 H), 7,65 (dd,  $J = 4,4, 1,6$  Hz, 2 H), 7,60 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 7,53 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 4,16 (d,  $J = 7,6$  Hz, 2 H), 2,17-2,04 (m, 1 H), 0,78 (d,  $J = 6,8$  Hz, 6H)

#### Exemplo de Produção 203

[00633] 1-propil-2-piridin-4-il-6-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 203) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 201, usando N2-propil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina em vez de N1-sec-butil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina.

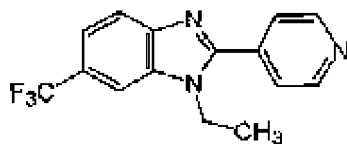


#### Presente composto ativo 203

[00634]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,85 (dd,  $J = 4,4, 1,7$  Hz, 2 H), 7,93 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 7,73 (s, 1 H), 7,67 (dd,  $J = 4,4, 1,7$  Hz, 2 H), 7,59 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 4,29 (t,  $J = 7,7$  Hz, 2 H), 1,94-1,84 (m, 2 H), 0,92 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 204

[00635] 1-etil-2-piridin-4-il-6-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 204) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 201, usando N2-etil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina em vez de N1-sec-butil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina.

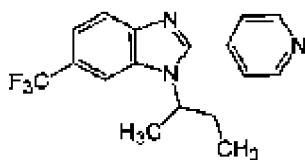


#### Presente composto ativo 204

[00636]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,85 (dd,  $J = 4,4, 1,7$  Hz, 2 H), 7,93 (d,  $J = 8,3$  Hz, 1 H), 7,75 (s, 1 H), 7,68 (dd,  $J = 4,4, 1,7$  Hz, 2 H), 7,60 (d,  $J = 8,3$  Hz, 1 H), 4,39 (q,  $J = 7,3$  Hz, 2 H), 1,55 (t,  $J = 7,3$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 205

[00637] 1-sec-butil-2-piridin-4-il-6-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 205) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 201, usando N2-sec-butil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina em vez de N1-sec-butil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina.



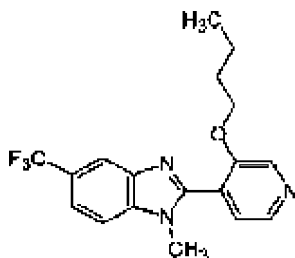
#### Presente composto ativo 205

[00638]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,84 (dd,  $J = 4,4, 1,7$  Hz, 2 H), 7,93 (d,  $J = 8,3$  Hz, 1 H), 7,88 (s, 1 H), 7,60-7,56 (m, 3 H), 4,55-4,45 (m, 1 H), 2,24-2,13 (m, 1 H), 2,00-1,90 (m, 1 H), 1,75 (d,  $J = 6,8$  Hz, 3 H), 0,68 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 206

[00639] Em uma mistura de 0,44 g de 1-butanol e 6 ml de DMF foi adicionado 0,24 g de hidreto de sódio a 60% (oleoso) sob resfriamento com gelo, e a mistura foi agitada durante 10 minutos. E, 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (0,35 g) foi adicionado, em seguida, a mistura foi agitada durante 1,5 hora em temperatura ambiente. Na mistura reacional foi vertida uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada, e a mistura foi extraída três

vezes com acetato de etila. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel, para obter 0,37 g de 2-(3-butoxipiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 206).

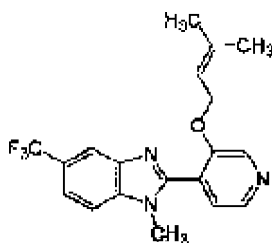


#### Presente composto ativo 206

[00640]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,51 (s, 1 H), 8,45 (d,  $J = 4,6$  Hz, 1 H), 8,11 (s, 1 H), 7,62 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,54-7,50 (m, 2 H), 4,15 (t,  $J = 6,6$  Hz, 2 H), 3,74 (s, 3 H), 1,74-1,66 (m, 2 H), 1,39-1,29 (m, 2 H), 0,87 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 207

[00641] 1-metil-2-[3-(3-metil-2-buteneóxi)-piridin-4-il]-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 207) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 206, usando 3-metil-2-buten-1-ol em vez de 1-butanol.

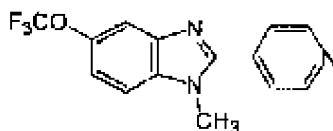


#### Presente composto ativo 207

[00642]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,50 (s, 1 H), 8,44 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,11 (s, 1 H), 7,61 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 7,55 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 7,51 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 5,34 (t,  $J = 6,7$  Hz, 1 H), 4,68 (d,  $J = 6,7$  Hz, 2 H), 3,73 (s, 3 H), 1,73 (s, 3 H), 1,68 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 208

[00643] 1-metil-2-piridin-4-il-6-trifluorometóxi-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 208) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 201, usando N1-metil-4-trifluorometoxibenzeno-1,2-diamina em vez de N1-sec-butil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina.

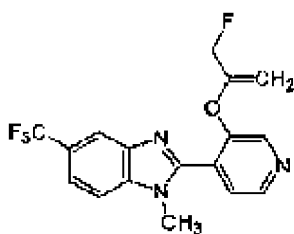


#### Presente composto ativo 208

[00644]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,83 (dd,  $J = 4,4, 1,7$  Hz, 2 H), 7,72 (brs, 1 H), 7,71 (dd,  $J = 4,4, 1,7$  Hz, 2 H), 7,43 (d,  $J = 8,8$  Hz, 1 H), 7,29 (brs, 1 H), 3,95 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 209

[00645] 2-[3-(1-fluorometil-vinilóxi)-piridin-4-il]-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 209) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 206, usando 1,3-difluoroisopropanol em vez de 1-butanol.



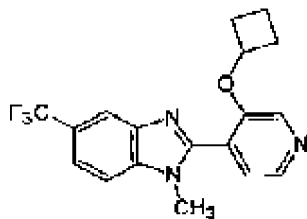
#### Presente composto ativo 209

[00646]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,69-8,66 (m, 2 H), 8,11 (s, 1 H), 7,69 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1 H), 7,63 (d,  $J = 8,1$  Hz, 1 H), 7,52 (d,  $J = 8,1$  Hz, 1 H), 4,75 (d,  $J = 47,1$  Hz, 2 H), 4,50 (t,  $J = 3,5$  Hz, 1 H), 4,22 (d,  $J = 3,5$  Hz, 1 H), 3,80 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 210

[00647] 2-(3-ciclobutoxipiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 210) foi

obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 206, usando ciclobutanol em vez de 1-butanol.

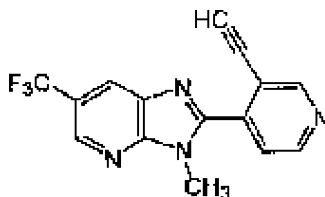


#### Presente composto ativo 210

[00648]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,43 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,35 (s, 1 H), 8,12 (s, 1 H), 7,62 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 7,55 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 7,52 (d,  $J = 8,7$  Hz, 1 H), 4,85-4,77 (m, 1 H), 3,76 (s, 3 H), 2,52-2,43 (m, 2 H), 2,17-2,07 (m, 2 H), 1,90-1,80 (m, 1 H), 1,77-1,66 (m, 1H)

#### Exemplo de Produção 211

[00649] Uma mistura de 0,29 g de N2-metil-5-trifluorometilpiridina-2,3-diamina, 0,27 g de ácido 3-etinilisonicotínico, 0,35 g de WSC e 8 ml de piridina foi agitada durante 2 horas a  $120^\circ\text{C}$ . A mistura reacional foi resfriada em temperatura ambiente. Na mistura reacional foi vertido água, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,15 g de 2-(3-etinilpiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 211).

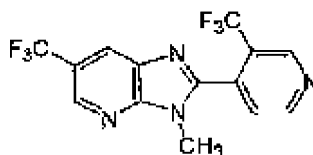


#### Presente composto ativo 211

[00650]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,96 (s, 1 H), 8,80 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 8,76 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 8,37 (d,  $J = 1,5$  Hz, 1 H), 7,56 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 3,91 (s, 3 H), 3,27 (s, 1H)

Exemplo de Produção 212

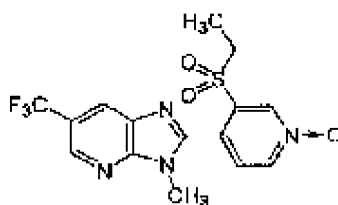
[00651] 3-metil-6-trifluorometil-2-(3-trifluorometilpiridin-4-il)-3H-imidazo [4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 212) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 211. usando ácido 3-trifluorometilisonicotínico em vez de ácido 3-etinilisonicotínico.

Presente composto ativo 212

[00652]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 9,18 (s, 1 H), 9,05 (d, J = 4,8 Hz, 1 H), 8,78 (d, J = 1,9 Hz, 1 H), 8,37 (d, J = 1,9 Hz, 1 H), 7,52 (d, J = 4,8 Hz, 1 H), 3,75 (s, 3 H)

Exemplo de Produção 213

[00653] Em uma mistura de 0,34 g de 2-(3-etilpiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina e 10 ml de clorofórmio, foi adicionado 0,75 g de ácido m-cloroperbenzoico a 69% sob resfriamento com gelo, em seguida, a mistura foi agitada em temperatura ambiente durante 2,5 horas, e a 40°C durante 1,5 hora. Na mistura reacional, uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada e uma solução aquosa de tiosulfato de sódio saturada foram vertidas, e a mistura foi extraída três vezes com clorofórmio. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,20 g de 2-(3-etanossulfonil-1-óxi-piridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 213).

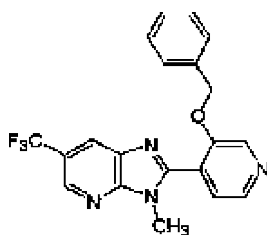


#### Presente composto ativo 213

[00654]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,87 (d,  $J = 1,9$  Hz, 1 H), 8,78 (d,  $J = 1,9$  Hz, 1 H), 8,49 (ddd,  $J = 6,8, 1,9, 0,5$  Hz, 1 H), 8,31 (d,  $J = 1,9$  Hz, 1 H), 7,45 (d,  $J = 6,8$  Hz, 1 H), 3,80 (d,  $J = 0,5$  Hz, 3 H), 3,55 (q,  $J = 7,4$  Hz, 2 H), 1,35 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 214

[00655] 2-(3-benziloxipiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 214) foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção 206, usando álcool benzílico em vez de 1-butanol e usando 2-(3-fluoropiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina em vez de 2-(3-fluoropiridin-4-il)-1-metil-5-trifluorometil-1H-benzimidazol.



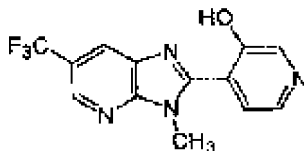
#### Presente composto ativo 214

[00656]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,72-8,70 (m, 1 H), 8,61 (s, 1 H), 8,49 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,33 (d,  $J = 1,7$  Hz, 1 H), 7,55 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 7,33-7,24 (m, 5 H), 5,24 (s, 2 H), 3,79 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 215

[00657] Uma mistura de 1,16 g de 2-(3-benziloxipiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina, 60 ml de etanol e 0,12 g de carvão de paládio a 5% foi agitada durante 3 horas em temperatura ambiente sob uma atmosfera de hidrogênio de cerca de 1 atm. A

mistura foi filtrada através de Celite (marca registrada), e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida, para obter 0,27 g de 4-(3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina-2-il)-piridin-3-ol (em seguida, chamado presente composto ativo 215).

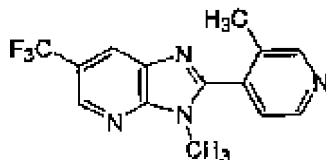


#### Presente composto ativo 215

[00658]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 12,67 (brs, 1 H), 8,78 (dd,  $J = 2,0, 0,5$  Hz, 1 H), 8,65 (s, 1 H), 8,35 (dd,  $J = 2,0, 0,5$  Hz, 1 H), 8,33 (d,  $J = 5,2$  Hz, 1 H), 7,75 (dd,  $J = 5,2, 0,5$  Hz, 1 H), 4,32 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 216

[00659] Uma mistura de 0,40 g de N2-metil-5-trifluorometilpiridina-2,3-diamina, 0,32 g de ácido 3-metilisonicotínico, 0,44 g de WSC e 10 ml de piridina foi agitada durante 5 horas a 120°C. A mistura reacional foi resfriada em temperatura ambiente. Na mistura reacional foi vertido água, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foi adicionada uma mistura de 0,60 g de mono-hidrato de ácido p-toluenossulfônico e 10 ml de tolueno, e a mistura foi agitada durante 1 hora a 120°C. Tolueno foi destilado desta mistura. Ao resíduo foram adicionados 10 ml de brometo de fenila, e a mistura foi agitada durante 4 horas a 150°C. A mistura reacional foi resfriada em temperatura ambiente. Na mistura reacional foi vertido água, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,14 g de 3-metil-2-(3-metilpiridin-4-il)-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 216).

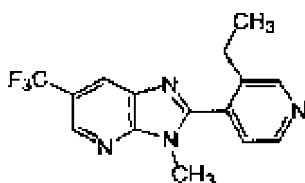


#### Presente composto ativo 216

[00660]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,76-8,74 (m, 1 H), 8,72 (d,  $J = 0,5$  Hz, 1 H), 8,67 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 8,35 (d,  $J = 2,2$  Hz, 1 H), 7,35 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1 H), 3,80 (s, 3 H), 2,35 (s, 3 H)

#### Exemplo de Produção 217

[00661] Uma mistura de 0,40 g de N2-metil-5-trifluorometilpiridina-2,3-diamina, 0,41 g de ácido 3-etilisonicotínico, 0,44 g de WSC e 10 ml de piridina foi agitada durante 2,5 horas a  $120^\circ\text{C}$ . A mistura reacional foi resfriada em temperatura ambiente. Na mistura reacional foi vertido água, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foi adicionada uma mistura de 0,60 g de monoidrato de ácido p-toluenossulfônico e 10 ml de tolueno, e a mistura foi agitada durante 7 horas a  $120^\circ\text{C}$ . A mistura reacional foi resfriada em temperatura ambiente. Na mistura reacional foi vertido água, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,10 g de 2-(3-etilpiridin-4-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (em seguida, chamado presente composto ativo 217).



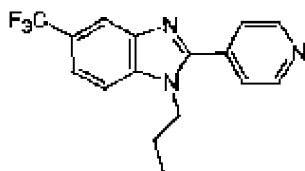
#### Presente composto ativo 217

[00662]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,76-8,74 (m, 2 H), 8,67 (d,  $J = 5,0$  Hz,

1 H), 8,35 (d, J = 1,9 Hz, 1 H), 7,31 (d, J = 5,0 Hz, 1 H), 3,78 (s, 3 H), 2,70 (q, J = 7,6 Hz, 2 H), 1,14 (t, J = 7,6 Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção 218

[00663] Uma mistura de 0,44 g de N1-propil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina, 0,51 g de aduzido de isonicotinaaldeído-bissulfito e 4 ml de N,N-dimetilformamida foi agitada durante 1 hora a 150°C. A mistura reacional foi permitida resfriar em temperatura ambiente, e água foi vertida nisto, e a mistura foi extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com água, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida para obter um resíduo sólido. O resíduo foi lavado com hexano, para obter 0,55 g de 1-propil-2-(piridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 218).



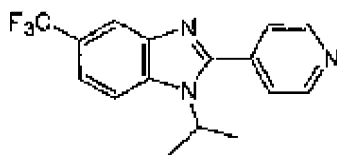
#### Presente composto ativo 218

[00664] <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8,84 (dd, 2 H), 8,13 (s, 1 H), 7,66 (dd, 2 H), 7,61 (dd, 1 H), 7,54 (d, 1 H), 4,28 (t, 2 H), 1,92-1,82 (m, 2 H), 0,90 (t, 3 H).

#### Exemplo de Produção 219

[00665] Uma mistura de 0,44 g de N1-isopropil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina, 0,51 g de aduzido de isonicotinaaldeído-bissulfito e 4 ml de N,N-dimetilformamida foi agitada durante 1 hora a 150°C. A mistura reacional foi permitida resfriar em temperatura ambiente, e água foi vertida nisto, e a mistura foi extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com água, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida para obter um resíduo sólido. O resíduo foi lavado com hexano, para obter 0,50 g de 1-isopropil-2-(piridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzi-

imidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 219).

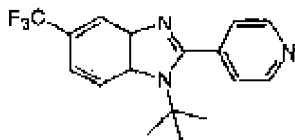


#### Presente composto ativo 219

[00666]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,84 (dd, 2 H), 8,12 (d, 1 H), 7,74 (d, 1 H), 7,58-7,55 (m, 3 H), 4,88-4,78 (m, 1 H), 1,70 (d, 6H).

#### Exemplo de Produção 220

[00667] Uma mistura de 0,47 g de N1-terc-butil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina, 0,51 g de aduzido de isonicotinaaldeído-bissulfito e 5 ml de N,N-dimetilformamida foi agitada durante 10 minutos a  $150^\circ\text{C}$ . A mistura reacional foi resfriada com gelo, em seguida, uma solução aquosa de hidróxido de sódio a 10% foi vertida, e a mistura foi extraída com metil terc-butil éter. A camada orgânica foi lavada com água, seca em sulfato de sódio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida para obter um resíduo sólido. O resíduo foi lavado com hexano, para obter 0,26 g de 1-terc-butil-2-(piridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 220).



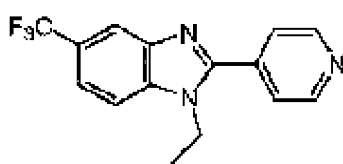
#### Presente composto ativo 220

[00668]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,75 (dd, 2 H), 8,05 (s, 1 H), 7,84 (d, 1 H), 7,56 (d, 1 H), 7,44 (dd, 2 H), 1,67 (s, 9H).

#### Exemplo de Produção 221

[00669] Uma mistura de 1,0 g de N1-etil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina, 1,05 g de cloridrato de cloreto de isonicotinoíla e 15 ml de piridina foi agitada durante 4 horas a  $60^\circ\text{C}$ . Em seguida, 0,94 g de WSC foi adicionado, e a mistura foi agitada durante 8 horas a  $80^\circ\text{C}$ . A

mistura reacional foi arrefecida em temperatura ambiente. Na mistura reacional foi vertido água, e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com água e solução salina saturada, em seguida, seca em sulfato de magnésio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,65 g de 1-etil-2-(piridin-4-il)-5-trifluorometil-1H-benzimidazol (em seguida, chamado presente composto ativo 221).



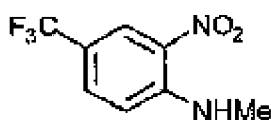
#### Presente composto ativo 221

[00670]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,84 (dd,  $J = 4,4, 1,7$  Hz, 2 H), 8,14-8,13 (m, 1 H), 7,68 (dd,  $J = 4,4, 1,7$  Hz, 2 H), 7,64-7,60 (m, 1 H), 7,55 (d,  $J = 8,5$  Hz, 1 H), 4,37 (q,  $J = 7,2$  Hz, 2 H), 1,53 (t,  $J = 7,2$  Hz, 3 H)

[00671] A seguir, são mostrados exemplos de produção de referência para produção de intermediários de produção dos presentes compostos ativos acima descritos.

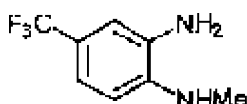
#### Exemplo de Produção de Referência 1

[00672] Em uma mistura de 2,09 g de 4-fluoro-3-nitrobenzotrifluoreto e 20 ml de N-metilpirrolidona foram adicionados 2,33 g de uma solução aquosa de metilamina a 40% sob resfriamento com gelo, e a mistura foi aquecida em temperatura ambiente e agitada durante 1 hora. Água foi vertida, e o precipitado depositado foi filtrado, em seguida, lavado com água, em seguida, seco sob pressão reduzida para obter 2,0 g de N-metil-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00673]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,48 (s, 1 H), 8,28 (br s, 1 H), 7,65 (dd,

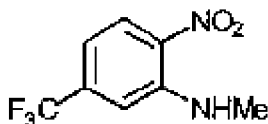
J = 9,0, 2,1 Hz, 1 H), 6,94 (d, J = 9,0 Hz, 1 H), 3,09 (d, J = 5,1 Hz, 3 H)  
 [00674] Uma mistura de 2,0 g de N-metil-2-nitro-4-trifluorometilanilina, 18 ml de etanol e 0,20 g de carvão de paládio a 5% foi agitada durante 3 horas em temperatura ambiente sob uma atmosfera de hidrogênio de cerca de 1 atm. A mistura foi filtrada através de Celite (marca registrada), e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para obter 1,17 g de N-1-metil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina.



[00675] <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ: 7,14-7,10 (m, 1 H), 6,92 (d, J = 2,0 Hz, 1 H), 6,63 (d, J = 8,3 Hz, 1 H), 3,73 (br s, 1 H), 3,34 (br s, 2 H), 2,90 (d, J = 5,1 Hz, 3 H)

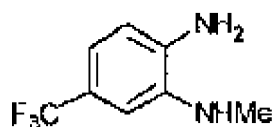
#### Exemplo de Produção de Referência 2

[00676] N-metil-2-nitro-5-trifluorometilanilina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 1, usando 2-cloro-1-nitro-4-trifluorometilbenzeno em vez de 4-fluoro-3-nitrobenzotrifluoreto.



[00677] <sup>1</sup>H-RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8,29 (d, J = 8,9 Hz, 1 H), 8,09 (br s, 1 H), 7,10 (s, 1 H), 6,87 (dd, J = 8,9, 1,7 Hz, 1 H), 3,08 (d, J = 5,1 Hz, 3 H)

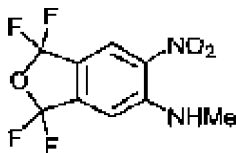
[00678] N2-metil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 1, usando N-metil-2-nitro-5-trifluorometilanilina em vez de N-metil-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00679]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 6,95 (d,  $J = 7,8$  Hz, 1 H), 6,83 (s, 1 H), 6,72 (d,  $J = 7,8$  Hz, 1 H), 3,55 (br s, 2 H), 3,39 (br s, 1 H), 2,89 (d,  $J = 5,6$  Hz, 3 H)

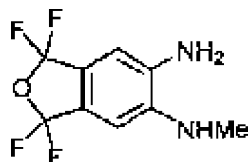
#### Exemplo de Produção de Referência 3

[00680] N-metil(1,1,3,3-tetrafluoro-6-nitro-1,3-di-hidro-isobenzofuran-5-il)-amina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 1, usando 5-cloro-1,1,3,3-tetrafluoro-6-nitro-1,3-di-hidro-isobenzofurano em vez de 4-fluoro-3-nitrobenzotrifluoreto.



[00681]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,50 (s, 1 H), 8,41 (br s, 1 H), 7,07 (s, 1 H), 3,13 (d,  $J = 4,9$  Hz, 3 H)

[00682] 1,1,3,3-tetrafluoro-N-metil-1,3-di-hidroisobenzofuran-5,6-diamina foram obtidos de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 1, usando N-metil-(1,1,3,3-tetrafluoro-6-nitro-1,3-di-hidro-isobenzofuran-5-il)-amina em vez de N-metil-2-nitro-4-trifluorometilanilina.

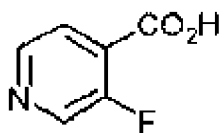


[00683]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 6,84 (s, 1 H), 6,72 (s, 1 H), 3,83 (br s, 1 H), 3,65 (br s, 2 H), 2,94 (d,  $J = 5,1$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção de Referência 4

[00684] Em uma mistura de 39,9 ml de di-isopropilamina e 257 ml de tetra-hidrofurano foram adicionados 107 ml de uma solução de

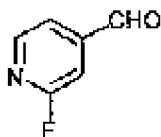
hexano a 2,64 M de n-butilítio sob agitação ao mesmo tempo que resfriando a mistura em um banho de gelo seco-acetona, em seguida, a mistura foi agitada durante 1,5 hora. Em seguida, 25,0 g de 3-fluoropiridina foram adicionados, e a mistura também foi agitada durante 1,5 hora. Gelo seco moído foi adicionado à mistura reacional, em seguida, o resfriamento foi interrompido, e a mistura foi agitada até retornar à temperatura ambiente. Água foi adicionada, e a maior parte de hexano e tetra-hidrofurano foi destilada sob pressão reduzida. O resíduo foi lavado com terc-butil metil éter, e a camada aquosa foi recuperada. À camada aquosa resultante foi adicionado ácido clorídrico concentrado sob resfriamento com gelo, e o pH da mistura foi ajustado a 3, e a mistura foi agitada durante 1 hora. O depósito foi coletado por filtração e seco sob pressão reduzida para obter 32,51 g de ácido 3-fluoroisonicotínico.



[00685]  $^1\text{H}$ -RMN (DMSO- $d_6$ )  $\delta$ : 8,74 (d,  $J = 2,4$  Hz, 1 H), 8,58 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 7,80-7,77 (m, 1H)

#### Exemplo de Produção de Referência 5

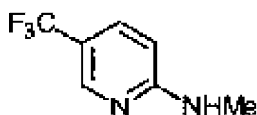
[00686] Uma mistura de 0,64 g de 2-fluoro-4-piridinametanol, 10 ml de clorofórmio e 2,54 g de Periodinano de Dess-Martin (1,1,1-triacetóxi-1,1-di-hidro-1,2-benziodoxol-3(1H)-ona) foi agitada durante 30 minutos em temperatura ambiente. Uma solução aquosa de hidrogenocarbonato de sódio saturada foi vertida, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. As camadas orgânicas combinadas foram secas em sulfato de magnésio, em seguida, concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,19 g de 2-fluoropiridina-4-carbaldeído.



[00687]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 10,09 (d,  $J = 1,2$  Hz, 1 H), 8,49 (d,  $J = 4,9$  Hz, 1 H), 7,65-7,62 (m, 1 H), 7,38-7,36 (m, 1H)

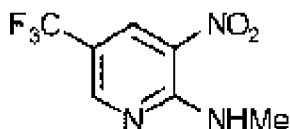
#### Exemplo de Produção de Referência 6

[00688] Em uma mistura de 18,2 g de 2-cloro-5-trifluorometilpiridina e 100 ml de N-metilpirrolidona foram adicionados 23,3 g de uma solução aquosa de metilamina a 40%, e a mistura foi agitada durante 3 horas em temperatura ambiente. Água foi vertida, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. As camadas orgânicas combinadas foram secas em sulfato de magnésio, em seguida, concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 17,3 g de N-metil-(5-trifluorometilpiridina-2-il)-amina.



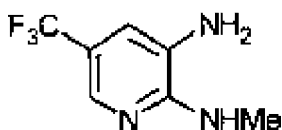
[00689]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,34 (s, 1 H), 7,60 (dd,  $J = 8,8, 2,4$  Hz, 1 H), 6,40 (d,  $J = 8,8$  Hz, 1 H), 4,89 (br s, 1 H), 2,97 (d,  $J = 5,1$  Hz, 3 H)

[00690] Em uma mistura de 17,3 g de N-metil(5-trifluorometilpiridin-2-il)-amina e 100 ml de ácido sulfúrico foi gotejado 12,3 g de ácido nítrico, em seguida, a mistura foi agitada durante 2 horas, ao mesmo tempo que aquecendo a  $80^\circ\text{C}$ . Depois de arrefecer em temperatura ambiente, água foi vertida na mistura reacional, e o precipitado depositado foi filtrado, em seguida, lavado com água, em seguida, seco sob pressão reduzida para obter 18,8 g de N-metil(3-nitro-5-trifluorometilpiridin-2-il)-amina.



[00691]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,66-8,64 (m, 2 H), 8,43 (br s, 1 H), 3,23 (d,  $J = 4,9$  Hz, 3 H)

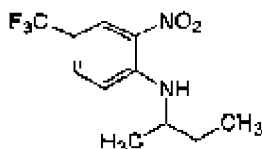
[00692] N2-metil-5-trifluorometilpiridina-2,3-diamina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 1, usando N-metil(3-nitro-5-trifluorometilpiridin-2-il)-amina em vez de N-metil-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00693]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,04 (s, 1 H), 6,98 (d,  $J = 1,7$  Hz, 1 H), 4,56 (br s, 1 H), 3,25 (br s, 2 H), 3,06 (d,  $J = 4,9$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção de Referência 201

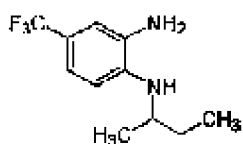
[00694] Em uma mistura de 1,05 g de 4-fluoro-3-nitro-benzotrifluoreto e 10 ml de N-metilpirrolidona foi adicionado 1,10 g de sec-butilamina sob resfriamento com gelo, e a mistura foi aquecida em temperatura ambiente e agitada durante 1,5 hora. Na mistura reacional foi vertido água, e o sólido depositado foi coletado por filtração. Este sólido foi lavado com água, em seguida, seco sob pressão reduzida para obter 1,16 g de N-sec-butil-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00695]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,48-8,46 (m, 1 H), 8,25 (brs, 1 H), 7,59 (dd,  $J = 9,2, 2,2$  Hz, 1 H), 6,94 (d,  $J = 9,2$  Hz, 1 H), 3,72-3,62 (m, 1 H), 1,77-1,61 (m, 2 H), 1,32 (d,  $J = 6,3$  Hz, 3 H), 1,01 (t,  $J = 7,6$  Hz, 3 H)

[00696] Uma mistura de 1,16 g de N-(sec-butil)-2-nitro-4-

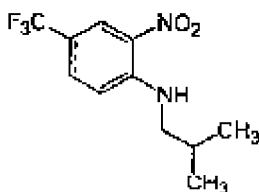
trifluorometilanilina, 9 ml de etanol e 0,12 g de carvão de paládio a 5% foi agitada durante 5,5 horas em temperatura ambiente sob uma atmosfera de hidrogênio de cerca de 1 atm. A mistura reacional foi filtrada através de Celite (marca registrada), e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 0,76 g de N1-sec-butil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina.



[00697]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 7,10-7,06 (m, 1 H), 6,93 (d,  $J = 2,0$  Hz, 1 H), 6,61 (d,  $J = 8,3$  Hz, 1 H), 3,56 (brs, 1 H), 3,47-3,38 (m, 1 H), 3,30 (br s, 2 H), 1,71-1,59 (m, 1 H), 1,58-1,46 (m, 1 H), 1,21 (d,  $J = 6,1$  Hz, 3 H), 0,98 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H)

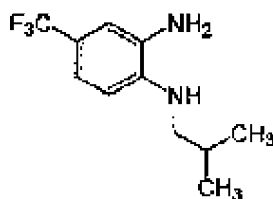
#### Exemplo de Produção de Referência 202

[00698] N-isobutil-2-nitro-4-trifluorometilanilina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 201, usando isobutilamina em vez de sec-butilamina.



[00699]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,48-8,46 (m, 1 H), 8,39 (brs, 1 H), 7,60 (dd,  $J = 9,0, 2,3$  Hz, 1 H), 6,93 (d,  $J = 9,0$  Hz, 1 H), 3,17 (dd,  $J = 6,8, 5,4$  Hz, 2 H), 2,09-1,98 (m, 1 H), 1,08 (s, 3 H), 1,06 (s, 3 H)

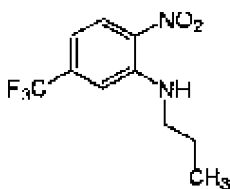
[00700] N1-isobutil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 201, usando N-isobutil-2-nitro-4-trifluorometilanilina em vez de N-(sec-butil)-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00701]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 7,11-7,06 (m, 1 H), 6,93 (d,  $J = 2,0$  Hz, 1 H), 6,62 (d,  $J = 8,3$  Hz, 1 H), 3,74 (brs, 1 H), 3,32 (br s, 2 H), 2,96 (m, 2 H), 1,99-1,86 (m, 1 H), 1,03 (s, 3 H), 1,01 (s, 3 H)

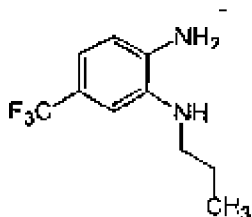
#### Exemplo de Produção de Referência 203

[00702] N-propil-2-nitro-5-trifluorometilanilina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 201, usando 2-cloro-1-nitro-4-trifluorobenzeno em vez de 4-fluoro-3-nitro-benzotrifluoreto e usando propilamina em vez de sec-butilamina.



[00703]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,28 (d,  $J = 8,8$  Hz, 1 H), 8,09 (brs, 1 H), 7,09 (s, 1 H), 6,84 (dd,  $J = 8,8, 1,7$  Hz, 1 H), 3,34-3,28 (m, 2 H), 1,85-1,74 (m, 2 H), 1,08 (t,  $J = 7,5$  Hz, 3 H)

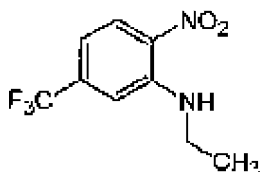
[00704] N2-propil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 201, usando N-propil-2-nitro-5-trifluoroinetilanilina em vez de N-(sec-butil)-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00705]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 6,95-6,92 (m, 1 H), 6,83 (d,  $J = 1,7$  Hz, 1 H), 6,72 (d,  $J = 8,0$  Hz, 1 H), 3,55 (br s, 2 H), 3,28 (brs, 1 H), 3,09 (t,  $J = 7,1$  Hz, 2 H), 1,76-1,66 (m, 2 H), 1,05 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H)

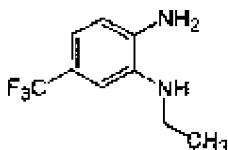
Exemplo de Produção de Referência 204

[00706] N-etil-2-nitro-5-trifluorometilanilina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 201, usando 2-cloro-1-nitro-4-trifluorobenzeno em vez de 4-fluoro-3-nitro-benzotrifluoreto e usando etilamina em vez de sec-butilamina.



[00707]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,28 (d,  $J = 9,0$  Hz, 1 H), 8,00 (brs, 1 H), 7,09 (s, 1H) 6,85 (dd,  $J = 9,0, 1,7$  Hz, 1 H), 3,43-3,35 (m, 2 H), 1,41 (t,  $J = 7,2$  Hz, 3 H)

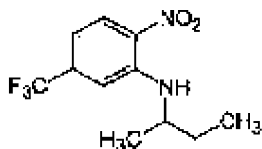
[00708] N2-etil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 201, usando N-etil-2-nitro-5-trifluorometilanilina em vez de N-(sec-butil)-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00709]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 6,94 (dt,  $J = 8,0, 0,9$  Hz, 1 H), 6,84 (s, 1 H), 6,72 (d,  $J = 8,0$  Hz, 1 H), 3,56 (br s, 2 H), 3,25-3,13 (m, 3 H), 1,32 (t,  $J = 7,0$  Hz, 3 H)

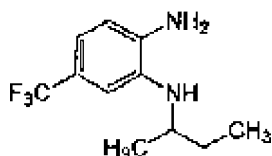
Exemplo de Produção de Referência 205

[00710] N-sec-butil-2-nitro-5-trifluorometilanilina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 201, usando 2-cloro-1-nitro-4-trifluorobenzeno em vez de 4-fluoro-3-nitro-benzotrifluoreto.



[00711]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,28 (d,  $J = 8,9$  Hz, 1 H), 8,07 (brs, 1 H), 7,09 (s, 1 H), 6,81 (dd,  $J = 8,9, 2,0$  Hz, 1 H), 3,72-3,60 (m, 1 H), 1,78-1,61 (m, 2 H), 1,31 (d,  $J = 6,3$  Hz, 3 H), 1,02 (t,  $J = 7,4$  Hz, 3 H)

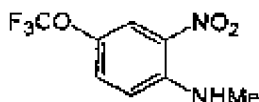
[00712] N2-sec-butil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina foi obtido de acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 201, usando N-sec-butil-2-nitro-5-trifluorometilanilina em vez de N-(sec-butil)-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00713]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 6,91 (dt,  $J = 8,0, 1,2$  Hz, 1 H), 6,82 (d,  $J = 1,2$  Hz, 1 H), 6,72 (d,  $J = 8,0$  Hz, 1 H), 3,54 (br s, 2 H), 3,44-3,34 (m, 1 H), 3,17 (brs, 1 H), 1,70-1,46 (m, 2 H), 0,98 (t,  $J = 7,5$  Hz, 3 H)

#### Exemplo de Produção de Referência 206

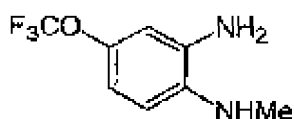
[00714] Em uma mistura de 2,22 g de 2-nitro-4-trifluorometoxianilina e 20 ml de DMF foi adicionado 0,44 g de hidreto de sódio (60% oleoso), e a mistura foi agitada durante 10 minutos sob resfriamento com gelo. A esta mistura foi adicionado 1,42 g de iodeto de metila, em seguida, a mistura foi agitada durante 1 hora em temperatura ambiente. Na mistura reacional, uma solução aquosa de cloreto de amônio saturada foi vertida, e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etila. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia de coluna em sílica-gel para obter 1,80 g de N-metil-2-nitro-4-trifluorometoxianilina.



[00715]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,10-8,01 (m, 2 H), 7,37 (dtd,  $J = 9,3, 1,8, 1,0$  Hz, 1 H), 6,87 (d,  $J = 9,3$  Hz, 1 H), 3,05 (d,  $J = 5,1$  Hz, 3 H)

[00716] N1-metil-4-trifluorometoxibenzeno-1,2-diamina foi obtido de

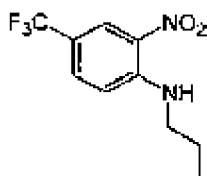
acordo com o método descrito no Exemplo de Produção de Referência 201, usando N-metil-2-nitro-4-trifluorometoxianilina em vez de N-(sec-butil)-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00717]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 6,72-6,67 (m, 1 H), 6,61-6,56 (m, 2 H), 3,42 (br s, 2 H), 3,30 (brs, 1 H), 2,86 (s, 3 H)

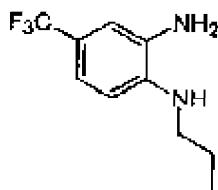
#### Exemplo de Produção de Referência 207

[00718] Em uma mistura de 5,23 g de 4-fluoro-3-nitro-benzotrifluoreto e 25 ml de N-metilpirrolidona foram adicionados 3,69 g de n-propilamina sob resfriamento com gelo, e a mistura foi agitada durante 1 hora em temperatura ambiente. A mistura reacional foi vertida em água, e o sólido depositado foi coletado por filtração. Este sólido foi lavado com água, em seguida, seco sob pressão reduzida para obter 2,78 g de N-propil-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00719]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,47 (d, 1 H), 8,29 (brs, 1 H), 7,61 (dd, 1 H), 6,94 (d, 1 H), 3,36-3,30 (m, 2 H), 1,84-1,74 (m, 2 H), 1,07 (t, 3 H).

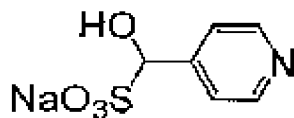
[00720] Uma mistura de 2,48 g de N-propil-2-nitro-4-trifluorometilanilina, 30 ml de acetato de etila e carvão de paládio a 5% foi agitada durante 1,5 hora em temperatura ambiente sob uma atmosfera de hidrogênio de cerca de 1 atm. A mistura reacional foi filtrada através de Celite (marca registrada). O filtrado foi lavado com água, seco em sulfato de sódio, em seguida, concentrado sob pressão reduzida, para obter 1,91 g de N1-propil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina.



[00721]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 7,09 (dd, 1 H), 6,92 (d, 1 H), 6,63 (d, 1 H), 3,66 (brs, 1 H), 3,32 (br s, 2 H), 3,11 (t, 2 H), 1,75-1,65 (m, 2 H), 1,03 (t, 3 H).

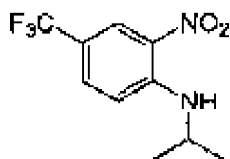
#### Exemplo de Produção de Referência 208

[00722] Uma mistura (150 ml) de 150 g de água e 80 g de bissulfato de sódio foi resfriada com gelo, e 17,0 g de isonicotinaaldeído e 20 ml de etanol foram adicionados nisto. O sólido depositado foi coletado por filtração. Este sólido foi lavado com água, para obter 24,9 g de um aduzido de isonicotinaaldeído-bissulfito.



#### Exemplo de Produção de Referência 209

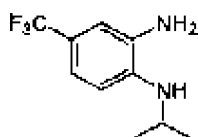
[00723] Em uma mistura de 5,23 g de 4-fluoro-3-nitro-benzotrifluoreto e 25 ml de N-metilpirrolidona foram adicionados 3,69 g de isopropilamina sob resfriamento com gelo, e a mistura foi agitada durante 1 hora em temperatura ambiente. A mistura reacional foi vertida em água, o sólido depositado foi coletado por filtração. Este sólido foi lavado com água, em seguida, seco sob pressão reduzida para obter 5,90 g de N-isopropil-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00724]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,47 (d, 1 H), 8,22 (brs, 1 H), 7,60 (dd, 1 H), 6,95 (d, 1 H), 3,94-3,82 (m, 1 H), 1,36 (d, 6H).

[00725] Uma mistura de 5,46 g de N-isopropil-2-nitro-4-

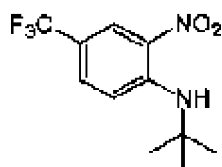
trifluorometilanilina, 30 ml de acetato de etila e carvão de paládio a 5% (quantidade catalítica) foi agitada durante 1,5 hora em temperatura ambiente sob uma atmosfera de hidrogênio de cerca de 1 atm. A mistura reacional foi filtrada através de Celite (marca registrada). O filtrado foi lavado com água, seco em sulfato de sódio, em seguida, concentrado sob pressão reduzida, para obter 4,35 g de N1-isopropil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina.



[00726]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 7,08 (dd, 1 H), 6,93 (d, 1 H), 6,63 (d, 1 H), 3,65 (brs, 1 H), 3,54 (brs, 1 H), 3,31 (br s, 2 H), 1,25 (d, 6H).

#### Exemplo de Produção de Referência 210

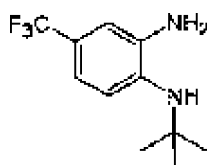
[00727] Em uma mistura de 5,22 g de 4-fluoro-3-nitrobenzotrifluoreto e 25 ml de N-metilpirrolidona foram adicionados 3,88 g de terc-butilamina, e a mistura foi agitada durante 2 horas em temperatura ambiente. A mistura reacional foi vertida em água, o sólido depositado foi coletado por filtração. Este sólido foi lavado com água, em seguida, seco sob pressão reduzida, para obter 5,35 g de N-terc-butil-2-nitro-4-trifluorometilanilina.



[00728]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,61 (brs, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 7,56 (dd, 1 H), 7,18 (d, 1 H), 1,53 (s, 9H).

[00729] Uma mistura de 5,25 g de N-terc-butil-2-nitro-4-trifluorometilanilina, 20 ml de acetato de etila e carvão de paládio a 5% foi agitada durante 9 horas em temperatura ambiente sob uma atmosfera de hidrogênio de cerca de 1 atm. A mistura reacional foi filtrada através de Celite (marca registrada). O filtrado foi lavado com

água, seco em sulfato de sódio, em seguida, concentrado sob pressão reduzida para obter um resíduo. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia de sílica-gel para obter 4,82 g de N1-terc-butil-4-trifluorometilbenzeno-1,2-diamina.



[00730]  $^1\text{H}$ -RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 7,03 (d, 1 H), 6,94 (s, 1 H), 6,89 (d, 1 H), 3,54 (brs, 1 H), 3,40 (br s, 2 H), 1,39 (s, 9H).

[00731] A seguir, são mostrados exemplos de formulação dos presentes compostos ativos. As partes estão em peso.

#### Exemplo de Formulação 1

[00732] Cada 10 partes dos presentes compostos ativos (1) a (56), (101) a (158) e (201) a (221) foram dissolvidas em uma mistura composta de 35 partes de xileno e 35 partes de N,N-dimetilformamida, e foram adicionadas 14 partes de estiril fenil éter de polioxietileno e 6 partes de dodecilbenzenossulfonato de cálcio e completamente agitadas e misturadas, para obter concentrados emulsificáveis a 10%.

#### Exemplo de Formulação 2

[00733] Cada 20 partes dos presentes compostos ativos (1) a (56), (101) a (158) e (201) a (221) foram adicionadas a uma mistura de 4 partes de lauril sulfato de sódio, 2 partes de ligninassulfonato de cálcio, 20 partes de pó fino de óxido de silício hidratado sintético e 54 partes de terra diatomácea, e a mistura foi agitada completamente e misturada, para obter 20% de pós umectáveis.

#### Exemplo de Formulação 3

[00734] Em cada 2 partes dos presentes compostos ativos (1) a (56), (101) a (158) e (201) a (221) foi adicionado 1 parte de pó fino de óxido de silício hidratado sintético, 2 partes de ligninassulfonato de cálcio, 30 partes de bentonita e 65 partes de argila caulim, e as

misturas foram agitadas e misturadas suficientemente. Em seguida, uma quantidade adequada de água foi adicionada às misturas, e as misturas também foram agitadas e granuladas por um granulator, e secas sob ar para obter 2% de grânulos.

#### Exemplo de Formulação 4

[00735] Cada 1 parte dos presentes compostos ativos (1) a (56), (101) a (158) e (201) a (221) foi dissolvida em uma quantidade adequada de acetona, e 5 partes de pó fino de óxido de silício hidratado sintético, 0,3 parte de PAP e 93,7 partes de argila Fubasami foram adicionadas a elas, e as misturas foram agitadas e misturadas suficientemente, e acetona foi removida através de destilação para obter 1% de grânulos.

#### Exemplo de Formulação 5

[00736] Cada 10 partes dos presentes compostos ativos (1) a (56), (101) a (158) e (201) a (221), 35 partes de carbono branco que contém 50 partes de sal de amônio de sulfato de alquil éter de polioxietileno; e 55 partes de água foram misturadas, e finamente moídas por um método de moagem úmida, para obter 10% de formulações fluíveis.

#### Exemplo de Formulação 6

[00737] Cada 0,1 parte dos presentes compostos ativos (1) a (56), (101) a (158) e (201) a (221) foi dissolvida em 5 partes de xileno e 5 partes de tricloroetano, e estas foram misturadas com 89,9 partes de querosene desodorizado, para obter 0,1% de soluções em óleo.

#### Exemplo de Formulação 7

[00738] Cada 10 mg dos presentes compostos ativos (1) a (56), (101) a (158) e (201) a (221) foram dissolvidos em 0,5 ml de acetona, e as soluções foram tratadas com 5 g de um pó de alimento sólido animal (pó de alimento sólido de procriação-propagação CE-2, fabricado por CLEA Japan Inc.), e misturadas uniformemente. Em seguida, acetona foi seca por destilação, para obter iscas de veneno.

Exemplo de Formulação 8

[00739] Cada 0,1 parte dos presentes compostos ativos (1) a (56), (101) a (158) e (201) a (221) e 49,9 partes de Neothiozole (Chuo Kasei Co. Ltd.) foram carregadas em uma lata de aerossol, que foi em seguida equipada com uma válvula de aerossol, em seguida, 25 partes de dimetil éter e 25 partes de LPG foram carregadas em, e vibração foi aplicada, e um acionador foi montado para obter um aerossol de solução em óleo.

Exemplo de Formulação 9

[00740] Cada 0,6 partes dos presentes compostos ativos (1) a (56), (101) a (158) e (201) a (221), 0,01 parte de BHT, 5 partes de xileno, 3,39 partes de querosene desodorizado e 1 parte de um concentrado emulsificável {Atmos 300 (marca registrada de Atmos Chemical)} foram misturadas e dissolvidas, e as soluções resultantes e 50 partes de água destilada foram carregadas em um vaso de aerossol, que foi em seguida equipado com uma válvula, em seguida, 40 partes de um agente de injeção (LPG) foram carregadas sob prensa através da válvula, para obter um aerossol aquoso.

[00741] Em seguida, o artrópode nocivo que controla o efeito do presente composto ativo é mostrado pelos exemplos teste.

Exemplo Teste 1

[00742] As formulações dos presentes compostos ativos (1) a (15), (17) a (25), (27) a (56), (101) a (103), (105) a (108), (117), (118), (121) a (130), (133) a (144), (147), (148), (152) a (156), (202), (204) a (206), (208), (209), (211) a (213) e (216) a (221) obtidas pelo Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água de forma que a concentração de ingrediente ativa seja 500 ppm, para preparar soluções em spray para teste.

[00743] Separadamente, uma muda de pepino (estágio de propagação de segunda folhas definitivas) plantada em um copo de

plástico foi inoculada com aproximadamente 30 *Aphis gossypii*, e deixada durante 1 dia. As soluções diluídas acima descritas foram pulverizadas cada qual em uma quantidade de 10 ml nesta muda.

[00744] Cinco dias depois da pulverização, o número de inseto de *Aphis gossypii* vivos parasitado nas folhas deste pepino foi conferido, e o valor de controle foi calculado de acordo com a seguinte fórmula.

[00745] Valor de controle (%) =  $\{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$

[00746] Letras na fórmula representam os seguintes significados.

[00747] Cb: o número de inseto antes do tratamento no distrito não tratado

[00748] Cai: o número de inseto em observação no distrito não tratado

[00749] Tb: o número de inseto antes do tratamento no distrito tratado

[00750] Tai: o número de inseto em observação no distrito tratado

[00751] Como um resultado, 90% ou mais de valor de controle foram obtidos em todos os distritos tratados com as soluções em spray para teste dos presentes compostos ativos (1) a (15), (17) a (25), (27) a (56), (101) a (103), (105) a (108), (117), (118), (121) a (130), (133) a (144), (147), (148), (152) a (156), (202), (204) a (206), (208), (209), (211) a (213) e (216) a (221).

### Exemplo Teste 2

[00752] As formulações dos presentes compostos ativos (4), (5), (8), (9), (11), (12), (14), (15), (17), (20), (35) a (45), (48) a (51), (54) a (56), (206), (209) e (211) a (213) obtidas pelo Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água, de forma que a concentração de ingrediente ativa seja 500 ppm, para preparar soluções diluídas para teste.

[00753] Separadamente, uma muda de pepino (estágio de propagação de segunda folha definitivas) plantada em uma esteira de

uretano foi molhada a seu pé cada qual com 5 ml das soluções diluídas, e um dia depois do tratamento, a superfície da folha de pepino foi inoculada com 30 *Aphis gossypii* (estágio total). Além disso, sete dias depois, o número de inseto de *Aphis gossypii* vivos parasitado nas folhas deste pepino foi conferido, e o valor de controle foi calculado de acordo com a seguinte fórmula.

[00754] Valor de controle (%) =  $\{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$

[00755] Letras na fórmula representam os seguintes significados.

[00756] Cb: o número de inseto antes do tratamento no distrito não tratado

[00757] Cai: o número de inseto em observação no distrito não tratado

[00758] Tb: o número de inseto antes do tratamento no distrito tratado

[00759] Tai: o número de inseto em observação no distrito tratado

[00760] Como um resultado, 90% ou mais de valor de controle foram obtidos em todos os distritos tratados com as soluções diluídas para teste dos presentes compostos ativos (4), (5), (8), (9), (11), (12), (14), (15), (17), (20), (35) a (45), (48) a (51), (54) a (56), (206), (209) e (211) a (213).

### Exemplo Teste 3

[00761] As formulações dos presentes compostos ativos (18), (19), (21), (22), (24), (25), (28), (31) a (34), (46), (47), (52), (53), (101) a (104), (106) a (108), (112) a (114), (117), (118), (122), (123), (126), (128), (129), (133), (134), (138), (144), (153) a (155) e (157) obtidas pelo Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água, de forma que a concentração de ingrediente ativa seja 500 ppm, para preparar soluções diluídas para teste.

[00762] Uma parte da raiz de uma muda de pepino (estágio de propagação de primeira folha definitiva) da qual o solo foi lavado, foi

imersa em 5 ml desta solução diluída, e um dia depois do tratamento, a superfície da folha de pepino foi inoculada com 30 *Aphis gossypii* (estágio total). Além disso, sete dias depois, o número de inseto de *Aphis gossypii* vivos parasitado nas folhas deste pepino foi conferido, e o valor de controle foi calculado de acordo com a seguinte fórmula.

[00763] Valor de controle (%) =  $\{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$

[00764] Letras na fórmula representam os seguintes significados.

[00765] Cb: o número de inseto antes do tratamento no distrito não tratado

[00766] Cai: o número de inseto em observação no distrito não tratado

[00767] Tb: o número de inseto antes do tratamento no distrito tratado

[00768] Tai: o número de inseto em observação no distrito tratado

[00769] Como um resultado, 90% ou mais de valor de controle foram obtidos em todos os distritos tratados com as soluções diluídas para teste dos presentes compostos ativos (18), (19), (21), (22), (24), (25), (28), (31) a (34), (46), (47), (52), (53), (101) a (104), (106) a (108), (112) a (114), (117), (118), (122), (123), (126), (128), (129), (133), (134), (138), (144), (153) a (155) e (157).

#### Exemplo Teste 4

[00770] As formulações dos presentes compostos ativos (3) a (7), (17), (19), (20), (22), (29) a (31), (35) a (37), (39), (41) a (45), (47) a (56), (101), (106), (121) a (123), (128), (131), (137), (139), (143), (145), (147), (211) a (213), (216) e (217) obtidas pelo Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água, de forma que a concentração de ingrediente ativa seja 500 ppm, para preparar soluções diluídas para teste.

[00771] Separadamente, uma muda de pepino (estágio de propagação de segunda folhas definitivas) plantada em um copo de

plástico foi molhada a seu pé, cada qual com 5 ml das soluções diluídas, e mantida em uma estufa de 25°C durante 7 dias. A superfície da folha de pepino foi inoculada com 30 *Aphis gossypii* (estágio total), e também mantida na estufa durante 6 dias, em seguida, o número de inseto de *Aphis gossypii* vivos parasitado nas folhas deste pepino foi conferido, e o valor de controle foi calculado de acordo com a seguinte fórmula.

[00772] Valor de controle (%) =  $\{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$

[00773] Letras na fórmula representam os seguintes significados.

[00774] Cb: o número de inseto antes do tratamento em distrito não tratado

[00775] Cai: o número de inseto em observação no distrito não tratado

[00776] Tb: o número de inseto antes do tratamento no distrito tratado

[00777] Tai: o número de inseto em observação no distrito tratado

[00778] Como um resultado, 90% ou mais de valor de controle foram obtidos em todos os distritos tratados com as soluções diluídas para teste dos presentes compostos ativos (3) a (7), (17), (19), (20), (22), (29) a (31), (35) a (37), (39), (41) a (45), (47) a (56), (101), (106), (121) a (123), (128), (131), (137), (139), (143), (145), (147), (211) a (213), (216) e (217).

#### Exemplo Teste 5

[00779] As formulações dos presentes compostos ativos (1) a (5), (7) a (15), (17) a (21), (25), (28) a (45), (48) a (56), (101) a (103), (106), (107), (117), (118), (121) a (145), (147) a (151), (153) a (155), (204), (206), (20B), (209), (211) a (213) e (216) a (221) obtidas pelo Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água, de forma que a concentração de ingrediente ativa seja 500 ppm, para preparar soluções em spray para teste.

[00780] Separadamente, em uma muda de tomate plantada em um copo de plástico, adulto insetos de *Bemisia tabaci* foram liberados e permitidos botar ovos durante cerca de 24 horas. A muda de tomate foi mantida em uma estufa durante 8 dias, e as soluções em spray acima descritas para teste foram pulverizadas a uma proporção de 10 ml/copo na condição de eclosão das larvas dos ovos postos, e mantida em uma estufa de 25°C durante 7 dias. O número de larvas vivas nas folhas de tomate foi conferido, e o valor de controle foi calculado de acordo com a seguinte fórmula.

[00781] Valor de controle (%) =  $\{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$

[00782] Letras na fórmula representam os seguintes significados.

[00783] Cb: o número de inseto antes do tratamento no distrito não tratado

[00784] Cai: o número de inseto em observação no distrito não tratado

[00785] Tb: o número de inseto antes do tratamento no distrito tratado

[00786] Tai: o número de inseto em observação no distrito tratado

[00787] Como um resultado, 90% ou mais de valor de controle foram obtidos em todos os distritos tratados com as soluções em spray para teste dos presentes compostos ativos (1) a (5), (7) a (15), (17) a (21), (25), (28) a (45), (48) a (56), (101) a (103), (106), (107), (117), (118), (121) a (145), (147) a (151), (153) a (155), (204), (206), (208), (209), (211) a (213) e (216) a (221).

#### Exemplo Teste 6

[00788] As formulações dos presentes compostos ativos (3) a (5), (8) a (17), (20), (23), (27), (35) a (45), (48), (49), (51), (54) a (56), (206) e (208) a (212) obtidas pelo Exemplo de Formulação 5, foram diluídas com água, de forma que a concentração de ingrediente ativa seja 500 ppm, para preparar soluções em spray para teste.

[00789] Separadamente, em uma muda de arroz (2 semanas depois de semear, estágio de propagação de segunda folhas) plantada em um copo de plástico, as soluções de fármaco para teste preparadas como descrito acima foram pulverizadas cada qual em uma quantidade de 10 ml. Depois de secar a solução de fármaco pulverizada no arroz, 30 larvas de primeiro instar de *Nilaparvata lugens* foram liberadas, e mantidas em uma estufa de 25°C durante 6 dias. Depois disso, o número de *Nilaparvata lugens* parasitadas no arroz foi conferido, e o valor de controle foi calculado de acordo com a seguinte fórmula.

[00790] Valor de controle (%) =  $\{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$

[00791] Letras na fórmula representam os seguintes significados.

[00792] C<sub>b</sub>: o número de inseto antes do tratamento no distrito não tratado

[00793] C<sub>ai</sub>: o número de inseto em observação no distrito não tratado

[00794] T<sub>b</sub>: o número de inseto antes do tratamento no distrito tratado

[00795] T<sub>ai</sub>: o número de inseto em observação no distrito tratado

[00796] Como um resultado, 90% ou mais de valor de controle foram obtidos em todos os distritos tratados com as soluções em spray para teste dos presentes compostos ativos (3) a (5), (8) a (17), (20), (23), (27), (35) a (45), (48), (49), (51), (54) a (56), (206) e (208) a (212).

#### Exemplo Teste 7

[00797] As formulações dos presentes compostos ativos (11), (13) a (15), (17), (23), (26), (35) a (41), (43) a (45), (48) a (51), (54), (55), (209), (211) e (212) obtidas pelo Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água, de forma que a concentração de ingrediente ativa seja 500 ppm, para preparar soluções diluídas para teste.

[00798] Separadamente, uma muda de arroz (2 semanas depois de

semear, estágio de propagação de segunda folhas) plantada em um copo de plástico foi molhada a seu pé, cada qual com 5 ml das soluções diluídas, e mantida em uma estufa de 25°C durante 7 dias. Trinta larvas de primeiro instar de *Nilaparvata lugens* foram liberadas, e também mantidas na estufa durante 6 dias. O número de inseto de *Nilaparvata lugens* vivos parasitados no arroz foi conferido, e o valor de controle foi calculado de acordo com a seguinte fórmula.

[00799] Valor de controle (%) =  $\{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$

[00800] Letras na fórmula representam os seguintes significados.

[00801]  $C_b$ : o número de inseto antes do tratamento no distrito não tratado

[00802]  $C_{ai}$ : o número de inseto em observação no distrito não tratado

[00803]  $T_b$ : o número de inseto antes do tratamento no distrito tratado

[00804]  $T_{ai}$ : o número de inseto em observação no distrito tratado

[00805] Como um resultado, 90% ou mais de valor de controle foram obtidos

[00806] em todos os distritos tratados com as soluções diluídas para teste dos presentes compostos ativos (11), (13) a (15), (17), (23), (26), (35) a (41), (43) a (45), (48) a (51), (54), (55), (209), (211) e (212).

#### Exemplo Teste 8

[00807] As formulações dos presentes compostos ativos (6), (7), (18), (21), (24), (25), (28) a (30), (32), (46), (52), (101) a (103), (105) a (107), (111), (112), (115), (119) a (124), (126) a (130), (133) a (135), (139), (142), (144) a (146), (149) a (151), (153), (154), (216) e (217) obtidas pelo Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água, de forma que a concentração de ingrediente ativa seja 500 ppm, para preparar soluções em spray para teste.

[00808] Separadamente, em uma muda de arroz (2 semanas

depois de semear, estágio de propagação de segunda folhas) plantada em um copo de plástico, as soluções de fármaco para teste preparadas como descrito acima, foram pulverizadas cada qual em uma quantidade de 10 ml. Depois da secagem da solução de fármaco pulverizada no arroz, 20 larvas de primeiro instar de *Nilaparvata lugens* foram liberadas, e mantidas em uma estufa de 25°C durante 6 dias. Depois disso, o número de *Nilaparvata lugens* parasitado no arroz foi conferido, e o valor de controle foi calculado de acordo com a seguinte fórmula.

[00809] Valor de controle (%) =  $\{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$

[00810] Letras na fórmula representam os seguintes significados.

[00811] Cb: o número de inseto antes do tratamento no distrito não tratado

[00812] Cai: o número de inseto em observação no distrito não tratado

[00813] Tb: o número de inseto antes do tratamento no distrito tratado

[00814] Tai: o número de inseto em observação no distrito tratado

[00815] Como um resultado, 90% ou mais de valor de controle foram obtidos em todos os distritos tratados com as soluções em spray para teste dos presentes compostos ativos (6), (7), (18), (21), (24), (25), (28) a (30), (32), (46), (52), (101) a (103), (105) a (107), (111), (112), (115), (119) a (124), (126) a (130), (133) a (135), (139), (142), (144) a (146), (149) a (151), (153), (154), (216) e (217).

#### Exemplo Teste 9

[00816] As formulações dos presentes compostos ativos (6), (7), (18), (22), (25), (30), (33), (46), (47), (53), (101) a (103), (106), (121) a (124), (126) a (128), (135), (139), (216) e (217) obtidas pelo Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água, de forma que a concentração de ingrediente ativa seja 500 ppm, para preparar

soluções diluídas para teste.

[00817] Separadamente, uma muda de arroz (2 semanas depois de semear, estágio de propagação de segunda folhas) plantada em um copo de plástico foi molhada a seu pé, cada qual com 5 ml das soluções diluídas, e mantida em uma estufa de 25°C durante 7 dias. Vinte larvas de primeiro instar de *Nilaparvata lugens* foram liberadas, e também mantidas na estufa durante 6 dias, em seguida, o número de inseto de *Nilaparvata lugens* vivos parasitados no arroz foi conferido, e o valor de controle foi calculado de acordo com a seguinte fórmula.

[00818] Valor de controle (%) =  $\{1-(Cb \times Tai)/(Cai \times Tb)\} \times 100$

[00819] Letras na fórmula representam os seguintes significados.

[00820] Cb: o número de inseto antes do tratamento no distrito não tratado

[00821] Cai: o número de inseto em observação no distrito não tratado

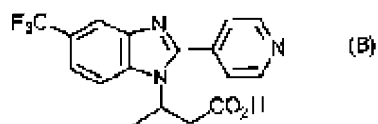
[00822] Tb: o número de inseto antes do tratamento no distrito tratado

[00823] Tai: o número de inseto em observação no distrito tratado

[00824] Como um resultado, 90% ou mais de valor de controle foram obtidos em todos os distritos tratados com as soluções diluídas para teste dos presentes compostos ativos (6), (7), (18), (22), (25), (30), (33), (46), (47), (53), (101) a (103), (106), (121) a (124), (126) a (128), (135), (139), (216) e (217).

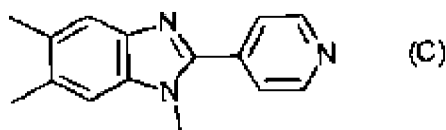
#### Exemplo Teste Comparativo 1

[00825] Um composto da seguinte fórmula (B) descrito em Farmaco, Edizione Scientifica (1987), 42(7), 475-90 (em seguida, chamado composto comparativo (B)) foi submetido ao mesmo teste como no Exemplo Teste 1, como resultado, um valor de controle foi menos do que 30% no distrito tratado com a solução em spray para teste do composto comparativo (B).



### Exemplo Teste Comparativo 2

[00826] Um composto da seguinte fórmula (C) descrito em Heterocycles (1977), 6(7), 911-27 (em seguida, chamado composto comparativo (C)) foi submetido ao mesmo teste como no Exemplo Teste 1, como resultado, um valor de controle foi menos do que 30% no distrito tratado com a solução em spray para teste do composto comparativo (C).

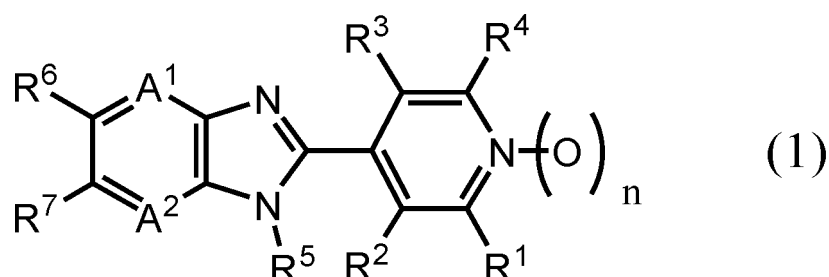


### Aplicabilidade industrial

[00827] A composição da presente invenção tem um excelente efeito de controle sobre artrópodes nocivos e por conseguinte é útil.

## REIVINDICAÇÕES

1. Composto heterocíclico fundido, caracterizado pelo fato de que apresenta a fórmula (1):



em que,

$A^1$  e  $A^2$  são os mesmos ou diferentes e representam um átomo de nitrogênio ou  $=CH-$ ,  $m$  representa 0, 1 ou 2,

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  e  $R^4$  são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo benzila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^9$ ,  $-NR^8C(O)R^9$ ,  $-S(O)_mR^8$ ,  $-SO_2Cl$ ,  $-SO_2NR^8R^9$ ,  $-CO_2R^{10}$ ,  $-CONR^8R^9$ ,  $-CONR^{10}NR^{11}R^{12}$ , um grupo ciano, um grupo nitro, um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio,

$R^5$  representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciclopropila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciclopropilmetila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio,  $-OR^{13}$ ,  $-NR^{13}R^{14}$  ou um grupo ciano,

$R^6$  e  $R^7$  são os mesmos ou diferentes e um de  $R^6$  e  $R^7$  representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio,  $-OR^{15}$ ,  $-S(O)_mR^{15}$ , e o outro de  $R^6$  e  $R^7$  representa grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio,  $-OR^{15}$ ,  $-S(O)_mR^{15}$ , um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio, alternativamente  $R^6$  e  $R^7$  podem ser ligados para formar um anel de 5 membros ou anel de 6 membros substituído com um ou mais átomos de halogênio juntamente com átomos de carbono aos quais  $R^6$  e  $R^7$  estão conectados,

$R^8$  e  $R^9$  são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo benzila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, ou um átomo de hidrogênio (relativo a  $-S(O)_mR^8$ , m representa o mesmo significado como descrito acima, porém quando m representar 1 ou 2,  $R^8$  não representa um átomo de hidrogênio),

$R^{10}$  representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, ou um átomo de hidrogênio,

$R^{11}$  e  $R^{12}$  são os mesmos ou diferentes e representam um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C2-C5 alcóxicarbonila ou um átomo de hidrogênio,

$R^{13}$  e  $R^{14}$  são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C3 opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciclopropila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, ou um átomo de hidrogênio,

$R^{15}$  representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, e

$n$  representa 0 ou 1.

Grupo X: um grupo que consiste em um grupo C1-C4 alcóxi opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, - $CO_2R^{16}$  (aqui,  $R^{16}$  representa um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um halogênio), um grupo ciano e um átomo de halogênio,

Grupo Y: um grupo que consiste em um grupo C1-C4 alquila opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo C1-C4 alcóxi opcionalmente substituído com um ou mais átomos de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro e um átomo de halogênio.

2. Composto heterocíclico fundido de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que  $R^6$  e  $R^7$  são os mesmos ou diferentes e um de  $R^6$  e  $R^7$  representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, - $OR^{15}$ ,

- $S(O)_mR^{15}$ , e o outro de  $R^6$  e  $R^7$  representa um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais átomos de halogênio, - $OR^{15}$ ,

- $S(O)_mR^{15}$ , um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio.

3. Composto heterocíclico fundido de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que  $R^6$  é um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C4 substituído com um ou mais

átomos de halogênio.

4. Composto heterocíclico fundido de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que  $R^5$  é um grupo metila, grupo etila, grupo ciclopropila ou grupo ciclopropilmetila.

5. Composto heterocíclico fundido de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que  $R^1$  e  $R^4$  são átomos de hidrogênio.

6. Composto heterocíclico fundido de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que  $R^2$  é um átomo de hidrogênio ou um átomo de halogênio.

7. Composto heterocíclico fundido de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que  $R^3$  é um grupo hidrocarboneto alicíclico de C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, um grupo fenila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, um grupo benzila opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y, ou um grupo heterocíclico de 5 membros ou grupo heterocíclico de 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo Y.

8. Composto heterocíclico fundido de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que  $R^3$  é um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^9$ ,  $-NR^8C(O)R^9$ ,  $-S(O)_mR^8$ ,  $-CO_2R^{10}$ ,  $-CONR^8R^9$ ,  $-CONR^{10}NR^{11}R^{12}$ , um grupo ciano, um grupo nitro, um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio, e  $R^8$  e  $R^9$  são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, ou um átomo de hidrogênio (aqui,  $R^8$  não é um átomo de hidrogênio quando

m em  $-S(O)_mR^8$  representa 1 ou 2).

9. Composto heterocíclico fundido de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que  $R^3$  é um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X,  $-OR^8$ ,  $-NR^8R^9$ ,  $-S(O)_mR^8$ , um átomo de halogênio ou um átomo de hidrogênio, e  $R^8$  e  $R^9$  são os mesmos ou diferentes e representam um grupo hidrocarboneto de cadeia de C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais membros selecionados a partir do grupo X, ou um átomo de hidrogênio (aqui,  $R^8$  não é um átomo de hidrogênio quando m em  $-S(O)_mR^8$  representa 1 ou 2).

10. Composição de controle de artrópode nocivo, caracterizada pelo fato de que compreende o composto heterocíclico fundido como definido na reivindicação 1 e um veículo inerte.

11. Método de controlar um artrópode nocivo, caracterizado pelo fato de que compreende aplicar uma quantidade eficaz do composto heterocíclico fundido como descrito na reivindicação 1 a um artrópode nocivo ou a um habitat de um artrópode nocivo, em que os métodos de tratamento do corpo humano ou animal são excluídos.

12. Uso do composto heterocíclico fundido como definido na reivindicação 1, caracterizado pelo fato de ser para controlar um artrópode nocivo, em que os métodos de tratamento do corpo humano ou animal são excluídos.