



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

(11) PI 0621171-2 B1



(22) Data do Depósito: 28/12/2006

(45) Data de Concessão: 26/12/2018

(54) Título: COMPOSTO, COMPOSIÇÃO, COMPOSIÇÃO DE CONTROLE DE PRAGAS INVERTEBRADAS, COMPOSIÇÃO DE PULVERIZAÇÃO, COMPOSIÇÃO DE ISCA, DISPOSITIVO DE ARMADILHA, MÉTODOS DE CONTROLE DE PRAGAS INVERTEBRADAS, MÉTODO DE PROTEÇÃO DE SEMENTES CONTRA PRAGAS INVERTEBRADAS, SEMENTE TRATADA E COMPOSIÇÃO DE PROTEÇÃO DE ANIMAIS CONTRA PRAGAS PARASÍTICAS INVERTEBRADAS.

(51) Int.Cl.: C07D 261/04; C07D 413/12; C07D 417/12; A01N 43/80; C07D 401/04; (...).

(30) Prioridade Unionista: 07/11/2006 US 60/857,307; 23/08/2006 US 60/839,988; 30/12/2005 US 60/755,247.

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

(72) Inventor(es): GEORGE PHILIP LAHM; WESLEY LAWRENCE SHOOP; MING XU.

(86) Pedido PCT: PCT US2006049459 de 28/12/2006

(87) Publicação PCT: WO 2007/079162 de 12/07/2007

(85) Data do Início da Fase Nacional: 30/06/2008

(57) Resumo: COMPOSTO, COMPOSIÇÃO, COMPOSIÇÃO DE CONTROLE DE PRAGAS INVERTEBRADAS, COMPOSIÇÃO DE PULVERIZAÇÃO, COMPOSIÇÃO DE ISCA, DISPOSITIVO DE ARMADILHA, MÉTODOS DE CONTROLE DE PRAGAS INVERTEBRADAS, MÉTODO DE PROTEÇÃO DE SEMENTES CONTRA PRAGAS INVERTEBRADAS, SEMENTE TRATADA E COMPOSIÇÃO E MÉTODO DE PROTEÇÃO DE ANIMAIS CONTRA PRAGAS PARASÍTICAS INVERTEBRADAS. A presente invenção se refere aos compostos da Fórmula (1), lo incluindo todos os seus isômeros geométricos e estereoisômeros, N-óxidos e sais, em que A¹, A², A³, A⁴, A⁵ e A⁶ são selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de CR³ e N; desde que no máximo três dentre A¹, A², A³, A⁴, A⁵ e A⁶ sejam N; B¹, B² e B³ são selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de CR² e N; cada R³ é independentemente H, halogênio, alquila C₁₋₆, haloalquila C₁₋₆, cicloalquila C₃₋₆, halocicloalquila C₃₋₆, alcóxi C₁₋₆, haloalcóxi C₁₋₆, alquiltio C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆, alquilsulfonila C₁₋₆, haloalquilsulfonila C₁₋₆, alquilsulfonila C₁₋₆, haloalquilsulfonila C₁₋₆, alquilamino C₁₋₆, dialquilamino C₂₋₆, -CN ou -NO₂; e R¹, R², R⁴, R⁵, W e n são conforme definido no relatório descritivo. Também o são descritas composições que contêm os compostos da Fórmula 1 e métodos de (...).

“COMPOSTO, COMPOSIÇÃO, COMPOSIÇÃO DE CONTROLE DE PRAGAS INVERTEBRADAS, COMPOSIÇÃO DE PULVERIZAÇÃO, COMPOSIÇÃO DE ISCA, DISPOSITIVO DE ARMADILHA, MÉTODOS DE CONTROLE DE PRAGAS INVERTEBRADAS, MÉTODO DE PROTEÇÃO DE SEMENTES CONTRA PRAGAS INVERTEBRADAS, SEMENTE TRATADA E COMPOSIÇÃO DE PROTEÇÃO DE ANIMAIS CONTRA PRAGAS PARASÍTICAS INVERTEBRADAS”

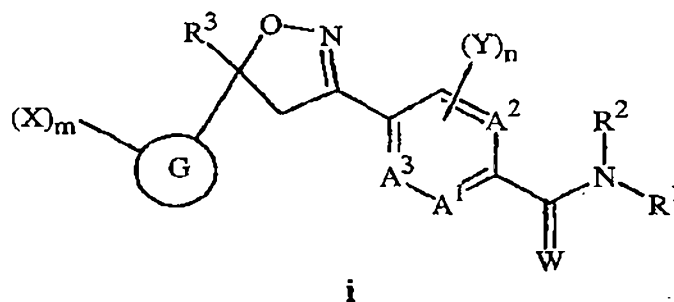
CAMPO DA INVENÇÃO

[001] A presente invenção refere-se a certas isoxazolinas, seus *N*-óxidos, sais e composições apropriadas para usos agronômicos e não agronômicos, incluindo os usos relacionados abaixo, e métodos de seu uso para o controle de pragas invertebradas tais como artrópodes em ambientes agronômicos e não agronômicos.

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

[002] O controle de pragas invertebradas é extremamente importante para atingir alta eficiência de produção. O dano por pragas invertebradas a safras agronômicas em cultivo e armazenadas pode causar redução significativa da produtividade e, desta forma, resultar em aumento de custos para o consumidor. O controle de pragas invertebradas em produtos florestais, safras de estufa, plantas ornamentais, safras de mudas, alimentos armazenados e produtos de fibra, animais de criação, domésticos, gramados, produtos de madeira e saúde pública e animal também é importante. Muitos produtos são disponíveis comercialmente para estes propósitos, mas permanece a necessidade de novos compostos que sejam mais eficazes, tenham custo mais baixo, sejam menos tóxicos, ambientalmente mais seguros ou possuam diferentes modos de ação.

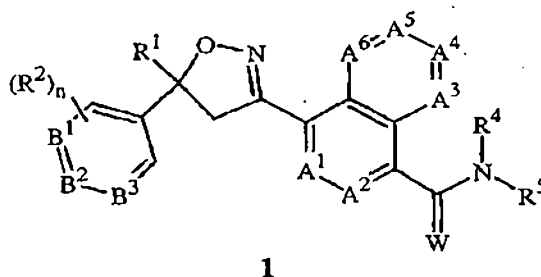
[003] A Patente PCT WO 05/085216 descreve derivados de isoxazolina da Fórmula i como inseticidas:



em que, entre outros, cada um dentre A^1 , A^2 e A^3 é independentemente C ou N; G é anel de benzeno; W é O ou S; e X é halogênio ou haloalquila C_1 - C_6 .

DESCRIÇÃO RESUMIDA DA INVENÇÃO

[004] A presente invenção refere-se a compostos da Fórmula 1, incluindo todos os seus isômeros geométricos e estereoisômeros, *N*-óxidos e sais, composições que os contêm e seu uso para o controle de pragas invertebradas:



em que:

- A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 e A^6 são selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de CR^3 e N; desde que no máximo três dentre A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 e A^6 sejam N;
- B^1 , B^2 e B^3 são selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de CR^2 e N;
- W é O ou S;
- R^1 é alquila C_1 - C_6 , alquenila C_2 - C_6 , alquinila C_2 - C_6 , cicloalquila C_3 - C_6 , alquilocicloalquila C_4 - C_7 ou cicloalquilalquila C_4 - C_7 , cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados

independentemente a partir de R⁶;

- cada R² é independentemente H, halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₄, -CN ou -NO₂;

- cada R³ é independentemente H, halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, -CN ou -NO₂;

- R⁴ é H, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilocicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcóxicarbonila C₂-C₇;

- R⁵ é H, OR¹⁰, NR¹¹R¹² ou Q¹; ou alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilocicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R⁷; ou

- R⁴ e R⁵ são tomados em conjunto com o nitrogênio ao qual são ligados para formar anel que contém dois a seis átomos de carbono e, opcionalmente, um átomo adicional selecionado a partir do grupo que consiste de N, S e O, em que o mencionado anel é opcionalmente substituído com um a quatro substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de alquila C₁-C₂, halogênio, -CN, -NO₂ e alcóxi C₁-C₂;

- cada R⁶ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, -CN ou -NO₂;

- cada R⁷ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila

C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alquilcarbonila C₂-C₇, alcóxicarbonila C₂-C₇, alquilaminocarbonila C₂-C₇, dialquilaminocarbonila C₃-C₉, haloalquilcarbonila C₂-C₇, haloalcóxicarbonila C₂-C₇, haloalquilaminocarbonila C₂-C₇, halodialquilaminocarbonila C₃-C₉, hidróxi, -NH₂, -CN ou -NO₂; ou Q²;

- cada R⁸ é independentemente halogênio, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₄, -CN ou -NO₂;

- cada R⁹ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, -CN, -NO₂, fenila ou piridinila;

- R¹⁰ é H, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilocicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais halogênios;

- R¹¹ é H, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilocicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcóxicarbonila C₂-C₇;

- R¹² é H; Q³; ou alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilocicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R⁷; ou

- R¹¹ e R¹² são tomados em conjunto com o nitrogênio ao qual são ligados para formar anel que contém dois a seis átomos de carbono e, opcionalmente, um átomo adicional selecionado a partir do grupo que consiste de N, S e O, em que o mencionado anel é opcionalmente substituído com um a

quatro substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de alquila C₁-C₂, halogênio, -CN, -NO₂ e alcóxi C₁-C₂;

- Q¹ é anel fenila, anel heterocíclico com 5 ou 6 membros, sistema de anéis bicíclicos fundidos com 8, 9 ou 10 membros que contém opcionalmente 1 a 3 heteroátomos selecionados a partir de 1 O, até 1 S e até 3 N, em que cada anel ou sistema de anéis é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R⁸;

- cada Q² é independentemente anel fenila ou anel heterocíclico com 5 ou 6 membros, em que cada anel é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R⁹;

- Q³ é anel fenila ou anel heterocíclico com 5 ou 6 membros, em que cada anel é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R⁹; e

- n é 0, 1 ou 2.

[005] A presente invenção também fornece composição que compreende composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativo, diluente sólido e diluente líquido. Em uma realização, a presente invenção também fornece composição de controle de pragas invertebradas que compreende quantidade biologicamente eficaz de composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativo, diluente sólido e diluente líquido, em que a mencionada composição compreende ainda opcionalmente quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um composto ou agente biologicamente ativo adicional.

[006] A presente invenção também fornece composição de pulverização para controle de pragas invertebradas que compreende quantidade

biologicamente eficaz de composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal ou a composição descrita acima e propelente. A presente invenção também fornece composição de isca para controlar pragas invertebradas que compreende quantidade biologicamente eficaz de composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal ou da composição descrita na realização acima, um ou mais materiais alimentícios, opcionalmente atrativo e opcionalmente umectante.

[007] A presente invenção fornece ainda dispositivo de armadilha para controle de pragas invertebradas que compreende a mencionada composição de isca e abrigo adaptado para receber a mencionada composição de isca, em que o abrigo contém pelo menos uma abertura dimensionada para permitir que a praga invertebrada passe através da abertura, de forma que a praga invertebrada possa obter acesso à mencionada composição de isca a partir de local fora do abrigo e em que o abrigo é adicionalmente adaptado para colocação em local de atividade conhecida ou potencial para as pragas invertebradas ou perto dele.

[008] A presente invenção também fornece método de controle de pragas invertebradas que compreende o contato da praga invertebrada ou seu ambiente com quantidade biologicamente eficaz de composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal (tal como composição descrita no presente). A presente invenção também se refere a método em que a praga invertebrada ou seu ambiente é colocada em contato com composição que compreende quantidade biologicamente eficaz de composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativo, diluente sólido e diluente líquido, em que a mencionada composição compreende ainda opcionalmente quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional.

DESCRIÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO

[009] Da forma utilizada no presente, as expressões “compreende”, “que compreende”, “inclui”, “que inclui”, “tem”, “que tem”,

“contém”, “que contém” ou qualquer outra de suas variações destinam-se a cobrir inclusão não exclusiva. Composição, mistura, processo, método, artigo ou aparelho que compreende uma lista de elementos, por exemplo, não se limita necessariamente apenas àqueles elementos, mas pode incluir outros elementos não relacionados expressamente ou inerentes a essa composição, mistura, processo, método, artigo ou aparelho. Além disso, a menos que indicado expressamente em contrário, “ou” indica inclusivo e não exclusivo. Condição A ou B é satisfeita, por exemplo, por qualquer dos seguintes: A é verdadeiro (ou presente) e B é falso (ou ausente), A é falso (ou ausente) e B é verdadeiro (ou presente) ou ambos, A e B, são verdadeiros (ou presentes).

[010] Além disso, os artigos indefinidos “um” e “uma” que precedem elemento ou componente de acordo com a presente invenção destinam-se a ser não restritivos com relação ao número de casos (ou seja, ocorrências) do elemento ou componente. “Um” ou “uma”, portanto, deverá ser lido como incluindo um ou pelo menos um e a forma da palavra no singular do elemento ou componente também inclui o plural, a menos que o número se destine obviamente a ser singular.

[011] Da forma indicada no presente relatório descritivo, a expressão “praga invertebrada” inclui artrópodes, gastrópodes e nematóides de importância econômica como pragas. O termo “artrópode” inclui insetos, ácaros, aranhas, escorpiões, centopéias, miriápodes, cochonilhas e centopéias de jardim. O termo “gastrópode” indica caracóis, lesmas e outros estilomatóforos. O termo “helmíntios” inclui vermes do filo dos nematelmintos, platielmintos e acantocéfalos, tais como vermes redondos, parasitas cardíacos e nematóides fitófagos (nematóides), fascíolas (trematóides), céstodes (céstodes) e ctenóforos.

[012] No contexto do presente relatório descritivo, “controle de pragas invertebradas” indica a inibição do desenvolvimento de pragas

invertebradas (incluindo mortalidade, redução da alimentação e/ou rompimento do acasalamento) e expressões relacionadas são definidas de forma análoga.

[013] O termo “agronômico” indica a produção de safras de campo tal como para alimento e fibras e inclui o crescimento de milho, soja e outros vegetais, arroz, cereais (tais como trigo, aveia, cevada, centeio, arroz e milho), verduras folhosas (tais como alface, repolho e outras safras de couve), vegetais frutíferos (tais como tomates, pimentas, berinjela, crucíferas e abóboras), batatas, batatas doces, uvas, algodão, frutas de árvores (tais como pomos, drupas e cítricos), frutas pequenas (bagas, cerejas) e outras safras especializadas (tais como canola, girassol, azeitonas). A expressão “não agronômico” indica outras safras hortícolas (por exemplo, plantas de estufa, viveiros ou ornamentais não cultivadas no campo), estruturas residenciais e comerciais em ambientes urbanos e industriais, gramados (tais como plantações de grama, pastos, campos de golfe, gramados residenciais, campos esportivos de recreação etc.), produtos de madeira, produtos armazenados, aplicações em administração de vegetação e agroflorestal, saúde pública (humana) e saúde animal (tal como animais domesticados como animais de estimação, de criação e aves, animais não domesticados como animais selvagens).

[014] Nas descrições acima, o termo “alquila”, utilizado isoladamente ou em palavras compostas tais como “alquiltio” ou “haloalquila”, inclui alquila de cadeia linear ou ramificado, tal como metila, etila, *n*-propila, *i*-propila ou os diferentes isômeros de butila, pentila ou hexila. “Alquenila” inclui alquenos de cadeia linear ou ramificados tais como etenila, 1-propenila, 2-propenila e os diferentes isômeros de butenila, pentenila e hexenila. “Alquenila” também inclui polienos tais como 1,2-propadienila e 2,4-hexadienila. “Alquinila” inclui alquinas de cadeia linear ou ramificados tais como etinila, 1-propinila, 2-propinila e os diferentes isômeros de butinila, pentinila e hexinila. “Alquinila” pode

também incluir porções compostas de diversas uniões triplas múltiplas, tais como 2,5-hexadiinila.

[015] “Alcóxi” inclui, por exemplo, metóxi, etóxi, *n*-propilóxi, isopropilóxi e os diferentes isômeros de butóxi, pentóxi e hexilóxi. “Alquiltio” inclui porções alquiltio de cadeia linear ou ramificada tais como metiltio, etiltio e os diferentes isômeros de propiltio, butiltio, pentiltio e hexiltio. “Alquilsulfinila” inclui os dois enantiômeros de grupo alquilsulfinila. Exemplos de “alquilsulfinila” incluem $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ e os diferentes isômeros de butilsulfinila, pentilsulfinila e hexilsulfinila. Exemplos de “alquilsulfonila” incluem $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ e os diferentes isômeros de butilsulfonila, pentilsulfonila e hexilsulfonila. “Alquilamino”, “dialquilamino” e similares são definidos de forma análoga aos exemplos acima. “Cicloalquila” inclui, por exemplo, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila e ciclohexila. O termo “alquilcicloalquila” indica substituição alquila sobre porção cicloalquila e inclui, por exemplo, etilciclopropila, *i*-propilciclobutila, 3-metilciclopentila e 4-metilciclohexila. O termo “cicloalquilalquila” indica substituição cicloalquila sobre porção alquila. Exemplos de “cicloalquilalquila” incluem ciclopropilmetila, ciclopentiletila e outras porções cicloalquila unidas a grupos alquila de cadeia linear ou ramificados.

[016] O termo “halogênio”, seja isoladamente ou em palavras compostas tais como “haloalquila”, ou quando utilizado em descrições tais como “alquila substituído com halogênio” inclui flúor, cloro, bromo ou iodo. Além disso, quando utilizado em palavras compostas tais como “haloalquila”, ou quando utilizado em descrições tais como “alquila substituído com halogênio”, o mencionado alquila pode ser parcial ou totalmente substituído com átomos de halogênio que podem ser idênticos ou diferentes. Exemplos de “haloalquila” ou “alquila substituído com halogênio” incluem $\text{F}_3\text{C}-$, ClCH_2- , CF_3CH_2- e CF_3CCl_2- . Os termos “halocicloalquila”, “haloalcóxi”, “haloalquiltio” e similares são definidos

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

[017] “Alquilcarbonila” indica porções alquila de cadeia linear ou ramificadas unidas a porção $\text{C}(=\text{O})$. Exemplos de “alquilcarbonila” incluem $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$ e $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$. Exemplos de “alcoxicarbonila” incluem $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$ e os diferentes isômeros de butóxi ou pentoxicarbonila.

[018] A quantidade total de átomos de carbono em grupo substituinte é indicada pelo prefixo “ $\text{C}_i\text{-C}_j$ ”, em que i e j são números de 1 a 8. Alquilsulfonila $\text{C}_1\text{-C}_4$, por exemplo, designa metilsulfonila até butilsulfonila; alcóxialquila C_2 designa CH_3OCH_2 ; alcóxialquila C_3 designa, por exemplo, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ ou $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$; e alcóxialquila C_4 designa os vários isômeros de grupo alquila substituído com grupo alcóxi que contém total de quatro átomos de carbono, em que exemplos incluem $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ e $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

[019] Quando composto for substituído com substituinte que contém subscrito que indica que o número dos mencionados substituintes pode exceder 1, os mencionados substituintes (quando excederem 1) são selecionados independentemente a partir do grupo de substituintes definidos, por exemplo, $(\text{R}^2)_n$, n é 1, 2, 3, 4 ou 5. Quando um grupo contiver substituinte que pode ser hidrogênio, tal como R^2 , e quando esse substituinte for tomado como hidrogênio, reconhece-se que este é equivalente ao mencionado grupo não substituído.

[020] As expressões “anel heterocíclico”, “heterociclo” ou “sistema de anéis heterocíclicos” indicam anéis ou sistemas de anéis em que pelo menos um átomo de anel não é carbono, tal como nitrogênio, oxigênio ou enxofre. Tipicamente, anel heterocíclico contém não mais de quatro nitrogênios, não mais de dois oxigênios e não mais de dois enxofres. O anel heterocíclico pode ser ligado por meio de qualquer carbono ou nitrogênio disponível por meio de substituição de hidrogênio sobre o mencionado carbono ou nitrogênio. O anel heterocíclico pode ser anel saturado, parcialmente insaturado ou totalmente insaturado. Quando anel heterocíclico totalmente insaturado satisfizer a lei de Hückel, o mencionado anel também é denominado “anel heteroaromático”, “anel heterocíclico aromático”.

[021] A expressão “anel aromático” ou “sistema de anéis aromáticos” indica heterociclos e carbociclos totalmente insaturados nos quais pelo menos um anel do sistema de anéis policíclicos é aromático (em que aromático indica que a lei de Hückel é satisfeita para o sistema de anéis). A expressão “sistema de anéis bicíclicos fundidos” inclui sistema de anéis composto de dois anéis fundidos nos quais cada anel pode ser saturado, parcialmente insaturado ou totalmente insaturado. A expressão “sistema de anéis heterobicíclicos fundidos” inclui sistema de anéis composto de dois anéis fundidos nos quais pelo menos um átomo de anel não é carbono e pode ser aromático ou não aromático, conforme definido acima.

[022] A expressão “opcionalmente substituído”, com relação aos anéis heterocíclicos, designa grupos que não são substituídos ou possuem pelo menos um substituinte não de hidrogênio que não elimina a atividade biológica possuída pelo análogo não substituído. Da forma utilizada no presente, as definições a seguir deverão aplicar-se a menos que indicado em contrário. A expressão “opcionalmente substituído” é utilizada de forma intercambiável com a expressão “substituído ou não substituído” ou com a expressão “(não)

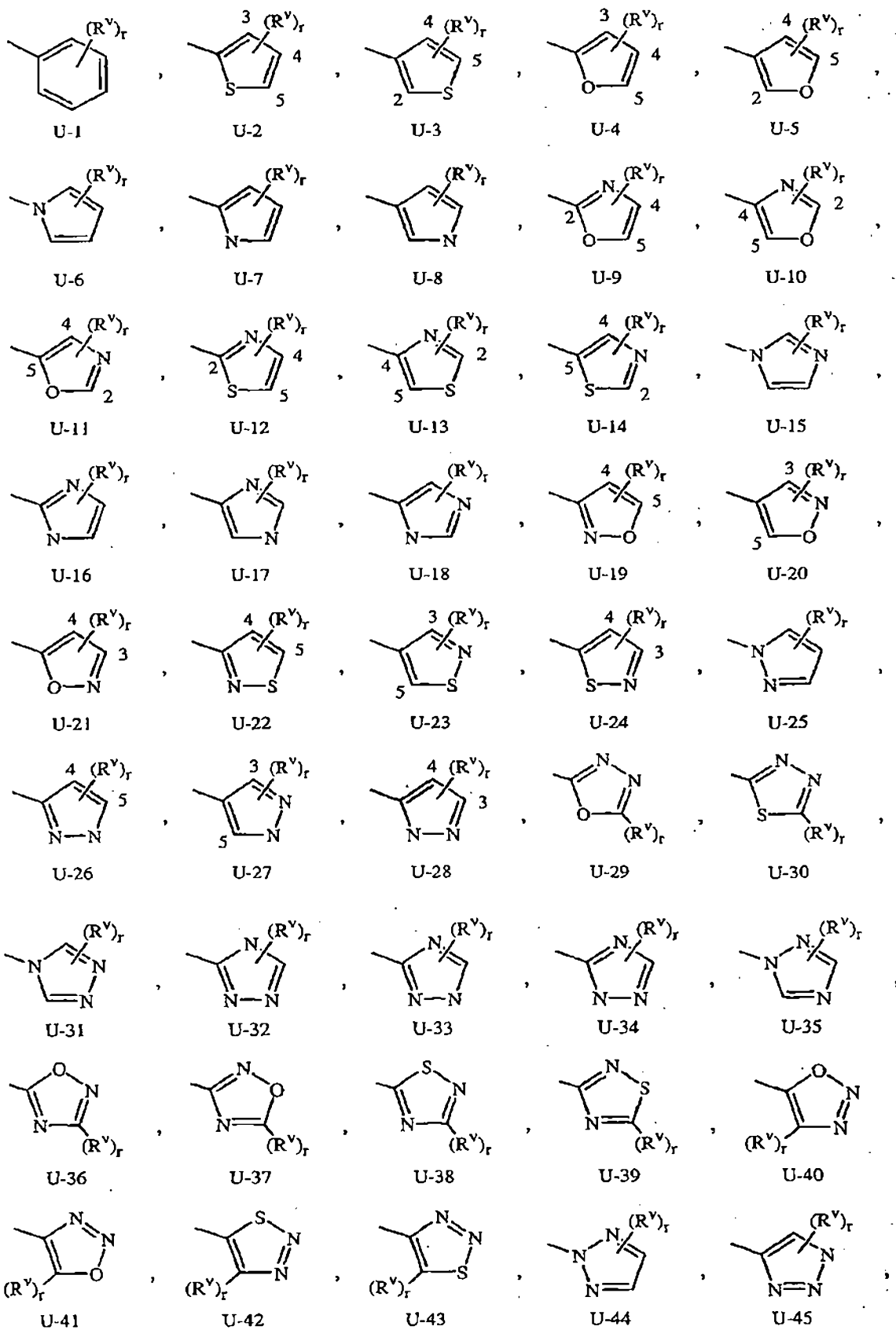
substituído". A menos que indicado em contrário, grupo opcionalmente substituído pode conter substituinte em cada posição substituível do grupo e cada substituição é independente da outra.

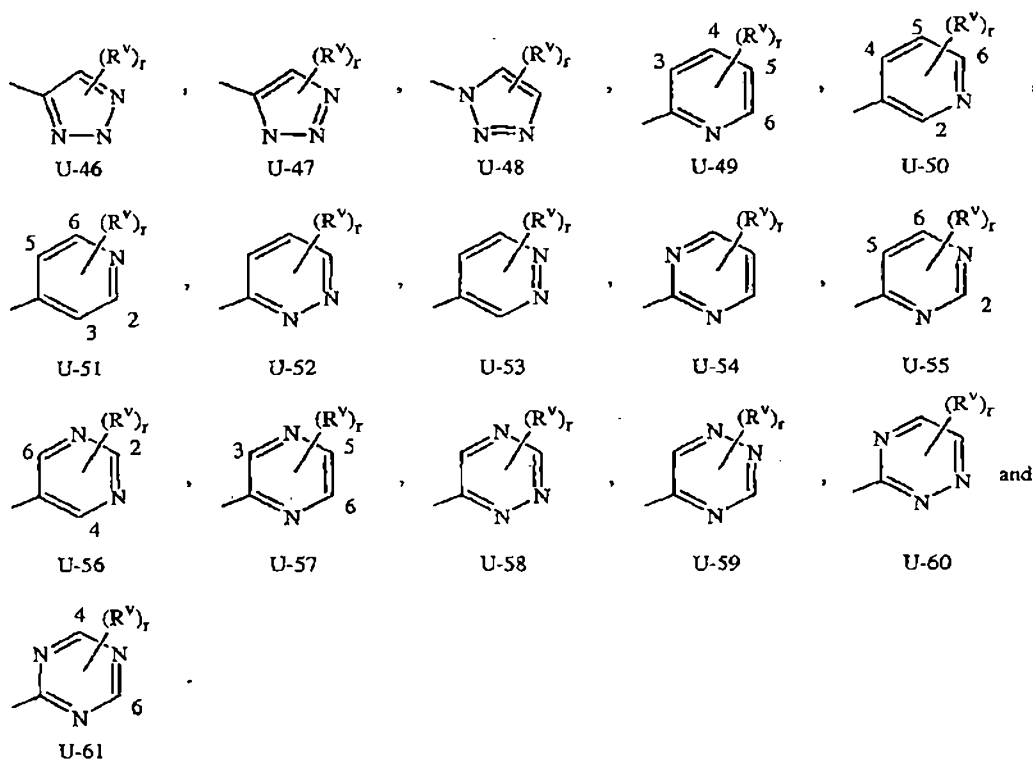
[023] Quando Q^1 for anel heterocíclico que contém nitrogênio com 5 ou 6 membros, ele pode ser ligado ao restante da Fórmula 1, por meio de qualquer átomo de anel de carbono ou nitrogênio disponível, a menos que descrito em contrário. De forma similar, quando Q^2 ou Q^3 for heterociclo que contém nitrogênio com 5 ou 6 membros, ele pode ser ligado por meio de qualquer átomo de anel de carbono ou nitrogênio disponível, a menos que descrito em contrário.

[024] Conforme indicado acima, Q^1 , Q^2 ou Q^3 pode ser (entre outros) fenila opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de grupo de substituintes conforme definido na Descrição Resumida da Invenção. Exemplo de fenila opcionalmente substituído com um a cinco substituintes é o anel ilustrado como U-1 na Ilustração 1, em que R^v é R^8 ou R^9 conforme definido na Descrição Resumida da Invenção para Q^1 , Q^2 ou Q^3 e r é número inteiro de 0 a 5.

[025] Conforme indicado acima, Q^1 , Q^2 ou Q^3 pode ser (entre outros) anel heterocíclico de 5 ou 6 membros, que pode ser saturado ou insaturado, opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de grupo de substituintes conforme definido na Descrição Resumida da Invenção. Exemplos de anel heterocíclico aromático insaturado com 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes incluem os anéis U-2 a U-61 exibidos na Ilustração 1 em que R^v é qualquer substituinte definido na Descrição Resumida da Invenção para Q^1 , Q^2 ou Q^3 (ou seja, R^8 ou R^9) e r é número inteiro de 0 a 4.

ILUSTRAÇÃO 1





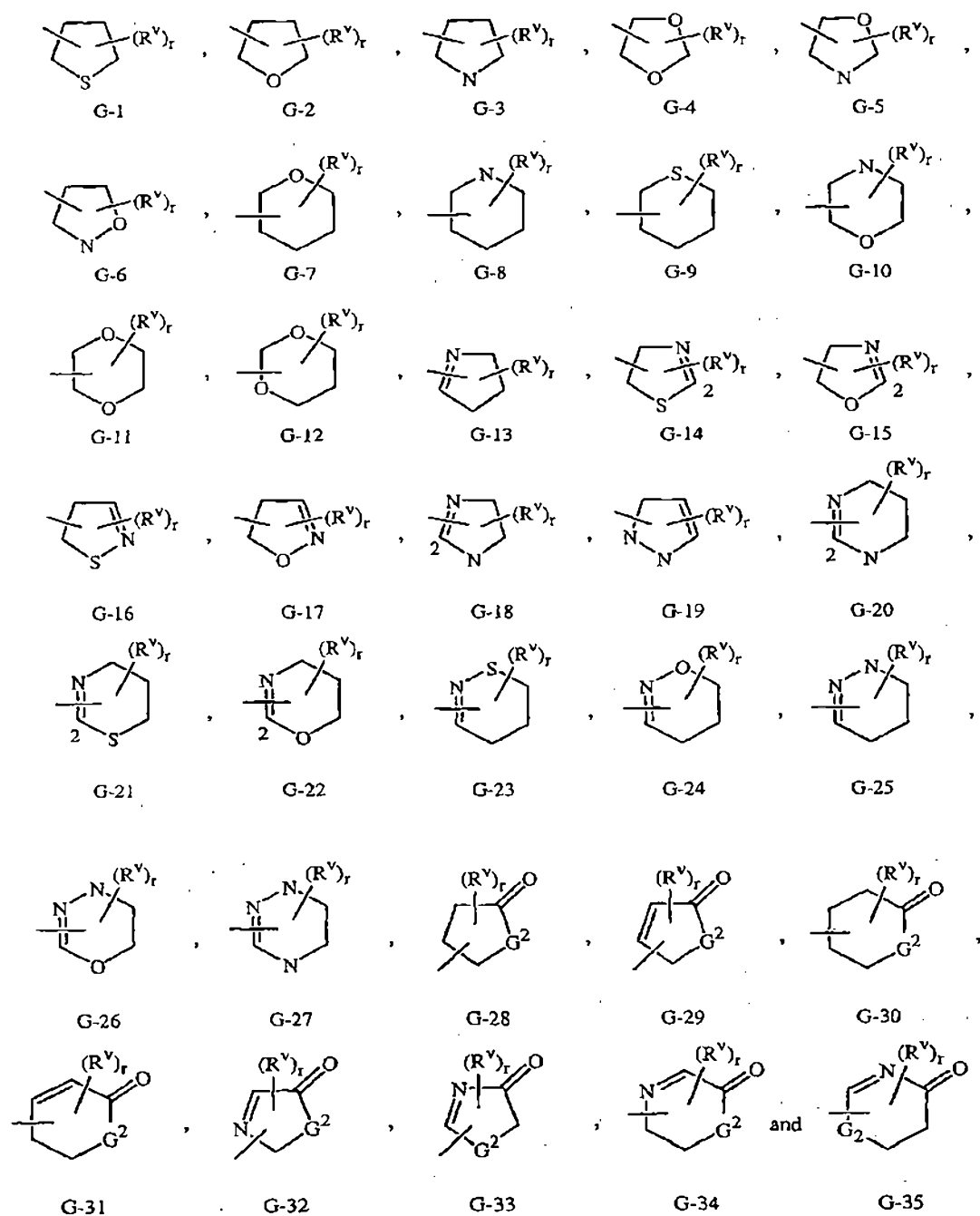
[026] Observe-se que, quando Q^1 , Q^2 ou Q^3 for anel heterocíclico não aromático saturado ou insaturado com 5 ou 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir do grupo de substituintes definido na Descrição Resumida da Invenção para Q^1 , Q^2 ou Q^3 , um ou dois membros de anéis de carbono do heterociclo podem encontrar-se opcionalmente na forma oxidada de porção carbonila.

[027] Exemplos de anel heterocíclico insaturado não aromático ou saturado com 5 ou 6 membros incluem os anéis G-1 até G-35 conforme exibido na Ilustração 2. Observe-se que, quando o ponto de ligação sobre o grupo G for ilustrado como flutuante, o grupo G pode ser ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de qualquer carbono ou nitrogênio disponível do grupo G por substituição de átomo de hidrogênio. Os substituintes opcionais podem ser ligados a qualquer carbono ou nitrogênio disponível por meio de substituição de átomo de hidrogênio.

[028] Observe-se que, quando Q^1 , Q^2 ou Q^3 compreender anel selecionado a partir de G-28 até G-35, G^2 é selecionado a partir de O, S ou N.

Observe-se que, quando G^2 for N, o átomo de nitrogênio pode completar a sua valência por meio de substituição com H ou os substituintes definidos na Descrição Resumida da Invenção para Q^1 , Q^2 ou Q^3 (ou seja, R^8 ou R^9).

ILUSTRAÇÃO 2



[029] Conforme indicado acima, Q^1 pode ser (dentre outros) sistema de anéis bicíclicos fundidos com 8, 9 ou 10 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de grupo de

U-81

U-82

U-83

U-84

U-85

U-86

U-87

U-88

U-89

U-90

U-91

U-92

U-93

U-94

U-95

U-96

U-97

U-98

U-99

U-100

U-101

U-102

U-103

U-104

U-105

U-106

U-107

U-108

U-109

U-110

U-111

U-112

U-113

U-114

U-115

U-116

U-117

U-118

U-119

U-120

U-121

U-122

U-123

[030] Embora grupos R^v sejam exibidos nas estruturas U-1 até U-123, observa-se que eles não necessitam estar presentes, pois são substituintes opcionais. Observe-se que, quando R^v é H quando ligado a um átomo, ele é o mesmo se o mencionado átomo for não substituído. Os átomos de nitrogênio que necessitam de substituição para preencher a sua valência são substituídos com H ou R^v . Observe-se que, quando o ponto de ligação entre $(R^v)_r$ e o grupo U for ilustrado como flutuante, $(R^v)_r$ pode ser ligado a qualquer átomo de nitrogênio ou átomo de carbono disponível do grupo U. Observe-se que, quando o ponto de ligação sobre o grupo U for ilustrado como flutuante, o grupo U pode ser ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de qualquer carbono ou nitrogênio disponível do grupo U por substituição de átomo de hidrogênio. Observe-se que alguns grupos U somente podem ser substituídos com menos de quatro grupos R^v (tais como U-2 até U-5, U-7 até U-48 e U-52 até U-61).

[031] Os compostos de acordo com a presente invenção podem existir na forma de um ou mais estereoisômeros. Os vários estereoisômeros incluem enantiômeros, diaestereoisômeros, atropisômeros e isômeros geométricos. Os técnicos no assunto apreciarão que um estereoisômero pode ser mais ativo e/ou pode exibir efeitos benéficos quando enriquecido com relação ao(s) outro(s) estereoisômero(s) ou quando separado do(s) outro(s) estereoisômero(s). Além disso, os técnicos no assunto sabem como separar, enriquecer e/ou preparar seletivamente os mencionados estereoisômeros. Os compostos de acordo com a presente invenção podem estar presentes na forma de mistura de estereoisômeros, estereoisômeros individuais ou como forma opticamente ativa.

[032] Os técnicos no assunto apreciarão que nem todos os anéis heterocíclicos que contêm nitrogênio podem formar *N*-óxidos, pois o nitrogênio requer par isolado disponível para oxidação no óxido; os técnicos no assunto reconhecerão os anéis heterocíclicos que contêm nitrogênio que podem formar

N-óxidos. Os técnicos no assunto também reconhecerão que aminas terciárias podem formar *N*-óxidos. Métodos sintéticos de preparação de *N*-óxidos de heterociclos e aminas terciárias são muito bem conhecidos pelos técnicos no assunto, incluindo a oxidação de heterociclos e aminas terciárias com ácidos peróxi tais como ácido peracético e *m*-cloroperbenzóico (MCPBA), peróxido de hidrogênio, hidroperóxidos de alquila tais como hidroperóxido de *t*-butila, perborato de sódio e dioxiranos tais como dimetildioxirano. Estes métodos de preparação de *N*-óxidos foram extensamente descritos e analisados na literatura; vide, por exemplo: T. L. Gilchrist em *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, págs. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler e B. Stanovnik em *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, págs. 18-20, A. J. Boulton e A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett e B. R. T. Keene em *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, págs. 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler e B. Stanovnik em *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, págs. 285-291, A. R. Katritzky e A. J. Boulton, Eds., Academic Press; e G. W. H. Cheeseman e E. S. G. Werstiuk em *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, págs. 390-392, A. R. Katritzky e A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

[033] Os sais dos compostos de acordo com a presente invenção incluem sais de adição de ácidos com ácidos orgânicos ou inorgânicos tais como ácidos bromídrico, clorídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maléico, malônico, oxálico, propiônico, salicílico, tartárico, 4-toluenossulfônico ou valérico. Os sais dos compostos de acordo com a presente invenção também incluem os formados com bases orgânicas (tais como piridina ou trietilamina) ou bases inorgânicas (tais como hidretos, hidróxidos ou carbonatos de sódio, potássio, lítio, cálcio, magnésio ou bário) quando o composto contiver porção ácida, tal como quando R⁴ é alquilcarbonila e R⁵ é H.

[034] Conseqüentemente, a presente invenção compreende compostos selecionados a partir da Fórmula 1, seus *N*-óxidos e sais apropriados para uso agrícola.

[035] Realizações da presente invenção conforme incluído na Descrição Resumida da Invenção incluem:

[036] Realização 1. Composto da Fórmula 1 em que R¹ é alquila C₁-C₃ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R⁶.

[037] Realização 2. Composto da Realização 1 em que R¹ é alquila C₁-C₃ opcionalmente substituído com halogênio.

[038] Realização 3. Composto da Realização 2 em que R¹ é alquila C₁-C₃ substituído com halogênio.

[039] Realização 4. Composto da Realização 3 em que R¹ é alquila C₁-C₃ substituído com F.

[040] Realização 5. Composto da Realização 4 em que R¹ é alquila C₁-C₃ totalmente substituído com F.

[041] Realização 6. Composto da Realização 5 em que R¹ é CF₃.

[042] Realização 7. Composto da Fórmula 1 em que cada R² é independentemente H, halogênio, haloalquila C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆ ou -CN.

[043] Realização 8. Composto da Realização 7 em que cada R² é independentemente H, CF₃, OCF₃, halogênio ou -CN.

[044] Realização 9. Composto da Realização 7 em que cada R² é independentemente halogênio ou haloalquila C₁-C₃.

[045] Realização 10. Composto da Fórmula 1 em que cada R³ é independentemente H, halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, -CN ou -NO₂.

[046] Realização 11. Composto da Realização 10 em que cada R^3 é independentemente H, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , cicloalquila C_3-C_6 , alcóxi C_1-C_4 ou -CN.

[047] Realização 12. Composto da Realização 11 em que cada R^3 é independentemente H, alquila C_1-C_4 ou -CN.

[048] Realização 13. Composto da Realização 12 em que cada R^3 é H.

[049] Realização 14. Composto da Fórmula 1 em que R^4 é H, alquila C_1-C_6 , alquilcarbonila C_2-C_7 ou alcóxicarbonila C_2-C_7 .

[050] Realização 15. Composto da Realização 14 em que R^4 é H.

[051] Realização 16. Composto da Fórmula 1 em que R^5 é H, OR^{10} , $NR^{11}R^{12}$ ou Q^1 ; ou alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 , cicloalquila C_3-C_4 , alquilcicloalquila C_4-C_7 ou cicloalquilalquila C_4-C_7 , cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^7 .

[052] Realização 17. Composto da Realização 16 em que R^5 é H; ou alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 , cicloalquila C_3-C_4 , alquilcicloalquila C_4-C_7 ou cicloalquilalquila C_4-C_7 , cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^7 .

[053] Realização 18. Composto da Realização 17 em que R^5 é H; ou alquila C_1-C_4 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^7 .

[054] Realização 19. Composto da Realização 18 em que R^5 é alquila C_1-C_4 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^7 .

[055] Realização 20. Composto da Realização 19 em que R^5 é CH_2CF_3 .

[056] Realização 21. Composto da Realização 19 em que R⁵ é CH₂-2-piridinila.

[057] Realização 22. Composto da Realização 16 em que R⁵ é OR¹⁰, NR¹¹R¹² ou Q¹.

[058] Realização 23. Composto da Realização 22 em que R⁵ é NR¹¹R¹².

[059] Realização 24. Composto da Realização 22 em que R⁵ é Q¹.

[060] Realização 25. Composto da Fórmula 1 em que R⁶ é halogênio.

[061] Realização 26. Composto da Fórmula 1 em que cada R⁷ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₄, alquilaminocarbonila C₂-C₅, haloalquilcarbonila C₂-C₅, haloalcoxicarbonila C₂-C₅, haloalquilaminocarbonila C₂-C₅, -NH₂, -CN ou -NO₂; ou Q².

[062] Realização 27. Composto da Realização 26 em que cada R⁷ é independentemente halogênio, alcoxicarbonila C₂-C₄, alquilaminocarbonila C₂-C₅, haloalcoxicarbonila C₂-C₅, haloalquilaminocarbonila C₂-C₅, -NH₂, -CN ou -NO₂; ou Q².

[063] Realização 28. Composto da Realização 27 em que cada R⁷ é independentemente halogênio, alquilaminocarbonila C₂-C₅, haloalquilaminocarbonila C₂-C₅ ou Q².

[064] Realização 29. Composto da Realização 28 em que cada R⁷ é independentemente halogênio ou Q².

[065] Realização 30. Composto da Realização 29 em que cada R⁷ é independentemente F, Cl ou Br.

[066] Realização 31. Composto da Realização 30 em que cada R⁷ é F.

[067] Realização 32. Composto da Realização 29 em que cada R^7 é Q^2 .

[068] Realização 33. Composto da Fórmula 1 em que cada R^8 é independentemente halogênio, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 ou $-CN$.

[069] Realização 34. Composto da Fórmula 1 em que cada R^9 é halogênio, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , $-CN$, fenila ou piridinila.

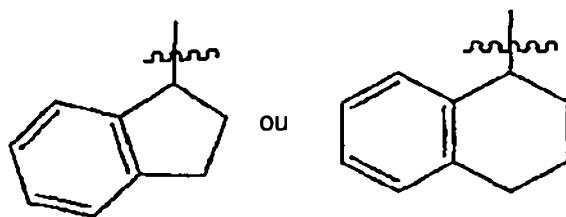
[070] Realização 35. Composto da Fórmula 1 em que R^{10} é H; ou alquila C_1-C_6 opcionalmente substituído com um ou mais halogênios.

[071] Realização 36. Composto da Fórmula 1 em que R^{11} é H, alquila C_1-C_6 , alquilcarbonila C_2-C_7 ou alcóxicarbonila C_2-C_7 .

[072] Realização 37. Composto da Realização 34 em que R^{11} é H.

[073] Realização 38. Composto da Fórmula 1 em que R^{12} é H ou Q^3 ; ou alquila C_1-C_4 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^7 .

[074] Realização 39. Composto da Fórmula 1 em que Q^1 é fenila, piridinila, tiazolila,



cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^8 .

[075] Realização 40. Composto da Fórmula 1 em que cada Q^2 é independentemente fenila, piridinila ou tiazolila, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^9 .

[076] Realização 41. Composto da Realização 34 em que cada Q^2 é independentemente fenila, piridinila ou tiazolila.

[077] Realização 42. Composto da Fórmula 1 em que Q^3 é fenila, piridinila ou tiazolila, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^9 .

[078] Realização 43. Composto da Fórmula 1 em que A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 e A^6 são CR^3 cada um.

[079] Realização 44. Composto da Fórmula 1 em que A^1 é N; e A^2 , A^3 , A^4 , A^5 e A^6 são CR^3 cada um.

[080] Realização 45. Composto da Fórmula 1 em que A^2 é N; e A^1 , A^3 , A^4 , A^5 e A^6 são CR^3 cada um.

[081] Realização 46. Composto da Fórmula 1 em que A^4 é N; e A^1 , A^2 , A^3 , A^5 e A^6 são CR^3 cada um.

[082] Realização 47. Composto da Fórmula 1 em que A^6 é N; e A^1 , A^2 , A^3 , A^4 e A^5 são CR^3 cada um.

[083] Realização 48. Composto da Fórmula 1 em que B^1 , B^2 e B^3 são independentemente CR^2 .

[084] Realização 49. Composto da Realização 48 em que B^2 é CH.

[085] Realização 50. Composto da Fórmula 1 em que B^1 é N; e B^2 e B^3 são independentemente CR^2 .

[086] Realização 51. Composto da Fórmula 1 em que B^2 é N; e B^1 e B^3 são independentemente CR^2 .

[087] Realização 52. Composto da Fórmula 1 em que B^2 é CR^2 ; e B^1 e B^3 são N.

[088] Realização 53. Composto da Fórmula 1 em que W é O.

[089] Realização 54. Composto da Fórmula 1 em que n é 0.

[090] Realizações da presente invenção, incluindo as Realizações 1 a 54 acima bem como quaisquer outras realizações descritas no presente, podem ser combinadas de qualquer forma e as descrições de variáveis nas realizações referem-se não apenas aos compostos da

Fórmula 1, mas também aos compostos iniciais e compostos intermediários. Além disso, realizações da presente invenção, incluindo as Realizações 1 a 54 acima bem como quaisquer outras realizações descritas no presente e qualquer de suas combinações, referem-se às composições e métodos de acordo com a presente invenção.

[091] Combinações das Realizações 1 a 54 são ilustradas por:

[092] Realização A. Composto da Fórmula 1 em que:

- R^1 é alquila C_1-C_3 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^6 ;
- cada R^2 é independentemente H, halogênio, haloalquila C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 ou $-CN$; e
- cada R^3 é independentemente H, halogênio, alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , haloalcóxi C_1-C_6 , $-CN$ ou $-NO_2$.

[093] Realização B. Composto da Realização A, em que:

- B^1 , B^2 e B^3 são independentemente CR^2 ;
- W é O;
- R^4 é H, alquila C_1-C_6 , alquilcarbonila C_2-C_7 ou alcóxicarbonila C_2-C_7 ; e
- R^5 é H, $NR^{11}R^{12}$ ou Q^1 ; ou alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 , cicloalquila C_3-C_4 , alquilocicloalquila C_4-C_7 ou cicloalquilalquila C_4-C_7 , cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^7 .

[094] Realização C. Composto da Realização B, em que:

- R^1 é alquila C_1-C_3 opcionalmente substituído com halogênio;
- cada R^2 é independentemente H, CF_3 , OCF_3 , halogênio ou $-CN$;
- cada R^3 é independentemente H, alquila C_1-C_4 , haloalquila

C₁-C₄, ciclopropila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₄ ou -CN; e

- cada R⁷ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₄, alquilaminocarbonila C₂-C₅, haloalquilcarbonila C₂-C₅, haloalcoxicarbonila C₂-C₅, haloalquilaminocarbonila C₂-C₅, -NH₂, -CN ou -NO₂; ou Q².

[095] Realização D. Composto da Realização C em que:

- R⁴ é H;
- R⁵ é alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R⁷;

- cada R⁷ é independentemente halogênio ou Q²; e
- cada Q² é independentemente fenila, piridinila ou tiazolila.

[096] Realização E. Composto da Realização D em que:

- R¹ é CF₃;
- A¹, A², A³, A⁴, A⁵ e A⁶ são CR³ cada um;
- B² é CR²; e
- cada R³ é independentemente H, alquila C₁-C₄ ou -CN.

[097] Realização F. Composto da Realização E em que:

- B² é CH;
- cada R² é independentemente halogênio ou haloalquila C₁-C₃;

- R³ é H;
- R⁵ é CH₂CF₃ ou CH₂-2-piridinila; e
- n é 0.

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

- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalenocarboxamida;

- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-(2-piridinilmetil)-1-naftalenocarboxamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-(2-piridinilmetil)-1-naftalenocarbotioamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-etil-1-naftalenocarboxamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-(2-metoxietil)-1-naftalenocarboxamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-[2-(2,2,2-trifluoroetil)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida;
- 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-(2-piridinilmetil)-8-quinolinocarboxamida;
- 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-(2-piridinilmetil)-8-isoquinolinocarboxamida; e
- 1-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-(2-piridinilmetil)-4-isoquinolinocarboxamida.

[099] Merecem observação realizações específicas que incluem compostos da Fórmula 1 selecionados a partir do grupo que consiste de:

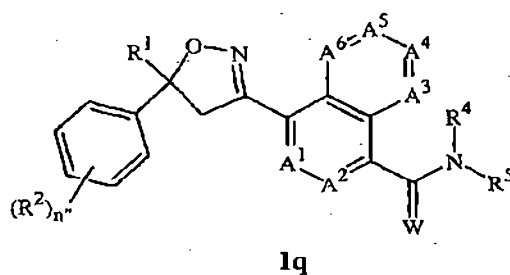
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalenocarboxamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-(2-piridinilmetil)-1-naftalenocarboxamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-(2-piridinilmetil)-1-naftalenocarbotioamida;
- 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-(2-piridinilmetil)-8-quinolinocarboxamida;
- 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- N-(2-piridinilmetil)-8-isoquinolinocarboxamida; e

- 1-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazoliil]-*N*-(2-piridinilmetil)-4-isoquinolinocarboxamida.

[0100] Realizações específicas adicionais incluem qualquer combinação dos compostos da Fórmula 1 selecionados a partir do grupo imediatamente acima.

[0101] Realizações da presente invenção incluem ainda:

Realização AA. Composto da Fórmula 1q, seu *N*-óxido ou sal:



em que:

- A¹, A², A³, A⁴, A⁵ e A⁶ são selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de CR³ e N, desde que no máximo três dentre A¹, A², A³, A⁴, A⁵ e A⁶ sejam N;
- W é O ou S;
- R¹ é alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R⁶;
- cada R² é independentemente H, halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₄, -CN ou -NO₂;
- cada R³ é independentemente H, halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₆,

haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, -CN ou -NO₂;

- R⁴ é H, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilocicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcóxicarbonila C₂-C₇;

- R⁵ é H, OR¹⁰, NR¹¹R¹² ou Q¹; ou alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilocicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R⁷; ou

- R⁴ e R⁵ são tomados em conjunto com o nitrogênio ao qual são ligados para formar anel que contém dois a seis átomos de carbono e, opcionalmente, um átomo adicional selecionado a partir do grupo que consiste de N, S e O, em que o mencionado anel é opcionalmente substituído com um a quatro substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de alquila C₁-C₂, halogênio, -CN, -NO₂ e alcóxi C₁-C₂;

- cada R⁶ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, -CN ou -NO₂;

- cada R⁷ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alquilcarbonila C₂-C₇, alcóxicarbonila C₂-C₇, alquilaminocarbonila C₂-C₇, dialquilaminocarbonila C₃-C₉, haloalquilcarbonila C₂-C₇, haloalcóxicarbonila C₂-C₇, haloalquilaminocarbonila C₂-C₇, halodialquilaminocarbonila C₃-C₉, hidróxi, -NH₂, -CN ou -NO₂; ou Q²;

- cada R⁸ é independentemente halogênio, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆,

haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₄, -CN ou -NO₂;

- cada R⁹ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₆, -CN, -NO₂, fenila ou piridinila;

- R¹⁰ é H, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilocicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais halogênios;

- R¹¹ é H, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilocicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcóxicarbonila C₂-C₇;

- R¹² é H; Q³; ou alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilocicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R⁷; ou

- R¹¹ e R¹² são tomados em conjunto com o nitrogênio ao qual são ligados para formar anel que contém dois a seis átomos de carbono e, opcionalmente, um átomo adicional selecionado a partir do grupo que consiste de N, S e O, em que o mencionado anel é opcionalmente substituído com um a quatro substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de alquila C₁-C₂, halogênio, -CN, -NO₂ e alcóxi C₁-C₂;

- Q¹ é anel fenila, anel heterocíclico com 5 ou 6 membros, sistema de anéis bicíclicos fundidos com 8, 9 ou 10 membros que contém opcionalmente 1 a 3 heteroátomos selecionados a partir de 1 O, até 1 S e até 3 N, em que cada anel ou sistema de anéis é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R⁸;

- cada Q^2 é independentemente anel fenila ou anel heterocíclico com 5 ou 6 membros, em que cada anel é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^9 ;

- Q^3 é anel fenila ou anel heterocíclico com 5 ou 6 membros, em que cada anel é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^9 ; e

- n'' é 1, 2, 3, 4 ou 5.

[0102] Merecem observação que compostos de acordo com a presente invenção são caracterizados por padrões residuais no solo e/ou metabólicos favoráveis e exibem a atividade que controla espectro de pragas invertebradas agronômicas e não agronômicas.

[0103] Merece observação específica que, por motivos de espectro de controle de pragas invertebradas e importância agronômica, a proteção de safras agronômicas contra lesões ou danos causados por pragas invertebradas por meio de controle de pragas invertebradas são realizações da presente invenção. Os compostos de acordo com a presente invenção devido às suas propriedades de translocação favoráveis ou sistemicidade em plantas também protegem partes foliares ou outras das plantas que não são colocadas diretamente em contato com composto da Fórmula 1 ou composição que compreende o composto.

[0104] Também merecem observação como realizações da presente invenção composições que compreendem composto de acordo com qualquer das realizações anteriores, bem como quaisquer outras realizações descritas no presente e quaisquer de suas combinações, e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativo, diluente sólido e diluente líquido, em que as mencionadas composições

compreendem ainda opcionalmente pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional.

[0105] Também merecem observação como realizações da presente invenção composições de controle de pragas invertebradas que compreendem quantidade biologicamente eficaz de composto de acordo com qualquer das realizações anteriores, bem como quaisquer outras realizações descritas no presente e qualquer de suas combinações, e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativo, diluente sólido e diluente líquido, em que as mencionadas composições compreendem ainda opcionalmente quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional. Realizações da presente invenção incluem ainda métodos de controle de pragas invertebradas que compreendem o contato da praga invertebrada ou seu ambiente com quantidade biologicamente eficaz de composto de acordo com qualquer das realizações anteriores (tal como na forma de composição descrita no presente).

[0106] Realizações da presente invenção também incluem composição que compreende composto de acordo com qualquer das realizações anteriores, na forma de formulação líquida para encharcamento do solo. Realizações da presente invenção incluem ainda métodos de controle de pragas invertebradas que compreendem o contato do solo com composição líquida na forma de encharcamento do solo que compreende quantidade biologicamente eficaz de composto de acordo com qualquer das realizações anteriores.

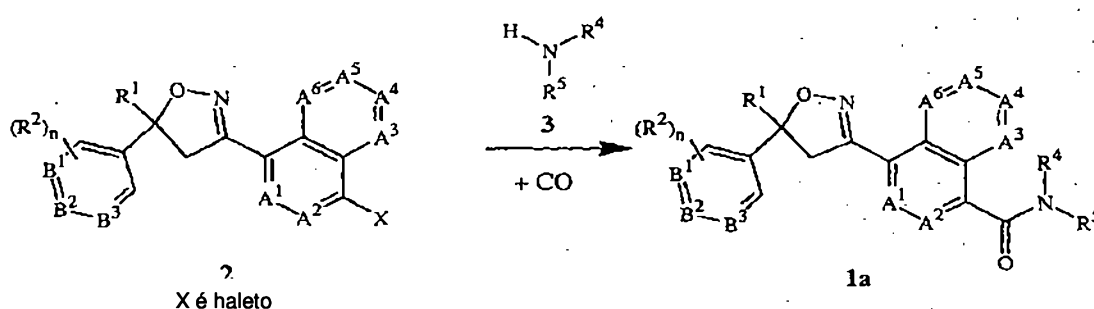
[0107] Realizações da presente invenção também incluem composição de pulverização para controle de pragas invertebradas que compreende quantidade biologicamente eficaz de composto de acordo com qualquer das realizações anteriores e propelente. Realizações da presente invenção incluem ainda composição de isca para controle de pragas invertebradas que compreende quantidade biologicamente eficaz de composto

de acordo com qualquer das realizações anteriores, um ou mais materiais alimentícios, opcionalmente um atrativo e opcionalmente um umectante.. Realizações da presente invenção também incluem dispositivo de controle de pragas invertebradas que compreende a mencionada composição de isca e abrigo adaptado para receber a mencionada composição de isca, em que o abrigo possui pelo menos uma abertura dimensionada para permitir que a praga invertebrada passe através da abertura, de forma que a praga invertebrada possa ter acesso à mencionada composição de isca a partir de local fora do abrigo e em que o abrigo é adicionalmente adaptado para colocação em local de atividade conhecida ou potencial para a praga invertebrada ou perto dele.

[0108] Um ou mais dos métodos e variações a seguir descritos nos Esquemas 1 a 12 podem ser utilizados para preparar os compostos da Fórmula 1. As definições de R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , A^6 , B^1 , B^2 , B^3 , n e W nos compostos das Fórmulas 1 a 15 abaixo são conforme definido acima na Descrição Resumida da Invenção, a menos que indicado em contrário. Os compostos das Fórmulas 1a e 1b são subconjuntos dos compostos da Fórmula 1, compostos das Fórmulas 12a a 12c são subconjuntos da Fórmula 12 e o composto da Fórmula 15a é composto da Fórmula 15.

[0109] Os compostos da Fórmula 1a (Fórmula 1 em que W é O) podem ser preparados por meio da aminocarbonilação de iodetos ou brometos de arila da Fórmula 2 em que X é Br ou I, com compostos amino apropriadamente substituídos da Fórmula 3 conforme exibido no Esquema 1.

ESQUEMA 1



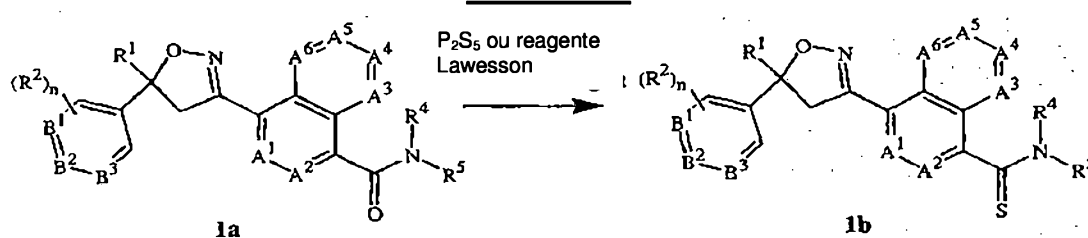
[0110] Esta reação é tipicamente conduzida com brometo de arila da Fórmula 2 em que X é Br na presença de catalisador de paládio sob atmosfera de CO. Os catalisadores de paládio utilizados para o presente método compreendem tipicamente paládio em estado de oxidação formal de 0 (ou seja, Pd(0)) ou 2 (ou seja, Pd(II)). Ampla variedade desses complexos e compostos que contêm paládio é útil como catalisadores para o método do presente. Exemplos de complexos e compostos que contêm paládio úteis como catalisadores no método do Esquema 1 incluem $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ (dicloreto de bis(trifenilfosfino)paládio (II)), $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (tetraquis(trifenilfosfino)paládio (0)), $\text{Pd}(\text{C}_5\text{H}_7\text{O}_2)_2$ (acetilacetonato de paládio (II)), $\text{Pd}_2(\text{dpa})_3$ (tris(dibenzilidenoacetona)dipaládio (0)) e [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaládio (II). O método do Esquema 1 geralmente é conduzido em fase líquida e, portanto, para ser mais eficaz, o catalisador de paládio possui preferencialmente boa solubilidade na fase líquida. Solventes úteis incluem, por exemplo, éteres tais como 1,2-dimetoxietano, amidas tais como *N,N*-dimetilacetamida e hidrocarbonetos não halogenados tais como tolueno.

[0111] O método do Esquema 1 pode ser conduzido ao longo de ampla faixa de temperaturas, que varia de cerca de 25 a cerca de 150 °C. Merecem observação temperaturas de cerca de 60 a cerca de 110 °C, que tipicamente fornecem velocidades de reação mais altas e altos rendimentos de produto. Os métodos e procedimentos gerais de aminocarbonilação com brometo de arila e amina são bem conhecidos na literatura; vide, por exemplo, H. Horino *et al*, *Synthesis* 1989, 715; e J. J. Li, G. W. Gribble, editores, *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist*, 2000. O método do Esquema 1 é ilustrado na Etapa C do Exemplo 2 e Etapa E do Exemplo 4.

[0112] Conforme exibido no Esquema 2, os compostos da Fórmula 1b (Fórmula 1 em que W é S) podem ser preparados por meio de tratamento de

compostos de amida correspondentes da Fórmula 1a com reagente de transferência tio, tal como P_2S_5 (vide, por exemplo, E. Klingsberg *et al*, *J. Am. Chem. Soc.* 1951, 72, 4988; E. C. Taylor Jr. *et al*, *J. Am. Chem. Soc.* 1953, 75, 1904; R. Crossley *et al*, *J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1*, 1976, 977) ou reagente de Lawesson (2,5-bis (4-metoxifenil)-1,3-ditio-2,4-difosfetano-2,4-dissulfeto; vide, por exemplo, S. Prabhakar *et al*, *Synthesis*, 1984, 829).

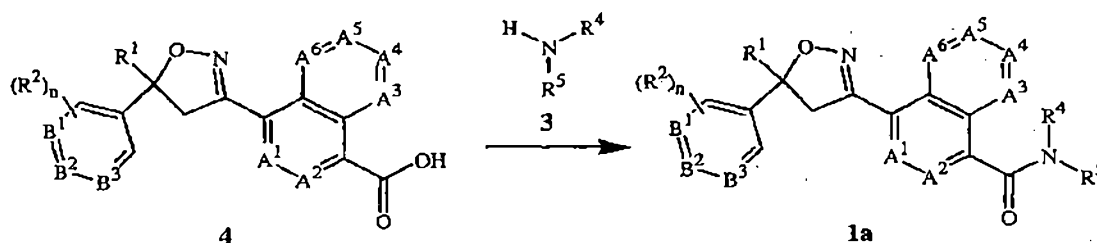
ESQUEMA 2



[0113] O método do Esquema 2 pode ser conduzido ao longo de ampla variedade de temperaturas, que inclui cerca de 50 a cerca de 150 °C. Merecem observação temperaturas de cerca de 70 a cerca de 120 °C, que fornecem tipicamente velocidades de reação mais altas e altos rendimentos de produto. O método do Esquema 2 é ilustrado no Exemplo 3.

[0114] Compostos da Fórmula 1a podem também ser preparados por meio do acoplamento de ácidos carboxílicos da Fórmula 4 com compostos amino apropriadamente substituídos da Fórmula 3 conforme exibido no Esquema 3.

ESQUEMA 3

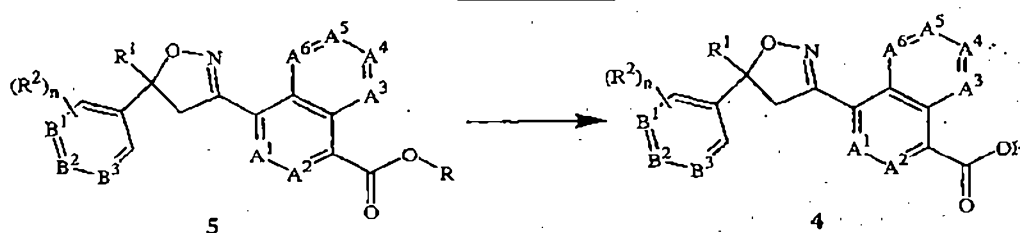


[0115] Esta reação geralmente é conduzida na presença de reagente de acoplamento desidratante tal como diciclohexil carbodiimida, 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida, anidrido cíclico de ácido 1-

propanofosfônico ou carbonil diimidazol na presença de base tal como trietilamina, piridina, 4-(dimetilamino)piridina ou *N,N*-diisopropiletilamina em solvente aprótico anidro tal como diclorometano ou tetraidrofuran sob temperatura tipicamente da temperatura ambiente a 70 °C. O método do Esquema 3 é ilustrado na Etapa E do Exemplo 1.

[0116] Compostos da Fórmula 4 podem ser preparados por meio de hidrólise do éster da Fórmula 5, em que R é metila ou etila, conforme exibido no Esquema 4.

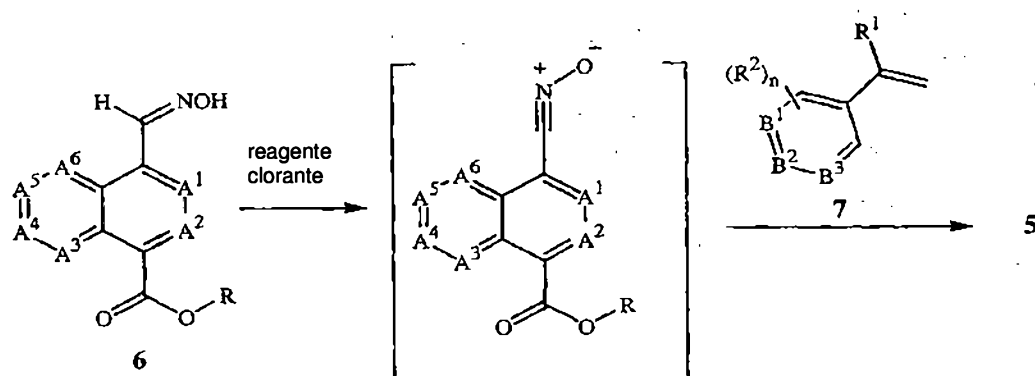
ESQUEMA 4



[0117] Neste método, o composto éster da Fórmula 5 é convertido no ácido carboxílico correspondente da Fórmula 4 por meio de procedimentos gerais bem conhecidos na técnica. O tratamento de metil ou etil éster da Fórmula 5 com hidróxido de lítio aquoso em tetraidrofuran, seguido por acidificação, gera, por exemplo, o ácido carboxílico correspondente da Fórmula 4. O método do Esquema 4 é ilustrado na Etapa D do Exemplo 1.

[0118] Compostos da Fórmula 5 podem ser preparados por meio de cicloadição 1,3-dipolar de estirenos da Fórmula 7 com óxidos de nitrila derivados de oxima da Fórmula 6 conforme exibido no Esquema 5.

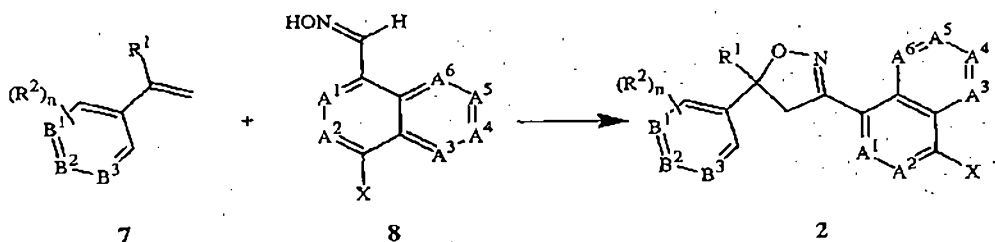
ESQUEMA 5



[0119] Esta reação processa-se tipicamente por meio da intermediação de cloreto de hidroxiamila gerado *in situ*, que é descloridratado no óxido de nitrila, que sofre em seguida cicloadição 1,3-dipolar com o estireno 7 para gerar compostos da Fórmula 5. Em procedimento típico, reagente clorante tal como hipoclorito de sódio, *N*-clorossuccinimida ou cloramina-T é combinado com a oxima na presença do estireno. Dependendo das condições, bases amina tais como piridina ou trietilamina podem ser necessárias para facilitar a reação de descloridratação. A reação pode ser conduzida em ampla série de solventes, que inclui tetraidrofurano, dietil éter, cloreto de metileno, dioxano e tolueno, com temperaturas que variam da temperatura ambiente à temperatura de refluxo do solvente. Procedimentos gerais de cicloadição de óxidos de nitrila com olefinas são bem documentados na literatura química; vide, por exemplo, Lee, *Synthesis*, 1982, 6, 508-509; Kanemasa *et al*, *Tetrahedron*, 2000, 56, 1057-1064; EP 1.538.138-A1, bem como as referências ali mencionadas. O método do Esquema 4 é ilustrado na Etapa C do Exemplo 1.

[0120] Compostos da Fórmula 2 podem também ser preparados por meio da cicloadição 1,3-dipolar de estirenos da Fórmula 7 com óxidos de nitrila derivados de oximas da Fórmula 8, conforme exibido no Esquema 6.

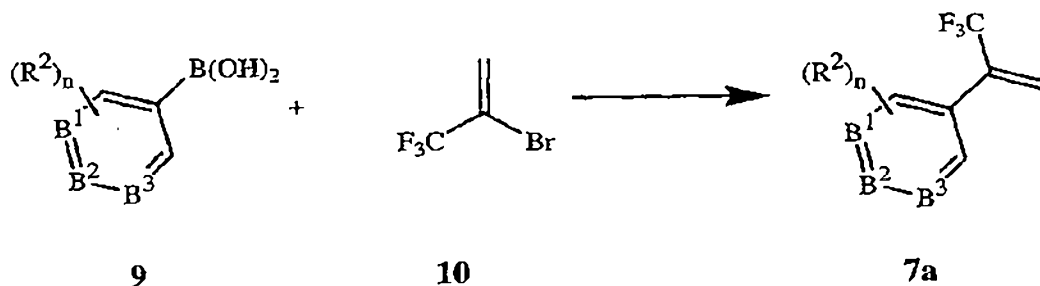
ESQUEMA 6



[0121] No método do Esquema 6, os compostos da Fórmula 2 em que X é átomo de halogênio são gerados por meio de contato do composto da Fórmula 8 com reagente clorante seguido pela adição de composto da Fórmula 7. O método do Esquema 6 é conduzido de forma análoga ao método do Esquema 5 já descrito. O método do Esquema 6 é ilustrado na Etapa B do Exemplo 2, Etapa D do Exemplo 4 e Etapa C do Exemplo 5.

[0122] Grupo especialmente útil de estirenos para a síntese de compostos da Fórmula 1 é representado pela Fórmula 7a conforme exibido no Esquema 7. Estes intermediários podem ser preparados por meio do acoplamento catalisado por paládio de ácidos aril borônicos da Fórmula 9 com o 2-bromo-3,3,3-trifluoropropeno disponível comercialmente (Fórmula 10). Procedimentos gerais para esta reação são documentados na literatura química; vide Pan *et al*, *J. Fluorine Chemistry*, 1999, 95, 167-170. O método do Esquema 7 é ilustrado na Etapa B do Exemplo 1.

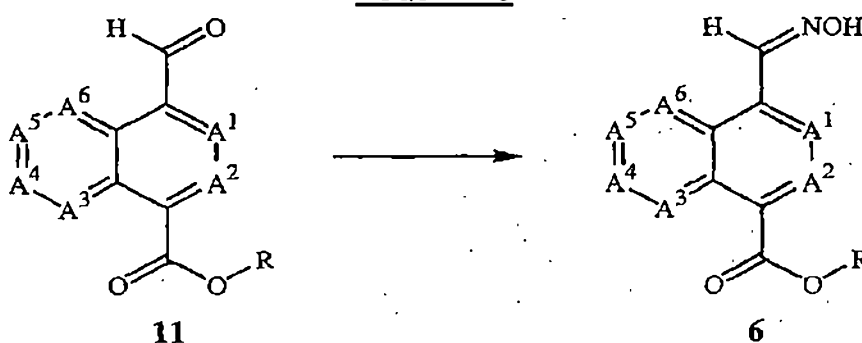
ESQUEMA 7



[0123] As oximas da Fórmula 6 podem ser preparadas por meio da reação de aldeídos 11 com hidroxilamina conforme exibido no Esquema 8. Vide, por exemplo, H. K. Jung *et al*, *Bioorg. Med. Chem.* 2004, 12, 3965.

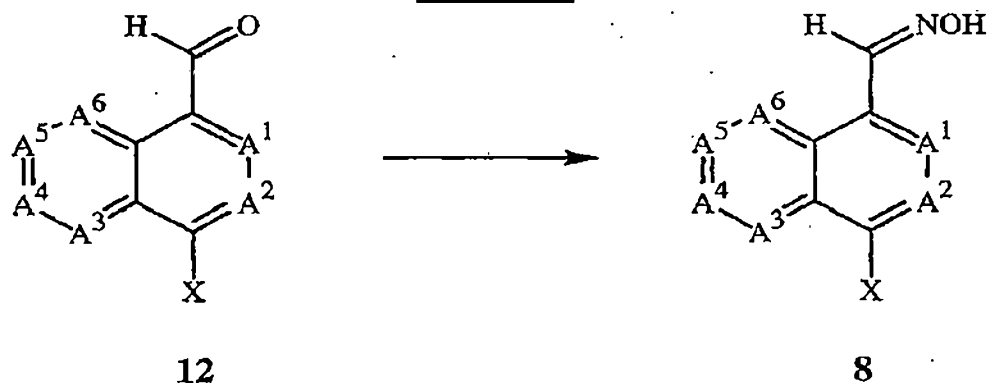
[0124] Os aldeídos da Fórmula 11 podem ser preparados por meio de ampla variedade de métodos conhecidos na técnica; alguns dos aldeídos são compostos conhecidos ou disponíveis comercialmente. A preparação do composto da Fórmula 11 em que A¹, A², A³, A⁴, A⁵ e A⁶ são CH e R⁹ é Me, por exemplo, é descrita por P. Mandenson *et al*, *J. Med. Chem.* 2002, 45, 5755. O método do Esquema 8 é ilustrado na Etapa A do Exemplo 1.

ESQUEMA 8



[0125] Conforme exibido no Esquema 9, as oximas da Fórmula 8, em que X é átomo de halogênio, podem ser preparadas por meio dos aldeídos correspondentes da Fórmula 12 análogos ao método do Esquema 8. O método do Esquema 9 é ilustrado na Etapa A do Exemplo 2, Etapa C do Exemplo 4 e Etapa B do Exemplo 5.

ESQUEMA 9

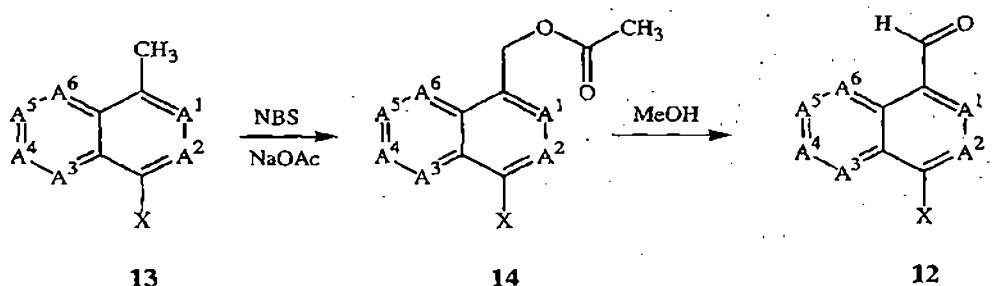


[0126] Os compostos da Fórmula 12 são compostos conhecidos ou disponíveis comercialmente, ou podem ser preparados por meio de ampla variedade de métodos conhecidos na técnica. Composto da Fórmula 12, por

exemplo, pode ser preparado por meio de formilação direta dos haletos de arila correspondentes; vide G. E. Boswell *et al*, *J. Org. Chem.* 1995, 65, 6592; ou por meio de redução dos aril ésteres correspondentes, vide as referências P. R. Bernstein *et al*, *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2001, 2769 e L. W. Deady *et al*, *Aust. J. Chem.* 1989, 42, 1029.

[0127] Para exemplo específico, conforme exibido no Esquema 10, aldeídos da Fórmula 12 podem ser preparados a partir dos compostos metil-substituídos correspondentes da Fórmula 13 (em que X é halogênio) por meio de reação com *N*-bromossuccinimida (NBS) na presença de 2,2'-azobis (2-metilpropionitrila) (AIBN) e acetato de sódio para gerar acetatos da Fórmula 14, que são convertidos em seguida nos aldeídos da Fórmula 12 por meio de esterificação e oxidação. O método do Esquema 10 é ilustrado no Exemplo 4, Etapas A e B.

ESQUEMA 10

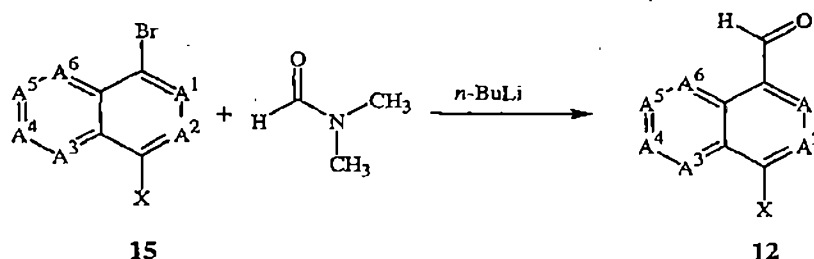


[0128] Os compostos da Fórmula 13 são compostos conhecidos ou comercialmente disponíveis, ou podem ser preparados por meio de uma série de métodos conhecidos na técnica. Composto da Fórmula 13, por exemplo, em que A³ é N, A¹, A², A⁴, A⁵ e A⁶ são CH, pode ser preparado conforme descrito em *Molecules*, 2004, 9, 178.

[0129] Método alternativo de preparação de aldeídos da Fórmula 12 (em que X é átomo de halogênio) é exibido no Esquema 11. O grupo formila da Fórmula 12 pode ser introduzido no sistema de anéis aromáticos com dez

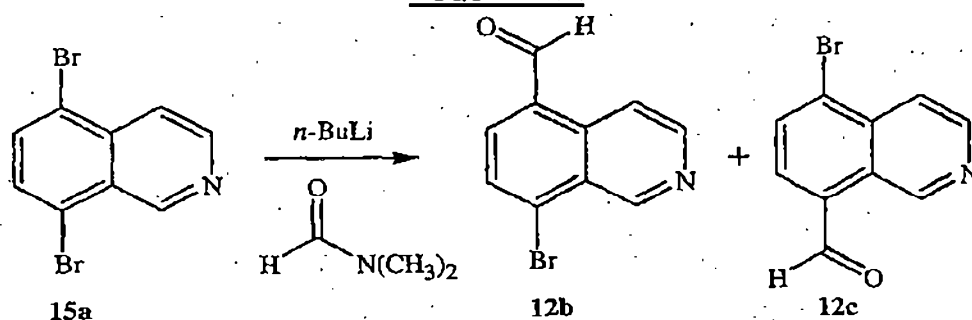
membros por meio de deslocamento do substituinte de bromo de composto da Fórmula 15. Para referências deste método geral, vide *Synthesis*, 2006, 293, e *Bioorg. Med. Chem.* 2004, 12, 715. O método do Esquema 11 é ilustrado na Etapa A do Exemplo 5.

ESQUEMA 11



[0130] Conforme exibido no Esquema 12, aldeídos das Fórmulas 12b e 12c podem ser preparados a partir de 5,8-dibromoisoquinolina (Fórmula 15a) por meio de tratamento do composto da Fórmula 15a com *n*-BuLi a -78 °C e resfriamento com *N,N*-dimetilformamida.

ESQUEMA 12



[0131] O composto da Fórmula 15a pode ser preparado por meio do método descrito em *Synthesis*, 2002, 83; vide, por exemplo, ou por meio do método de G. E. Boswell *et al*, *J. Org. Chem.* 1995, 65, 6592. Alternativamente, aril aldeídos da Fórmula 12 podem ser preparados por meio de ampla variedade de outros métodos conhecidos na técnica, tal como por meio da redução dos aril ésteres correspondentes, vide referências P. R. Bernstein *et al*, *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2001, 2769 e L. W. Deady *et al*, *Aust. J. Chem.*, 1989, 42, 1029.

[0132] Reconhece-se que alguns reagentes e condições de reação descritos acima para a preparação de compostos da Fórmula 1 podem não ser compatíveis com certas funcionalidades presentes nos intermediários. Nestes casos, a incorporação de seqüências de proteção e desproteção ou interconversões de grupos funcionais na síntese auxiliará na obtenção dos produtos desejados. O uso e seleção dos grupos protetores será evidente para os técnicos em síntese química (vide, por exemplo, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M., *Protective Groups in Organic Synthesis*, segunda edição: Wiley: Nova Iorque, 1991). Os técnicos no assunto reconhecerão que, em alguns casos, após a introdução de um dado reagente conforme ilustrado em qualquer esquema individual, pode ser necessário realizar etapas sintéticas rotineiras adicionais não descritas em detalhes para completar a síntese dos compostos da Fórmula 1. Os técnicos no assunto também reconhecerão que pode ser necessário realizar combinação das etapas ilustradas nos esquemas acima em ordem diferente da indicada pela seqüência específica apresentada para a preparação dos compostos da Fórmula 1.

[0133] Os técnicos no assunto também reconhecerão que compostos da Fórmula 1 e os intermediários descritos no presente podem ser submetidos a várias reações eletrofílicas, nucleofílicas, radicais, organometálicas, de oxidação e de redução para adicionar substituintes ou modificar substituintes existentes.

[0134] Sem elaboração adicional, acredita-se que os técnicos no assunto, utilizando o relatório descritivo acima, possam utilizar a presente invenção até o máximo possível. Os Exemplos a seguir devem, portanto, ser considerados meramente ilustrativos e não limitadores do relatório descritivo de nenhuma forma. Os espectros de NMR ^1H são relatados em ppm a partir de

tetrametilsilano: “s” indica isolado, “d” indica dupla, “t” indica trio, “m” indica múltiplo, “dd” indica par de duplas e “br s” indica isolado amplo.

EXEMPLO 1

PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA

ETAPA A: PREPARAÇÃO DE 4-[(HIDROXIIMINO)METIL]-1-NAFTALENOCARBOXILATO DE METILA

[0135] A solução agitada de 4-formil-1-naftalenocarboxilato de metila (2,2 g, 10,3 mmol) em metanol (50 ml), adicionou-se solução de hidroxilamina (1,33 ml, 50% em água). Após agitação à temperatura ambiente por duas horas, a mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida para fornecer o composto título na forma de sólido amarelo claro (2,55 g).

[0136] NMR ^1H (CDCl_3) δ 8,93 (d, 1H), 8,86 (s, 1H), 8,41 (d, 1H), 8,14 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,63 (m, 2H), 4,02 (s, 3H).

ETAPA B: PREPARAÇÃO DE 1-3-DICLORO-5-[1-(TRIMETILFLUOROMETIL)ETENIL]BENZENO

[0137] A mistura de tetraidrofuran (33 ml), 1,2-dimetoxietano (33 ml) e 4 N hidróxido de potássio aquoso (33 ml) em tubo vedado Fisher-Porter de 200 ml, adicionou-se ácido 3,5-diclorofenilborônico (8,72 g, 45,7 mmol) e 2-bromo-3,3,3-trifluoropropeno (10,0 g, 57,2 mmol), seguido pela adição de tetraquis(trifenilfosfino)paládio (0) (264 mg, 0,229 mmol). Em seguida, a mistura foi aquecida a 75 °C por três horas. A mistura de reação foi repartida entre dietil éter e água. O extrato aquoso foi lavado com dietil éter (2 x 20 ml). Os extratos orgânicos foram combinados, secos (MgSO_4) e concentrados sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia de sílica gel utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para gerar o composto título na forma de óleo transparente (4,421 g).

[0138] NMR ^1H (CDCl_3) δ 7,41 (s, 2H), 7,33 (s, 1H), 6,04 (d, 1H), 5,82 (d, 1H).

ETAPA C: PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-1-NAFTALENOCARBOXILATO DE METILA

[0139] A solução agitada de 4-[(hidroxiimino)metil]-1-naftalenocarboxilato de metila (ou seja, o produto da Etapa A) (1,0 g, 4,36 mmol) em *N, N*-dimetilformamida (5,0 ml), adicionou-se *N*-clorossuccinimida (1,16 g, 8,72 mmol). Esta mistura foi agitada por uma hora e meia à temperatura ambiente e, em seguida, adicionou-se solução de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benzeno (ou seja, o produto da Etapa B) (3,20 g, 13,1 mmol) e trietilamina (6,1 ml, 43,6 mmol) em *N, N*-dimetilformamida (4,0 ml). Após agitação por duas horas adicionais à temperatura ambiente, a mistura de reação foi diluída com água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com salmoura, seca (Na_2SO_4) e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia de sílica gel utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para gerar o composto título na forma de óleo amarelo claro (700 mg, rendimento de 34%).

[0140] NMR ^1H (CDCl_3): δ 8,88 (d, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,68 (m, 2H), 7,55 (m, 3H), 7,46 (dd, 1H), 4,27 (d, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,91 (d, 1H).

ETAPA D: PREPARAÇÃO DE ÁCIDO 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-1-NAFTALENOCARBOXÍLICO

[0141] A solução agitada de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-1-naftalenocarboxilato de metila (ou seja, o produto da Etapa C) (650 mg, 1,39 mmol) em tetraidrofuran (10 ml), adicionou-se solução de monohidrato hidróxido de lítio (350 mg, 8,34 mmol) em água (10 ml), seguida por metanol (10 ml). A mistura de reação foi agitada por uma noite à temperatura ambiente. A mistura de reação foi repartida entre água e dietil éter. Em seguida, a camada aquosa foi acidificada com 6 N ácido clorídrico aquoso até pH 2 e

extraída com acetato de etila. As camadas orgânicas combinadas foram lavadas com salmoura, secas e concentradas para gerar o composto título na forma de sólido branco (450 mg).

[0142] NMR ^1H (CDCl_3): δ 9,08 (d, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 7,71 (m, 2H), 7,57 (m, 3H), 7,46 (dd, 1H), 4,28 (d, 1H), 3,91 (d, 1H).

ETAPA E: PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA

[0143] Mistura de ácido 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-1-naftalenocarboxílico (ou seja, o produto da Etapa C) (190 mg, 0,42 mmol), 4-(dimetilamino)piridina (77 mg, 0,63 mmol), anidrido propilfosfônico (0,38 ml, 0,63 mmol, 50% em acetato de etila) e 2,2,2-trifluoroetilamina (0,033 ml, 0,42 ml) em diclorometano (5 ml) foi agitada à temperatura ambiente por uma noite. A mistura de reação foi concentrada e o resíduo foi purificado por meio de cromatografia de coluna sobre sílica gel utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para gerar o produto título, composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido branco (71 mg).

[0144] NMR ^1H (CDCl_3): 8,78 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,63 (m, 2H), 7,56 (m, 2H), 7,52 (d, 1H), 7,46 (m, 1H), 7,44 (d, 1H), 6,41 (t, 1H), 4,23 (d, 1H), 4,20 (m, 2H), 3,87 (d, 1H).

EXEMPLO 2

PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-(2-PIRIDINILMETIL)-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA

ETAPA A: PREPARAÇÃO DE 4-BROMO-1-NAFTALENOCARBOXILATO OXIMA

[0145] A solução agitada de 4-bromo-1-naftalenocarboxaldeído (3,7 g, 15,7 mmol) em etanol (30 ml), adicionou-se solução aquosa de hidroxilamina (1,25 ml, 50% em água). Após agitação à temperatura ambiente

por três horas, a mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida para gerar o composto título na forma de sólido amarelo claro (3,8 g).

[0146] NMR ^1H (DMSO- d_6) 11,60 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,71 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,74 (m, 3H).

ETAPA B: PREPARAÇÃO DE 3-(4-BROMO-1-NAFTALENIL)-5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)ISOXAZOL

[0147] A solução agitada de 4-bromo-1-naftalenocarboxilato oxima (ou seja, o produto da Etapa A) (2,33 g, 9,3 mmol) em *N, N*-dimetilformamida (6,0 ml), adicionou-se *N*-clorossuccinimida (1,70 g, 12,7 mmol). A mistura de reação foi agitada por uma hora à temperatura ambiente e, em seguida, adicionou-se solução de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benzeno (ou seja, o produto da Etapa B do Exemplo 1) (2,70 g, 11,2 mmol) e adicionou-se trietilamina (4,5 ml, 32,0 mmol) em *N, N*-dimetilformamida (9,0 ml). Após agitação por duas horas adicionais à temperatura ambiente, a mistura de reação foi diluída com água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com salmoura, seca (Na_2SO_4) e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia de coluna de sílica gel utilizando hexanos e acetato de etila como eluente para gerar o composto título na forma de sólido branco (2,9 g, rendimento de 64%).

[0148] NMR ^1H (CDCl_3): 8,87 (m, 1H), 8,32 (m, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,66 (m, 2H), 7,55 (s, 2H), 7,46 (dd, 1H), 7,32 (d, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 3H).

ETAPA C: PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-*N*-(2-PIRIDINILMETIL)-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA

[0149] Mistura de 3-(4-bromo-1-naftalenil)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil) isoxazol (ou seja, o produto da Etapa B) (1,0 g, 2,04 mmol), [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaládio (II) ($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$) (0,22 g, 0,30 mmol), 2-(aminometil)piridina (0,86 g, 7,96 mmol) e trietilamina (5,6 ml, 40 mmol) em tolueno (15 ml) foi purgada com monóxido de carbono por quinze

minutos. Em seguida, a ampola de reação foi mantida com monóxido de carbono utilizando balão. A mistura de reação foi agitada a 70 °C sob atmosfera de monóxido de carbono por uma noite. A mistura foi resfriada à temperatura ambiente, filtrada através de almofada curta de auxiliar de filtragem diatomáceo Celite® e enxaguada com pequena quantidade de acetato de etila. O filtrado foi concentrado e o resíduo foi purificado por meio de cromatografia de coluna sobre sílica gel utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para fornecer o composto título, composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido branco (0,72 g, rendimento de 65%).

[0150] NMR ¹H (CDCl₃) δ 8,81 (d, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 7,80-7,27 (m, 10H), 4,89 (d, 2H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).

EXEMPLO 3

PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-(2-PIRIDINILMETIL)-1-NAFTALENOCARBOTIOAMIDA

[0151] Mistura de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-1-naftalenocarboxamida (ou seja, o produto do Exemplo 2) (40 mg, 0,073 mmol) e 2,5-bis (4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano-2,4-dissulfeto (reagente de Lawesson) (18 mg, 0,044 mmol) em tolueno (2 ml) foi aquecida sob refluxo por duas horas. A mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente e purificada diretamente por meio de cromatografia de coluna de sílica gel utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para fornecer o produto título, composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido amarelo (29 mg, rendimento de 71%).

[0152] NMR ¹H (CDCl₃) δ 9,41 (br s, 1H), 8,91 (dd, 1H), 8,70 (dd, 1H), 8,46 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,75 (dt, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,47 (dd, 1H), 7,43 (t, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 5,14 (d, 2H), 4,68 (d, 1H), 4,39 (d, 1H).

EXEMPLO 4

PREPARAÇÃO DE 5-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-

ISOXAZOLIL]-N-(2-PIRIDINILMETIL)-8-QUINOLINOCARBOXAMIDA**ETAPA A: PREPARAÇÃO DE ACETATO DE (8-BROMO-5-QUINOLINIL)METILA**

[0153] Mistura de 8-bromo-5-metilquinolina (5,4 g, 24,3 mmol), *N*-bromossuccinimida (5,2 g, 29,2 mmol) e 2,2'-azobis(2-metilpropionitrila) (AIBN) (0,40 g, 24,3 mmol) em tetracloreto de carbono (80 ml) foi aquecida sob refluxo por três horas sob atmosfera de nitrogênio. A mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente e filtrada, utilizando hexano para enxágüe. O filtrado foi concentrado sob pressão reduzida. O resíduo foi dissolvido em *N,N*-dimetilformamida (50 ml) e, em seguida, adicionou-se acetato de sódio (4,0 g, 48,8 mmol). A mistura resultante foi agitada a 100 °C por duas horas sob atmosfera de nitrogênio. A mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente, diluída com água e extraída com mistura de acetato de etila e hexano (3:7). A camada orgânica foi lavada com salmoura, seca (Na₂SO₄) e concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto foi purificado por meio de cromatografia de coluna sobre sílica gel utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para gerar o produto título na forma de sólido amarelo claro (4,8 g).

ETAPA B: PREPARAÇÃO DE 8-BROMO-5-QUINOLINOCARBOXALDEÍDO

[0154] Mistura do acetato de (8-bromo-5-quinolinil)metila (ou seja, o produto da Etapa A) e metanol (50 ml) foi aquecida sob refluxo por uma hora na presença de quantidade de traço de carbonato de potássio (10 mg). Em seguida, a mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente e concentrada sob pressão reduzida para fornecer o álcool correspondente em rendimento quantitativo na forma de sólido amarelo claro.

[0155] A solução agitada do álcool bruto (2,0 g, 8,3 mmol) em diclorometano (60 ml), adicionou-se lentamente 1,1,1-tris(acetóxi)-1,1-di-hidro-1,2-benziodoxol-3 (1*H*)-ona (periodinano de Dess-Martin) (4,0 g, 9,4 mmol) à temperatura ambiente. Após agitação por meia hora, a mistura de reação foi diluída com diclorometano, lavada com bicarbonato de sódio aquoso saturado e

salmoura, seca (Na_2SO_4) e concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto foi purificado por meio de cromatografia de coluna sobre sílica gel utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para gerar o produto título na forma de sólido branco (1,8 g).

[0156] NMR ^1H (CDCl_3) δ 10,31 (s, 1H), 9,65 (dd, 1H), 9,12 (dd, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,66 (dd, 1H).

ETAPA C: PREPARAÇÃO DE 8-BROMO-5-QUINOLINOCARBOXALDEÍDO OXIMA.

[0157] A solução agitada de 8-bromo-5-quinolinocarboxaldeído (ou seja, o produto da Etapa B) (1,7 g, 7,1 mmol) em etanol (30 ml), adicionou-se solução aquosa de hidroxilamina (0,7 ml, 50% em água). Após agitação à temperatura ambiente por duas horas, a mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida para fornecer o composto título na forma de sólido amarelo claro (1,8 g).

[0158] NMR ^1H ($\text{DMSO}-d_6$): δ 11,61 (s, 1H), 9,16 (dd, 1H), 9,07 (dd, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,72 (dd, 1H).

ETAPA D: PREPARAÇÃO DE 8-BROMO-5-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]QUINOLINA

[0159] A solução agitada de 8-bromo-5-quinolinocarboxaldeído oxima (ou seja, o produto da Etapa C) (1,7 g, 6,8 mmol) em *N, N*-dimetilformamida (13,0 mmol), adicionou-se *N*-clorossuccinimida (1,24 g, 9,3 mmol). A mistura de reação foi agitada por uma hora à temperatura ambiente e adicionou-se em seguida solução de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benzeno (ou seja, o produto do Exemplo 1, Etapa B) (1,96 g, 8,1 mmol) e trietilamina (2,86 ml, 20,4 mmol) em *N, N*-dimetilformamida (7,0 ml). Após agitação por doze horas adicionais à temperatura ambiente, a mistura de reação foi diluída com água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com salmoura, seca (Na_2SO_4) e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia de coluna sobre sílica gel

utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para gerar o composto título na forma de sólido branco (2,0 g, rendimento de 61%).

[0160] NMR ^1H (CDCl_3): δ 9,39 (dd, 1H), 9,08 (dd, 1H), 8,05 (d, 1H), 7,59 (dd, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,44 (t, 1H), 7,40 (d, 1H), 4,27 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).

ETAPA E: PREPARAÇÃO DE 5-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-(2-PIRIDINILMETIL)-8-QUINOLINOCARBOXAMIDA

[0161] Mistura de 8-bromo-5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]quinolina (ou seja, o produto da Etapa D) (500 mg, 1,0 mmol), [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaládio (II) ($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$) (75 mg, 0,10 mmol), 2-(aminometil)piridina (0,43 ml, 4,0 mmol) e trietilamina (2,8 ml, 20 mmol) em tolueno (10 ml) foi purgada com monóxido de carbono por quinze minutos. Em seguida, a ampola de reação foi mantida com monóxido de carbono utilizando balão. A mistura de reação foi agitada a 70 °C sob atmosfera de monóxido de carbono por uma noite. A mistura foi resfriada à temperatura ambiente, filtrada através de almofada curta de auxiliar de filtragem diatomácea Celite® e enxaguada com pequena quantidade de acetato de etila. O filtrado foi concentrado e o resíduo foi purificado por meio de cromatografia de coluna sobre sílica gel utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para fornecer o produto título, composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido em forma de espuma marrom (60 mg, rendimento de 11%).

[0162] NMR ^1H (CDCl_3): 12,02 (br s, 1H), 9,52 (d, 1H), 9,01 (s, 1H), 8,88 (d, 1H), 8,62 (d, 1H), 7,60-7,74 (m, 3H), 7,56 (s, 2H), 7,45 (br s, 2H), 7,20 (dd, 1H), 4,96 (d, 2H), 4,32 (d, 1H), 3,98 (d, 1H).

EXEMPLO 5

PREPARAÇÃO DE 5-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-(2-PIRIDINILMETIL)-8-ISOQUINOLINOCARBOXAMIDA

ETAPA A: PREPARAÇÃO DE 8-BROMO-5-ISOQUINOLINOCARBOXALDEÍDO E 5-BROMO-8-ISOQUINOLINOCARBOXALDEÍDO

[0163] A mistura agitada de 5,8-dibromoisoquinolina (4,0 g, 13,9 mmol) em tetraidrofuran (120 ml) a -78 °C sob atmosfera de nitrogênio, adicionou-se em gotas solução de *n*-butil lítio (2,3 M em hexano, 7,3 ml, 16,8 mmol). A mistura de reação tornou-se escura. Após agitação por quinze minutos, a mistura de reação foi resfriada por meio de adição de *N, N*-dimetilformamida (4,0 ml). Após agitação a -78 °C por uma hora adicional, a mistura de reação foi resfriada com água, extraída com mistura de acetato de etila/hexano (2:8), lavada com água e salmoura, seca (Na₂SO₄) e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia de coluna sobre sílica gel utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para gerar o 8-bromo-5-isoquinolinocarboxaldeído (0,10 g), seguido por 5-bromo-8-isoquinolinocarboxaldeído (1,0 g) na forma de sólidos brancos.

[0164] NMR ¹H (CDCl₃) de 8-bromo-5-isoquinolinocarboxaldeído: 10,36 (s, 1H), 9,72 (s, 1H), 9,00 (d, 1H), 8,79 (d, 1H), 8,04 (d, 1H), 8,01 (dd, 1H); e

[0165] NMR ¹H (CDCl₃) de 5-bromo-8-isoquinolinocarboxaldeído: 10,57 (s, 1H), 10,41 (s, 1H), 8,81 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,94 (d, 1H).

ETAPA B: PREPARAÇÃO DE 8-BROMO-5-ISOQUINOLINOCARBOXALDEÍDO OXIMA

[0166] A solução agitada de 8-bromo-5-isoquinolinocarboxaldeído (ou seja, produto da Etapa A) (75 mg, 0,3 mmol) em etanol (7 ml), adicionou-se solução aquosa de hidroxilamina (0,5 ml, 50% em água). Após agitação à temperatura ambiente por uma noite, a mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida para fornecer o composto título na forma de sólido amarelo (70 mg).

[0167] NMR ¹H (DMSO-*d*₆): 11,75 (s, 1H), 9,55 (s, 1H), 8,78 (s, 1H), 8,71 (d, 1H), 8,59 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 7,96 (d, 1H).

ETAPA C: PREPARAÇÃO DE 8-BROMO-5-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]ISOQUINOLINA

[0168] A solução agitada de 8-bromo-5-isoquinolinocarboxaldeído oxima (ou seja, o produto da Etapa B) (70 mg, 0,28 mmol) em *N, N*-dimetilformamida (2,0 ml), adicionou-se *N*-clorossuccinimida (64 g, 0,48 mmol). A mistura de reação foi agitada por meia hora à temperatura ambiente e, em seguida, solução de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benzeno (135 mg, 0,56 mmol) (ou seja, o produto do Exemplo 1, Etapa B) e adicionou-se trietilamina (0,12 ml, 0,86 mmol) em *N, N*-dimetilformamida (1,5 ml). Após agitação por doze horas adicionais à temperatura ambiente, a mistura de reação foi diluída com água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com salmoura, seca (Na_2SO_4) e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia de coluna de sílica gel utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para gerar o composto título (20 mg) contaminado com alguma impureza.

ETAPA D: PREPARAÇÃO DE 5-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-5-(TRIFLUOROMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-*N*-(2-PIRIDINILMETIL)-8-ISOQUINOLINOCARBOXAMIDA

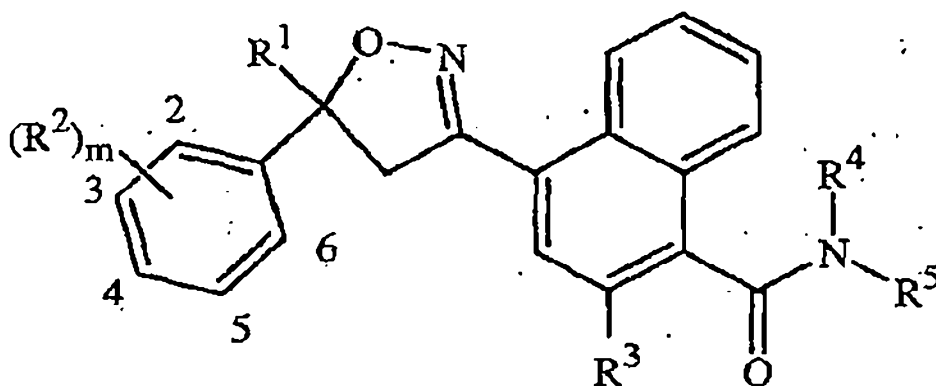
[0169] Mistura de 8-bromo-5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]isoquinolina (ou seja, o produto da Etapa C) (20 mg, 0,04 mmol), [1,1'-bis (difenilfosfino)ferroceno]dicloropaládio (II) ($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$) (6 mg, 0,008 mmol), 2-(aminometil)piridina (17 mg, 0,16 mmol) e trietilamina (0,1 ml, 0,7 mmol) em tolueno (2 ml) foi purgada com monóxido de carbono por quinze minutos. Em seguida, a ampola de reação foi mantida com monóxido de carbono utilizando balão. A mistura de reação foi agitada a 70 °C sob atmosfera de monóxido de carbono por uma noite. A mistura foi resfriada à temperatura ambiente, filtrada através de almofada curta de filtro diatomáceo Celite® e enxaguada com pequena quantidade de acetato de etila. O filtrado foi concentrado e o resíduo foi purificado por meio de cromatografia de coluna sobre sílica gel utilizando hexanos/acetato de etila como eluente para fornecer o

produto título, composto de acordo com a presente invenção, na forma de sólido branco (15 mg).

[0170] NMR ^1H (CDCl_3): 9,77 (s, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,70 (d, 1H), 8,52 (s, 1H), 7,81-7,23 (m, 9H), 4,88 (d, 2H), 4,28 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).

[0171] Por meio dos procedimentos descritos no presente, junto com métodos conhecidos na técnica, podem ser preparados os compostos a seguir das Tabelas 1 a 9. As abreviações a seguir são utilizadas nas Tabelas que se seguem: -CN indica ciano, Ph indica fenila, Py indica piridinila, Me indica metila, Et indica etila e *i*-Pr indica isopropila.

TABELA 1



em que m é 1, 2, 3, 4 ou 5.

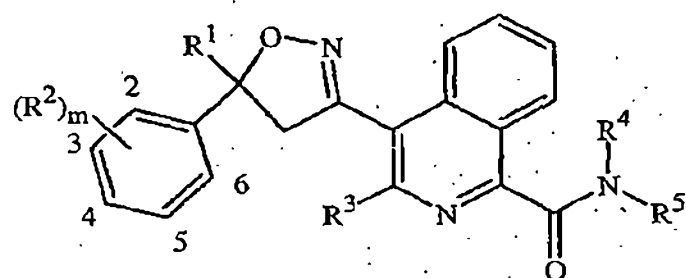
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3

CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br, 4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-I	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-CN	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_2CF_3	4-CN	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	4-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	H	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

TABELA 2

em que m é 1, 2, 3, 4 ou 5.

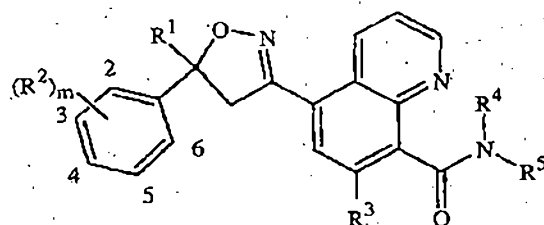
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	3-CN	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CN	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	H	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

TABELA 3



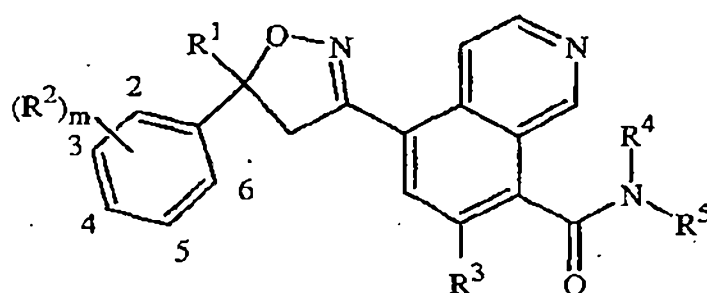
em que m é 1, 2, 3, 4 ou 5.

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	H	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

TABELA 4

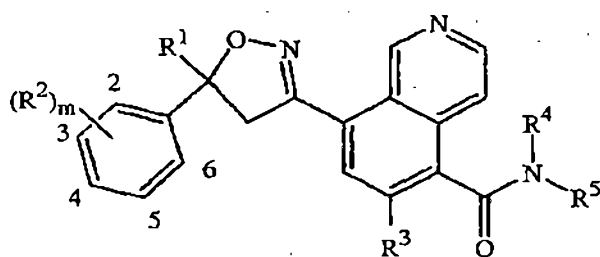
em que m é 1, 2, 3, 4 ou 5.

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

TABELA 5



em que m é 1, 2, 3, 4 ou 5.

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py

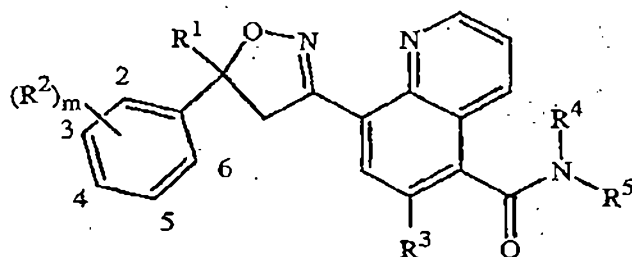
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

TABELA 6



em que m é 1, 2, 3, 4 ou 5.

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py

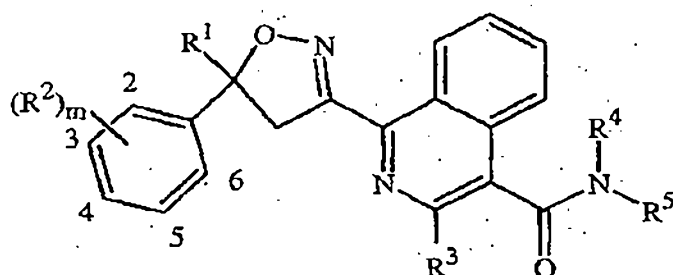
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

TABELA 7



em que m é 1, 2, 3, 4 ou 5.

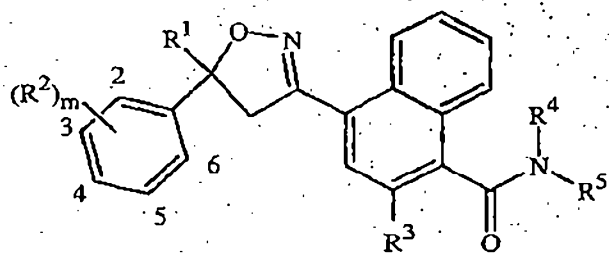
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

TABELA 8



em que m é 1, 2, 3, 4 ou 5.

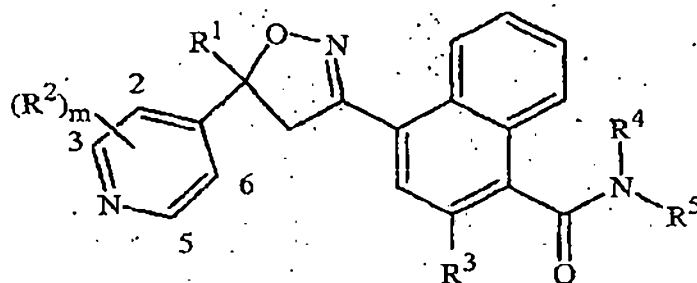
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	Et	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	i-Pr	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	i-Pr
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	Et	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	i-Pr	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	i-Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	CO_2Me	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	CO_2Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH_2-2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	CO_2Me	CH_2-2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	CO_2Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2-2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	H	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Me	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Et	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2Ph	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2Ph
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CO_2Me	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CO_2Me
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CN	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CN
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-2-thiazolyl$	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-2-thiazolyl$
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-4-thiazolyl$	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-4-thiazolyl$
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-5-thiazolyl$	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-5-thiazolyl$
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-3-Py	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2-3-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-4-Py	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2-4-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	CO_2Me	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	CO_2Me	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH_2-2-Py	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	CO_2Me	CH_2-2-Py	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	CO_2Me	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2-2-Py	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	H	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Me	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Et	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2Ph	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2Ph
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CO_2Me	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CO_2Me
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CN	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CN
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-2-thiazolyl$	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-2-thiazolyl$
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-4-thiazolyl$	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-4-thiazolyl$
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-5-thiazolyl$	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-5-thiazolyl$
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-3-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2-3-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-4-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2-4-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	CO_2Me	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	CO_2Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH_2-2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	CO_2Me	CH_2-2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	CO_2Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2-2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2-2-Py

Na tabela acima:

onde está escrito "thiazolyl", lê-se "tiazolila".

TABELA 9



em que m é 1, 2, 3 ou 4.

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF ₃	3-Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF ₃	3-Cl	H	H	Et	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF ₃	3-Cl	H	H	i-Pr	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	i-Pr
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	Et	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2Ph	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2Ph
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2CO_2Me	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CO_2Me
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2CN	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CN
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2 -2-thiazolyl	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-thiazolyl
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2 -4-thiazolyl	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -4-thiazolyl
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2 -5-thiazolyl	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -5-thiazolyl
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2 -3-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -3-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2 -4-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -4-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	Me	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	CO_2Me	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	CO_2Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	Me	CH_2 -2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	CO_2Me	CH_2 -2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	CO_2Me	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2 -2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	H	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF_3	3-Cl	Me	H	Me	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF_3	3-Cl	Me	H	Et	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF_3	3-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2Ph	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2Ph
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CO_2Me	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CO_2Me
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CN	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CN
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-thiazolyl	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-thiazolyl
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -4-thiazolyl	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -4-thiazolyl
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -5-thiazolyl	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -5-thiazolyl
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -3-Py	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -3-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -4-Py	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -4-Py
CF_3	3-Cl	Me	Me	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl	Me	CO_2Me	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	CO_2Me	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2CF_3

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	Et	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -5-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -5-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	3- OCF_3	Me	H	CH_2 -2-Py	CF_3	3- OCF_3	Cl	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	H	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-I	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-CN	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_2CF_3	3- OCF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3- OCF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	H	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- OCF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- OCF_3	Me	H	CH_2 -2-Py

Na tabela acima:

onde está escrito "thiazolyl", lê-se "tiazolil".

FORMULAÇÃO / UTILIDADE

[0172] Os compostos de acordo com a presente invenção serão geralmente utilizados como formulação ou composição com veículo apropriado

que compreende pelo menos um dentre diluente líquido, diluente sólido ou tensoativo. Os ingredientes da formulação ou composição são selecionados de forma a serem consistentes com as propriedades físicas do ingrediente ativo, modo de aplicação e fatores ambientais, tais como tipo de solo, umidade e temperatura. As formulações úteis incluem líquidos, tais como soluções (incluindo concentrados emulsionáveis), suspensões, emulsões (incluindo microemulsões e/ou suspo-emulsões) e similares, que podem ser opcionalmente espessados na forma de géis. Formulações úteis incluem adicionalmente sólidos tais como poeiras, pós, grânulos, pelotas, pílulas, pastilhas, tabletes, filmes (incluindo revestimentos de sementes) e similares, que podem ser dispersíveis em água (“molháveis”) ou hidrossolúveis. O ingrediente ativo pode ser (micro)encapsulado e adicionalmente moldado em forma de suspensão ou formulação sólida; alternativamente, toda a formulação de ingrediente ativo pode ser encapsulada (ou “sobrerrevestida”). A encapsulação pode controlar ou retardar a liberação do ingrediente ativo. Formulações pulverizáveis podem ser estendidas em meios apropriados e utilizadas em volumes de pulverização de cerca de um a várias centenas de litros por hectare. Composições com alta resistência são principalmente utilizadas como intermediários para formulação adicional.

[0173] As formulações conterão tipicamente quantidades eficazes de ingrediente ativo, diluente e tensoativo dentro das faixas aproximadas a seguir, que somam 100% em peso.

	Percentual em peso		
	Ingrediente ativo	Diluente	Tensoativo
Pós, pastilhas e grânulos dispersíveis em água e hidrossolúveis	0,001 - 90	0 - 99,999	0 - 15

Percentual em peso			
	Ingrediente ativo	Diluyente	
		Tensoativo	
Suspensões, emulsões, soluções, dispersões em óleo (incluindo concentrados emulsionáveis)	1 - 50	40 - 99	0 - 50
Poeiras	1 - 25	70 - 99	0 - 5
Grânulos e pelotas	0,001 - 99	5 - 99,99	0 - 15
Composições de alta resistência	90 - 99	0 - 10	0 - 2

[0174] Diluentes sólidos típicos são descritos em Watkins *et al*, *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, segunda edição, Dorland Books, Caldwell, Nova Jérsei. Diluentes líquidos típicos são descritos em Marsden, *Solvents Guide*, segunda edição, Interscience, Nova Iorque, 1950. *McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual*, Allured Publ. Corp., Ridgewood, Nova Jérsei, bem como Sisely e Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., Nova Iorque, 1964, relaciona tensoativos e usos recomendados. Todas as formulações podem conter pequenas quantidades de aditivos para reduzir a espuma, aglomeração, corrosão, crescimento microbiológico e similares, ou espessantes para aumentar a viscosidade.

[0175] Tensoativos incluem, por exemplo, alcoóis polietoxilados, alquilfenóis polietoxilados, ésteres de ácidos graxos de sorbitan polietoxilados, sulfossuccinatos de dialquila, sulfatos de alquila, sulfonatos de alquilbenzeno, organossilicones, tauratos de *N*, *N*-dialquila, sulfonatos de lignina, condensados de formaldeído sulfonato de naftaleno, policarboxilatos, glicerol ésteres, copolímeros de bloco de polioxietileno e polioxipropileno e alquilpoliglicosídeos, em que o número de unidades de glicose, denominado grau de polimerização (DP), pode variar de 1 a 3 e as unidades alquila podem variar de C₆ a C₁₄ (vide

Pure and Applied Chemistry 72, 1255-1264). Os diluentes sólidos incluem, por exemplo, argilas tais como bentonita, montmorilonita, atapulgita e caulim, amido, açúcar, sílica, talco, terra diatomácea, uréia, carbonato de cálcio, carbonato e bicarbonato de sódio e sulfato de sódio. Diluentes líquidos incluem, por exemplo, água, *N*, *N*-dimetilformamida, sulfóxido de dimetila, *N*-alquilpirrolidona, etileno glicol, polipropileno glicol, carbonato de propileno, ésteres dibásicos, parafinas, alquilbenzenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetina, óleos de oliva, mamona, linhaça, tungue, gergelim, milho, amendoim, semente de algodão, soja, colza e coco, ésteres de ácidos graxos, cetonas tais como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona e 4-hidróxi-4-metil-2-pentanona; acetatos, tais como acetato de hexila, acetato de heptila e acetato de octila, e alcoóis tais como metanol, ciclohexanol, decanol, álcool benzílico e tetraidrofurfurílico.

[0176] Formulações úteis de acordo com a presente invenção podem também conter materiais bem conhecidos dos técnicos no assunto como auxiliares de formulação tais como antiespumantes, formadores de filme e tinturas. Antiespumantes podem incluir líquidos dispersíveis em água que compreendem poliorganossiloxanos como Rhodorsil® 416. Os formadores de filme podem incluir acetatos de polivinila, copolímeros de acetato de polivinila, copolímero de polivinilpirrolidona e acetato de vinila, alcoóis polivinílicos, copolímeros de álcool polivinílico e ceras. Tinturas podem incluir composições corantes líquidas dispersíveis em água tais como Corante Vermelho Pro-Ized®. Os técnicos no assunto apreciarão que esta é uma lista não exaustiva de auxiliares de formulação. Exemplos apropriados de auxiliares de formulação incluem os relacionados no presente e os listados em *McCutcheon's* 2001, Volume 2: *Functional Materials*, publicado pela MC Publishing Company, e Publicação PCT nº WO 03/024222.

[0177] Soluções, que incluem concentrados emulsionáveis, podem ser preparadas por meio de simples mistura dos ingredientes. Poeiras e pós

podem ser preparados por meio de mistura e, normalmente, moagem tal como em moinho martelo ou moinho de energia fluida. Suspensões normalmente são preparadas por meio de moagem úmida; vide, por exemplo, US 3.060.084. Grânulos e pelotas podem ser preparados por meio de pulverização do material ativo sobre veículos granulares previamente formados ou por métodos de aglomeração. Vide Browning, *Agglomeration, Chemical Engineering*, quatro de dezembro de 1967, págs. 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, quarta edição, McGraw-Hill, Nova Iorque, 1963, págs. 8-57 e seguintes, e WO 91/13546. Pelotas podem ser preparadas conforme descrito em US 4.172.714. Grânulos dispersíveis em água e hidrossolúveis podem ser preparados conforme ensinado em US 4.144.050, US 3.920.442 e DE 3.246.493. Pastilhas podem ser preparadas conforme ensinado em US 5.180.587, US 5.232.701 e US 5.208.030. Filmes podem ser preparados conforme ensinado em GB 2.095.558 e US 3.299.566.

[0178] Para informações adicionais referentes à técnica de formulação, vide T. S. Woods, *The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture* em *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks e T. R. Roberts, Eds., Anais do Nono Congresso Internacional sobre Química de Pesticidas, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, págs. 120-133. Vide também US 3.235.361, col. 6, linha 16 até col. 7, linha 19 e Exemplos 10 a 41; US 3.309.192, col. 5, linha 43 até col. 7, linha 62 e Exemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 e 169-182; US 2.891.855, col. 3, linha 66 até col. 5, linha 17 e Exemplos 1 a 4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., Nova Iorque, 1961, págs. 81-96; Hance *et al*, *Weed Control Handbook*, oitava edição, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; e *Developments in Formulation Technology*, PJB Publications, Richmond, Grã-Bretanha, 2000.

[0179] Nos Exemplos a seguir, todos os percentuais são em peso e todas as formulações são preparadas de formas convencionais. Os números dos compostos referem-se aos compostos nas Tabelas Índice A a C. Sem elaboração adicional, acredita-se que os técnicos no assunto, utilizando o relatório descritivo acima, possam utilizar a presente invenção até o máximo possível. Os Exemplos a seguir devem ser compreendidos, portanto, como meramente ilustrativos e não limitadores do relatório descritivo de nenhuma forma. Os percentuais são em peso, exceto quando indicado em contrário.

EXEMPLO A

Pó molhável

Composto 1	65,0%
Dodecilfenol polietileno glicol éter	2,0%
Ligninossulfonato de sódio	4,0%
Silicoaluminato de sódio	6,0%
Montmorilonita (calcinação)	23,0%

EXEMPLO B

Grânulos

Composto 2	10,0%
Grânulos de atapulgita (material de baixa volatilidade, 0,71/0,30 mm; peneiras USS n° 25-50)	90,0%

EXEMPLO C

Pelotas extrudadas

Composto 8	25,0%
Sulfato de sódio anidro	10,0%
Ligninossulfonato de cálcio bruto	5,0%
Alquilnaftalenossulfonato de sódio	1,0%
Bentonita de magnésio/cálcio	59,0%

EXEMPLO D**Concentrado emulsionável**

Composto 20	20,0%
Mistura de sulfonatos solúveis em óleo e polioxietileno éteres	10,0%
Isoforona	70,0%

EXEMPLO E**Microemulsão**

Composto 21	5,0%
Copolímero de polivinilpirrolidona-vinil acetato	30,0%
Alquilpoliglicosídeo	30,0%
Monooleato de glicerila	15,0%
Água	20,0%

EXEMPLO F**Tratamento de sementes**

Composto 101	20,00%
Copolímero de polivinilpirrolidona-vinil acetato	5,00%
Cera de ácido montana	5,00%
Ligninossulfonato de cálcio	1,00%
Copolímeros de bloco de polioxietileno/ polioxipropileno	1,00%
Álcool estearílico (POE 20)	2,00%
Poliorganossilano	0,20%
Tintura vermelha corante	0,05%
Água	65,75%

EXEMPLO G**Bastão fertilizante**

Composto 201	2,50%
--------------	-------

Copolímero de pirrolidona e estireno	4,80%
16-Etoxilato de triestirilfenila	2,30%
Talco	0,80%
Amido de milho	5,00%
Fertilizante de liberação prolongada Nitrophoska®	36,00%
Permanente 15-9-15 (BASF)	
Caulim	38,00%
Água	10,60%

[0180] Os compostos de acordo com a presente invenção exibem atividade contra amplo espectro de pragas invertebradas. Essas pragas incluem invertebrados que habitam uma série de ambientes, tais como folhagem de plantas, raízes, solo, safras colhidas ou outros alimentos, estruturas de construção ou tegumentos animais. Essas pragas incluem, por exemplo, alimentação de invertebrados sobre folhagem (incluindo folhas, hastes, flores e frutas), sementes, madeira, fibras têxteis ou sangue ou tecidos animais, de forma a causar lesões ou danos, por exemplo, a safras agrônômicas em crescimento ou armazenadas, florestas, safras de estufa, plantas ornamentais, safras de viveiros, alimentos ou produtos de fibra armazenados ou casas ou outras estruturas ou seus conteúdos, ou ser prejudiciais à saúde animal ou saúde pública. Os técnicos no assunto apreciarão que nem todos os compostos são igualmente eficazes contra todos os estágios de crescimento de todas as pragas.

[0181] Os compostos e composições do presente são, portanto, úteis agronomicamente para a proteção de safras de campo contra pragas invertebradas fitófagas, bem como não agronomicamente para a proteção de outras safras hortícolas e plantas contra pragas invertebradas fitófagas. Esta utilidade inclui a proteção de safras e outras plantas (ou seja, agrônômicas e não agrônômicas) que contenham material genético introduzido por meio de engenharia genética (ou seja, transgênicas) ou modificadas por meio de

mutagênese para fornecer características vantajosas. Exemplos dessas características incluem tolerância a herbicidas, resistência a pragas fitófagas (tais como insetos, ácaros, afídeos, aranhas, nematóides, caracóis, fungos patogênicos de plantas, bactérias e vírus), crescimento vegetal aprimorado, maior tolerância a condições de cultivo adversas tais como temperaturas altas ou baixas, umidade do solo baixa ou alta e alta salinidade, aumento da formação de flores ou frutos, maiores rendimentos de colheita, maturação mais rápida, melhor qualidade e/ou valor nutricional do produto colhido ou melhores propriedades de processo ou armazenagem dos produtos colhidos. As plantas transgênicas podem ser modificadas para expressar diversas características. Exemplos de plantas que possuem características fornecidas por meio de engenharia genética ou mutagênese incluem variedades de milho, algodão, soja e batata que expressam toxina de *Bacillus thuringiensis* inseticida tais como YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® e NEWLEAF® e variedades tolerantes a herbicidas de milho, algodão, soja e colza, tais como ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® e CLEARFIELD®, bem como safras que expressam N-acetiltransferase (GAT) para fornecer resistência a herbicida glifosato, ou safras que contêm o gene HRA que fornece resistência a herbicidas que inibem acetolactato sintase (ALS). Os compostos e composições do presente podem interagir de forma sinérgica com características introduzidas por meio de engenharia genética ou modificadas por meio de mutagênese, de forma a aumentar a expressão fenotípica ou eficácia das características ou aumento da eficácia do controle de pragas invertebradas dos compostos e composições do presente. Particularmente, os compostos e composições do presente podem interagir sinergicamente com a expressão fenotípica de proteínas ou outros produtos naturais tóxicos para pragas invertebradas para fornecer controle maior que aditivo dessas pragas.

[0182] Usos não agronômicos indicam controle de pragas invertebradas nas áreas diferentes de campos de plantas de safra. Os usos não agronômicos dos compostos e composições do presente incluem o controle de pragas invertebradas em grãos, cereais e outros alimentos armazenados e em produtos têxteis tais como roupas e tapetes. Usos não agronômicos dos compostos e composições do presente também incluem o controle de pragas invertebradas em plantas ornamentais, florestas, jardins, ao longo de acostamentos de rodovias e direitos de tráfego de ferrovias e sobre gramados, tais como campos de grama, campos de golfe e pastagens. Os usos não agronômicos dos compostos e composições do presente também incluem o controle de pragas invertebradas em casas e outras construções que podem ser ocupadas por seres humanos e/ou animais de companhia, fazenda, rancho, zoológico ou outros. Os usos não agronômicos dos compostos e composições do presente também incluem o controle de pragas tais como cupins que podem danificar madeira ou outros materiais estruturais utilizados em construções.

[0183] Os usos não agronômicos dos compostos e composições do presente também incluem a proteção da saúde humana e animal por meio do controle de pragas invertebradas que são parasitas ou transmitem doenças infecciosas. O controle de parasitas animais inclui o controle de parasitas externos que são parasíticos para a superfície do corpo do animal hospedeiro (tal como ombros, axilas, abdômen, parte interna das coxas) e parasitas internos que são parasíticos para o lado interno do corpo do animal hospedeiro (tal como estômago, intestino, pulmão, veias, sob a pele, tecido linfático). Pragas transmissoras de doenças ou parasíticas externas incluem, por exemplo, chiques, carrapatos, piolhos, mosquitos, moscas, ácaros e pulgas. Parasitas internos incluem vermes do coração, ancilóstomos e helmíntios. Compostos e composições de acordo com a presente invenção são apropriados para controle sistêmico e/ou não sistêmico de infestações ou infecções por parasitas sobre

animais. Compostos e composições de acordo com a presente invenção são apropriados para o combate a pragas parasíticas ou transmissoras de doenças externas. Os compostos e composições de acordo com a presente invenção são apropriados para o combate a parasitas que infestam animais de trabalho agrícola, tais como bois, carneiros, cabras, cavalos, porcos, burros, camelos, búfalos, coelhos, galinhas, perus, patos, gansos e abelhas; animais domésticos e animais de estimação, tais como cães, gatos, pássaros de estimação e peixes de aquário; bem como os chamados animais experimentais, tais como hamsters, cobaias, ratos e camundongos. Combatendo estes parasitas, as fatalidades e a redução do desempenho (em termos de carne, leite, lã, pele, ovos, mel etc.) são reduzidas, de forma que a aplicação de composição que compreende composto de acordo com a presente invenção permite acasalamento de animais mais simples e econômico.

[0184] Exemplos de pragas invertebradas agronômicas ou não agronômicas incluem ovos, larvas e adultos da ordem dos lepidópteros, tais como lagartas dos cereais, gramiolas, larvas das geometrídeas e heliotinas da família dos noctuídeos (por exemplo, broca rosa das hastes (*Sesamia inferens*, Walker), broca das hastes do milho (*Sesamia nonagrioides*, Lefebvre), lagarta do sul (*Spodoptera eridania*, Cramer), lagarta dos cereais do outono (*Spodoptera fugiperda*, J. E. Smith), lagarta da beterraba (*Spodoptera exigua*, Hübner), lagarta das folhas do algodão (*Spodoptera littoralis*, Boisduval), lagarta de listas amarelas (*Spodoptera ornithogalli*, Guenée), lagarta negra dos cereais (*Agrotis ipsilon*, Hufnagel), grilo dos grãos de veludo (*Anticarsia gemmatilis*, Hübner), verme das frutas verdes (*Lithophane antennata*, Walker), lagarta do repolho (*Barathra brassicae*, Linnaeus), gramiola da soja (*Pseudoplusia includens*, Walker), gramiola do repolho (*Trichoplusia ni*, Hübner), larva dos botões de fumo (*Heliothis virescens*, Fabricius)); brocas, besouros, vermes de teias, vermes das coníferas, vermes do repolho e insetos carniceiros da família dos piralídeos (por

exemplo, broca do milho européia (*Ostrinia nubilalis*, Hübner), verme da laranja de umbigo (*Amyelois transitella*, Walker), verme de teias da raiz do milho (*Crambus caliginosellus*, Clemens), vermes das teias dos gramados (piralídeos: *Crambinae*), tais como verme dos gramados (*Herpetogramma licarsisalis*, Walker)), broca da haste da cana de açúcar (*Chilo infuscatellus*, Snellen), broca pequena do tomate (*Neoleucinodes elegantalis*, Guenée), cigarreiro verde (*Cnaphalocerus medinalis*), traça da uva (*Desmia funeralis*, Hübner), verme do melão (*Diaphania nitidalis*), lagarta do centro do repolho (*Helluala hydralis*, Guenée), broca das hastes amarela (*Scirpophaga incertulas*, Walker), broca dos brotos precoces (*Scirpophaga infuscatellus*, Snellen), broca das hastes branca (*Scirpophaga innotata*, Walker), broca dos brotos superiores (*Scirpophaga nivella*, Fabricius), broca do arroz de cabeça preta (*Chilo polychrysus*, Meyrick), grilo do cacho de repolho (*Crocitolomia binotalis*, English)); vermes das folhas, vermes dos botões, vermes das sementes e vermes das frutas da família dos tortricídeos (por exemplo, traça pequena (*Cydia pomonella*, Linnaeus), traça das uvas (*Endopiza viteana*, Clemens), traça das frutas oriental (*Grapholita molesta*, Busck), traça da maçã falsa dos cítricos (*Cryptophlebia leucotreta*, Meyrick), broca dos cítricos (*Ecdytolopha aurantiana*, Lima), traça de faixas vermelhas (*Argyrotaenia velutinana*, Walker), traça de faixas oblíquas (*Choristoneura rosaceana*, Harris), traça das maçãs marrom pequena (*Epiphyas postvittana*, Walker), traça das uvas européia (*Eupoecilia ambiguella*, Hübner), traça dos botões da maçã (*Pandemis pyrusana*, Kearfott), traça onívora (*Platynota stultana*, Walsingham), traça das árvores frutíferas listrada (*Pandemis cerasana*, Hübner), traça marrom das maçãs (*Pandemis heparana*, Denis & Schiffermüller)); e muitos outros lepidópteros economicamente importantes (por exemplo, traça das crucíferas (*Plutella xylostella*, Linnaeus), lagarta rosa do algodão (*Pectinophora gossypiella*, Saunders), ocnéria (*Lymantria dispar*, Linnaeus), broca das frutas de pêssgo (*Carposina niponensis*, Walsingham),

broca dos ramos de pêssgo (*Anarsia lineatella*, Zeller), larva dos tubérculos da batata (*Phthorimae operculella*, Zeller), lagarta teniforme manchada (*Lithocolletis blancardella*, Fabricius), lagarta das maçãs asiática (*Lithocolletis ringoniella*, Matsumura), cigarreiro do arroz (*Lerodea eufala*, Edwards), lagarta das maçãs (*Leucoptera scitella*, Zeller)); ovos, ninfas e adultos da ordem dos blatódeos, incluindo baratas das famílias dos blatelídeos e dos blatídeos (por exemplo, barata oriental (*Blatta orientalis*, Linnaeus), barata asiática (*Blatella asahinai*, Mizukubo), barata alemã (*Blatella germanica*, Linnaeus), barata de faixas marrons (*Supella longipalpa*, Fabricius), barata americana (*Periplaneta americana*, Linnaeus), barata marrom (*Periplaneta brunnea*, Burmeister), barata da Madeira (*Leucophaea maderae*, Fabricius), barata marrom opaca (*Periplaneta fuliginosa*, Service), barata australiana (*Periplaneta australasiae*, Fabr.), barata lagosta (*Nauphoeta cinerea*, Olivier) e barata mole (*Symploce pallens*, Stephens)); ovos, larvas que se alimentam de folhas, que se alimentam de frutos, que se alimentam de raízes, que se alimentam de sementes e que se alimentam de tecido vesicular e adultos da ordem dos coleópteros, incluindo gorgulhos das famílias dos antribídeos, bruquídeos e curculionídeos (por exemplo, gorgulho do algodão (*Anthonomus grandis*, Boheman), gorgulho d'água do arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus*, Kuschel), gorgulho dos cereais (*Sitophilus granarius*, Linnaeus), gorgulho do arroz (*Sitophilus oryzae*, Linnaeus)); gorgulho da grama azul anual (*Lissonotus maculicollis*, Dietz), gorgulho da grama azul (*Sphenophorus parvulus*, Gyllenhal), gorgulho caçador (*Sphenophorus venatus vestitus*), gorgulho de Denver (*Sphenophorus cicatristriatus*, Fahraeus)); besouros pulga, besouros dos pepinos, larvas das raízes, besouros das folhas, besouros das batatas e lagartas das folhas da família dos crisomelídeos (por exemplo, besouro da batata do Colorado (*Leptinotarsa decemlineata*, Say), larvas das raízes de milho do oeste (*Diabrotica virgifera virgifera*, LeConte)); escaravelhos e outros besouros da família dos

escarabeídeos (por exemplo, besouro japonês (*Popillia japonica*, Newman),
 besouro oriental (*Anomala orientalis*, Waterhouse, *Exomala orientalis*
 (Waterhouse), Baraud), escaravelho mascarado do norte (*Cyclocephala*
borealis, Arrow), escaravelho mascarado do sul (*Cyclocephala immaculata*,
 Olivier, ou *C. lurida*, Bland), besouro do esterco e larva branca (*Aphodius* spp),
 larva preta da grama azul (*Ataenius spretulus*, Haldeman), besouro verde de
 junho (*Cotinis nitida*, Linnaeus), besouro do jardim asiático (*Maladera castanea*,
 Arrow), besouros de maio e junho (*Phyllophaga* spp) e escaravelho europeu
 (*Rhizotrogus majalis*, Razoumowsky)); besouros dos tapetes da família dos
 dermestídeos; larvas dos fios da família dos elaterídeos; besouros das cascas
 das árvores da família dos escolitídeos e besouros da farinha, da família dos
 tenebrionídeos. Adicionalmente, as pragas agronômicas e não agronômicas
 incluem: ovos, adultos e larvas da ordem dos dermápteros, incluindo lacraias da
 família dos forficulídeos (por exemplo, lacraias européias (*Forficula auricularia*,
 Linnaeus), lacraias negras (*Chelisoches morio*, Fabricius)); ovos, imaturos,
 adultos e ninfas das ordens dos hemípteros e homópteros, tais como besouros
 das plantas da família dos mirídeos, cigarras da família dos cicadídeos,
 gafanhotos das folhas (por exemplo, *Empoasca* spp.) da família dos
 cicadelídeos, besouros das camas (por exemplo, *Cimex lectularius*, Linnaeus)
 da família dos cimicídeos, gafanhotos das plantas das famílias dos fulgoroídeos
 e delfacídeos, gafanhotos das árvores da família dos membracídeos, psilídeos
 da família dos psilídeos, moscas brancas da família dos aleirodídeos, afídeos da
 família dos afídeos, filoxeras da família dos filoxerídeos, besouros das farinhas
 da família dos pseudococcídeos, mede-palms das famílias dos coccídeos,
 diaspidídeos e margarodídeos, besouros de renda da família dos tingídeos,
 besouros de mau cheiro da família dos pentatomídeos, besouros da cilha (por
 exemplo, besouro peludo da cilha (*Blissus leucopterus hirtus*, Montandon) e
 besouro da cilha do sul (*Blissus insularis*, Barber)) e outros besouros das

sementes da família dos ligeídeos, besouros da saliva da família dos cercopídeos, besouros da abóbora da família dos coreídeos, besouros vermelhos e besouros do algodão da família dos pirrocorídeos. Também são incluídos ovos, larvas, ninfas e adultos da ordem dos ácaros (ácaros), tais como ácaros aranha e ácaros vermelhos da família dos tetraniquídeos (por exemplo, ácaro vermelho europeu (*Panonychus ulmi*, Koch), ácaro aranha de duas manchas (*Tetranychus urticae*, Koch), ácaro de McDaniel (*Tetranychus mcdanieli*, McGregor)), ácaros chatos da família dos tenuipalpídeos (por exemplo, ácaro chato dos cítricos (*Brevipalpus lewisi*, McGregor)), ferrugem e ácaros dos botões da família dos eriofídeos, outros ácaros que se alimentam de folhas e ácaros importantes em saúde humana e animal, ou seja, ácaros da poeira da família dos epidermoptídeos, ácaros de folículos da família dos demodídeos, ácaros dos cereais da família dos glicifagídeos, carrapatos da ordem dos ixodídeos (por exemplo, carrapato dos cervos (*Ixodes scapularis*, Say), carrapato de paralisia australiano (*Ixodes holocyclus*, Neumann), carrapato dos cães americano (*Dermacentor variabilis*, Say), carrapato estrela solitário (*Amblyomma americanum*, Linnaeus)) e ácaros da crosta e de coceira das famílias dos psoroptídeos, piemotídeos e sarcoptídeos; ovos, adultos e imaturos da ordem dos ortópteros, incluindo gafanhotos, locustas e grilos (por exemplo, gafanhotos migratórios (por exemplo, *Melanoplus sanguinipes*, Fabricius, *M. differentialis*, Thomas), gafanhotos americanos (por exemplo, *Schistocerca americana*, Drury), gafanhoto do deserto (*Schistocerca gregaria*, Forskal), gafanhoto migratório (*Locusta migratoria*, Linnaeus), gafanhoto dos arbustos (*Zonocerus* spp), grilo doméstico (*Acheta domesticus*, Linnaeus), grilos-toupeira (tais como grilo toupeira fulvo (*Scapteriscus vicinus*, Scudder) e grilo toupeira do sul (*Scapteriscus borellii*, Giglio-Tos)); ovos, adultos e imaturos da ordem dos dípteros, incluindo lagartas (por exemplo, *Liriomyza* spp como lagarta dos vegetais serpentina (*Liriomyza sativae*, Blanchard)), mosquitos-pólvora, moscas

das frutas (tefrítídeos), moscas das fritas (por exemplo, *Oscinella frit*, Linnaeus), larvas de moscas do solo, moscas domésticas (por exemplo, *Musca domestica*, Linnaeus), moscas domésticas menores (por exemplo, *Fannia canicularis*, Linnaeus, *F. femoralis*, Stein), moscas dos estábulos (por exemplo, *Stomoxys calcitrans*, Linnaeus), moscas do rosto, moscas do chifre, moscas varejeiras (por exemplo, *Chrysomya* spp, *Phormia* spp) e outras pragas moscóides, moscas dos cavalos (por exemplo, *Tabanus* spp), moscas do berne (por exemplo, *Gastrophilus* spp, *Oestrus* spp), lagartas do gado (por exemplo, *Hypoderma* spp), moscas dos cervos (por exemplo, *Chrysops* spp), piolhos (por exemplo, *Melophagus ovinus*, Linnaeus) e outros braquíceros, mosquitos (por exemplo, *Aedes* spp, *Anopheles* spp, *Culex* spp), moscas negras (por exemplo, *Prosimulium* spp, *Simulium* spp), mosquitos-pólvora, moscas da areia, moscas do cogumelo e outros nematóceros; ovos, adultos e imaturos da ordem dos tisanópteros, incluindo tripes da cebola (*Thrips tabaci*, Lindeman), tripes das flores (*Frankliniella* spp) e outros tripes que se alimentam de folhas; insetos pragas da ordem dos himenópteros, incluindo formigas da família dos formicídeos, que incluem a formiga carpinteira da Flórida (*Camponotus floridanus*, Buckley), formiga carpinteira vermelha (*Camponotus ferrugineus*, Fabricius), formiga carpinteira preta (*Camponotus pennsylvanicus*, De Geer), formiga de pés brancos (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), formiga de cabeça grande (*Pheidole* sp), formiga fantasma (*Tapinoma melanocephalum*, Fabricius); formiga faraó (*Monomorium pharaonis*, Linnaeus), formiga-brasa pequena (*Wasmannia auropunctata*, Roger), formiga-brasa (*Solenopsis geminata*, Fabricius), formiga-brasa importada vermelha (*Solenopsis invicta*, Buren), formiga argentina (*Iridomyrmex humilis*, Mayr), formiga louca (*Paratrechina longicornis*, Latreille), formiga dos pavimentos (*Tetramorium caespitum*, Linnaeus), formiga dos campos de milho (*Lasius alienus*, Förster) e formiga doméstica odorífera (*Tapinoma sessile*, Say). Outros himenópteros incluem

abelhas (incluindo abelhas carpinteiras), vespões, vespas americanas, vespas e moscas de serra (*Neodiprion* spp; *Cephus* spp); insetos pragas da ordem dos isópteros, incluindo cupins das famílias dos termicídeos (tais como *Macrotermes* sp, *Odontotermes obesus*, Rambur), calotermicídeos (tais como *Cryptotermes* sp) e rinotermicídeos (tais como *Reticulitermes* sp, *Coptotermes* sp, *Heterotermes tenuis*, Hagen), cupim subterrâneo oriental (*Reticulitermes flavipes*, Kollar), cupim subterrâneo ocidental (*Reticulitermes hesperus*, Banks), cupim subterrâneo de Taiwan (*Coptotermes formosanus*, Shiraki), cupim da madeira seca do oeste da Índia (*Incisitermes immigrans*, Snyder), cupim do pó (*Cryptotermes brevis*, Walker), cupim de madeira seca (*Incisitermes snyderi*, Light), cupim subterrâneo do sudeste (*Reticulitermes virginicus*, Banks), cupim de madeira seca do oeste (*Incisitermes minor*, Hagen), cupins das árvores, tais como *Nasutitermes* sp e outros cupins de importância econômica; insetos pragas da ordem dos tisanúreos, tais como traça dos livros (*Lepisma saccharina*, Linnaeus) e tesourinhas (*Thermobia domestica*, Packard); insetos pragas da ordem dos malófagos, incluindo piolho humano (*Pediculus humanus capitis*, De Geer), piolho do corpo (*Pediculus humanus*, Linnaeus), piolho das galinhas (*Menacanthus stramineus*, Nitsch), piolho dos cães (*Trichodectes canis*, De Geer), piolho da penugem (*Goniocotes gallinae*, De Geer), piolho dos carneiros (*Bovicola ovis*, Schrank), piolho bovino de nariz curto (*Haematopinus eurysternus*, Nitsch), piolho bovino de nariz longo (*Linognathus vituli*, Linnaeus) e outros piolhos parasíticos sugadores e mordedores que atacam o homem e os animais; insetos pragas da ordem dos sifonópteros, incluindo a pulga dos ratos oriental (*Xenopsylla cheopis*, Rothschild), pulga dos gatos (*Ctenocephalides felis*, Bouche), pulga dos cães (*Ctenocephalides canis*, Curtis), pulga das aves (*Ceratophyllus gallinae*, Schrank), pulga das galinhas (*Echidnophaga gallinacea*, Westwood), pulga humana (*Pulex irritans*, Linnaeus) e outras pulgas que afligem os mamíferos e as aves. Pragas artrópodes adicionais cobertas incluem: aranhas

da ordem das aranhas, tais como a aranha reclusa marrom (*Loxosceles reclusa*, Gertsch e Mulaik) e a aranha viúva negra (*Latrodectus mactans*, Fabricius) e centopéias da ordem dos escutigeromorfos, tais como a centopéia doméstica (*Scutigera coleoptrata*, Linnaeus). Os compostos de acordo com a presente invenção também apresentam atividade sobre membros das classes dos nematóides, céstodes, trematóides e acantocéfalos, incluindo membros economicamente importantes das ordens dos estrongilídeos, ascaridídeos, oxiurídeos, rabditídeos, espirurídeos e enóplidos, tais como, mas sem limitar-se a pragas agrícolas economicamente importantes (ou seja, nematóides dos nós das raízes do gênero *Meloidogyne*, nematóides de lesões do gênero *Pratylenchus*, nematóides das raízes grossas do gênero *Trichodorus* etc.) e pragas de saúde humana e animal (ou seja, todos os vermes, solitárias e lombrigas economicamente importantes, tais como *Strongylus vulgaris* em cavalos, *Toxocara canis* em cães, *Haemonchus contortus* em carneiros, *Dirofilaria immitis* Leidy em cães, *Anoplocephala perfoliata* em cavalos, *Fasciola hepatica* Linnaeus em ruminantes etc.).

[0185] Os compostos de acordo com a presente invenção exibem atividade particularmente alta contra pragas da ordem dos lepidópteros (por exemplo, *Alabama argillacea* Hübner (larva das folhas de algodão), *Archips argyrospila* Walker (lagarta das folhas das árvores frutíferas), *A. rosana* Linnaeus (lagarta das folhas européia) e outras espécies de *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (broca do caule de arroz), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenée (lagarta da folha de arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (verme de teias de raiz de milho), *Crambus teterrellus* Zincken (verme de teias de capim do campo), *Cydia pomonella* Linnaeus (traça das frutas), *Earias insulana* Boisduval (larva de mariposa espinhosa), *Earias vittella* Fabricius (larva de mariposa manchada), *Helicoverpa armigera* Hübner (larva de mariposa americana), *Helicoverpa zea* Boddie (larva de mariposa do milho), *Heliothis virescens* Fabricius (verme dos

botões de fumo), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (verme de teias do gramado), *Lobesia botrana* Denis e Schiffermüller (traça da uva), *Pectinophora gossypiella* Saunders (larva de mariposa rosa), *Phyllocnistis citrella* Stainton (lagarta dos cítricos), *Pieris brassicae* Linnaeus (borboleta branca grande), *Pieris rapae* Linnaeus (borboleta branca pequena), *Plutella xylostella* Linnaeus (traça das crucíferas), *Spodoptera exigua* Hübner (lagarta da beterraba), *Spodoptera litura* Fabricius (gramiola do fumo, lagarta dos cachos), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (lagarta do outono), *Trichoplusia ni* Hübner (larva do repolho) e *Tuta absoluta* Meyrick (lagarta do tomate)).

[0186] Os compostos de acordo com a presente invenção também apresentam atividade significativa sobre membros da ordem dos homópteros, que incluem: *Acyrtosiphon pisum* Harris (afídeo da ervilha), *Aphis craccivora* Koch (afídeo do feijão-fradinho), *Aphis fabae* Scopoli (afídeo do feijão preto), *Aphis gossypii* Glover (afídeo do algodão, afídeo do melão), *Aphis pomi* De Geer (afídeo da maçã), *Aphis spiraecola* Patch (afídeo da parte superior), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (afídeo da dedaleira), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (afídeo do morango), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (afídeo do trigo russo), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (afídeo da maçã rosada), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (afídeo da maçã lanosa), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (afídeo da ameixa farinácea), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (afídeo do nabo), *Metopolophium dirrhodum* Walker (afídeo dos cereais), *Macrosipum euphorbiae* Thomas (afídeo da batata), *Myzus persicae* Sulzer (afídeo da batata-pêssego, afídeo do pêssego verde), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (afídeo da alface), *Pemphigus spp.* (afídeos das raízes e afídeos da galha), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (afídeo da folha de milho), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (afídeo da aveia-cereja de pássaros), *Schizaphis graminum* Rondani (besouro verde), *Sitobion avenae* Fabricius (afídeo dos cereais inglês), *Therioaphis maculata* Buckton (afídeo da alfafa manchado), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (afídeo negro dos cítricos) e *Toxoptera citricida* Kirkaldy

(afídeo marrom dos cítricos); *Adelges spp.* (adelgídeos); *Phylloxera devastatrix* Pergande (filoxera da noz pecã), *Bemisia tabaci* Gennadius (mosca branca do fumo, mosca branca da batata-doce), *Bemisia argentifolii* Bellows e Perring (mosca branca da folha de prata), *Dialeurodes citri* Ashmead (mosca branca dos cítricos) e *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca branca da estufa); *Empoasca fabae* Harris (gafanhoto das folhas de batata), *Laodelphax striatellus* Fallen (gafanhoto marrom das plantas menor), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (gafanhoto das folhas de áster), *Nephotettix cincticeps* Uhler (gafanhoto verde das folhas), *Nephotettix nigropictus* Stål (gafanhoto das folhas de arroz), *Nilaparvata lugens* Stål (gafanhoto marrom das plantas), *Peregrinus maidis* Ashmead (gafanhoto das plantas de milho), *Sogatella furcifera* Horvath (gafanhoto das plantas de costas brancas), *Sogatodes orizicola* Muir (delfacídeo de arroz), *Typhlocyba pomaria* McAtee (gafanhoto branco das folhas de maçã), *Erythroneoura spp.* (gafanhotos das folhas de uva); *Magiciada septendecim* Linnaeus (cigarra de estação); *Icerya purchasi* Maskell (mede-palms do algodão), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (mede-palms de São José), *Planococcus citri* Risso (besouro farináceo dos cítricos), *Pseudococcus spp.* (outro complexo de besouro farináceo), *Cacopsylla pyricola* Foerster (psila da pêra), *Trioza diospyri* Ashmead (psila de dióspiro).

[0187] Os compostos de acordo com a presente invenção também apresentam atividade sobre membros da ordem dos hemípteros, que incluem: *Acrosternum hilare* Say (besouro verde de mau cheiro), *Anasa tristis* De Geer (besouro da abóbora), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (besouro percevejo), *Cimex lectularius* Linnaeus (besouro do leito), *Corythuca gossypii* Fabricius (besouro de renda de algodão), *Cyrtopeltis modesta* Distant (besouro do tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (besouro do algodão), *Euchistus servus* Say (besouro marrom de mau cheiro), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (besouro de mau cheiro com uma mancha), *Graptosthetus spp.* (complexo de

besouros de sementes), *Leptoglossus corculus* Say (besouro de sementes de pinho em folhas), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (besouro de plantas manchado), *Nezara viridula* Linnaeus (besouro verde de mau cheiro do sul), *Oebalus pugnax* Fabricius (besouro de mau cheiro do arroz), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (besouro grande de plantas leitosas), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (gafanhoto-pulga do algodão). Outras ordens de insetos controladas por compostos de acordo com a presente invenção incluem tisanópteros (por exemplo, *Frankliniella occidentalis* Pergande (tripe das flores do oeste), *Scirtothrips citri* Moulton (tripe dos cítricos), *Sericothrips variabilis* Beach (tripe da soja) e *Thrips tabaci* Lindeman (tripe da cebola)); e a ordem dos coleópteros (por exemplo, *Leptinotarsa decemlineata* Say (besouro da batata do Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (besouro do feijão mexicano) e larvas dos fios do gênero *Agriotes*, *Athous* ou *Limonius*).

[0188] Observe-se que alguns sistemas de classificação contemporâneos colocam os homópteros como subordem da ordem dos hemípteros.

[0189] Merece observação o uso de compostos de acordo com a presente invenção para o controle de moscas brancas das folhas de prata (*Bemisia argentifolii*). Merece observação o uso de compostos de acordo com a presente invenção para o controle de tripe das flores do oeste (*Frankliniella occidentalis*). Merece observação o uso de compostos de acordo com a presente invenção para controle de gafanhoto das batatas (*Empoasca fabae*). Merece observação o uso de compostos de acordo com a presente invenção para o controle de gafanhoto do milho (*Peregrinus maidis*). Merece observação o uso de compostos de acordo com a presente invenção para o controle de afídeo do melão e algodão (*Aphis gossypii*). Merece observação o uso de compostos de acordo com a presente invenção para o controle de afídeo do pêssago verde (*Myzus persicae*). Merece observação o uso de compostos de acordo com a

presente invenção para o controle de traça das crucíferas (*Plutella xylostella*). Merece observação o uso de compostos de acordo com a presente invenção para o controle da lagarta dos cereais de outono (*Spodoptera frugiperda*).

[0190] Os compostos de acordo com a presente invenção podem também ser misturados com um ou mais agentes ou compostos biologicamente ativos diferentes, que incluem inseticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, reguladores do crescimento tais como estimulantes do enraizamento, quimioesterilizadores, semioquímicos, repelentes, atrativos, feromônios, estimulantes da alimentação, outros compostos biologicamente ativos ou vírus, fungos ou bactérias entomopatogênicas para formar pesticida de múltiplos componentes, oferecendo espectro ainda mais amplo de utilidade agronômica e não agronômica. Desta forma, a presente invenção também se refere a composição que compreende quantidade biologicamente eficaz de composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal e quantidade eficaz de pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional e pode compreender ainda pelo menos um dentre tensoativo, diluente sólido ou diluente líquido. Os outros agentes ou compostos biologicamente ativos podem ser formulados em composições que compreendem pelo menos um dentre tensoativo, diluente sólido ou líquido. Para as misturas de acordo com a presente invenção, os demais agentes ou compostos biologicamente ativos podem ser formulados junto com os compostos do presente, incluindo os compostos da Fórmula 1, para formar mistura prévia, ou os outros agentes ou compostos biologicamente ativos podem ser formulados separadamente dos compostos do presente, incluindo os compostos da Fórmula 1 e as duas formulações combinadas entre si antes da aplicação (tal como em tanque de pulverização) ou, alternativamente, aplicadas sucessivamente.

[0191] Outros agentes ou compostos biologicamente ativos úteis nas composições de acordo com a presente invenção podem ser selecionados

a partir de agentes de controle de pragas invertebradas que possuem modo de ação diferente ou classe química diferente, incluindo moduladores de canais de sódio, inibidores da colinesterase, neonicotinóides, lactonas macrocíclicas inseticidas, bloqueadores de canais de cloreto regulados por GABA (ácido γ -aminobutírico), imitadores de hormônios juvenis, inibidores da síntese de quitina, imitadores de hormônios juvenis, ligantes receptores de octopamina, agonistas de ecdisona, ligantes receptores de rianodina, análogos de nereistoxina, inibidores do transporte de elétrons da mitocôndria, inibidores da biossíntese de lipídios, inseticidas de ciclodieno, inibidores da formação de mofo e agentes biológicos que incluem nucleopoliedrovírus (NPV), membro de *Bacillus thuringiensis*, delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*; e inseticida viral de ocorrência natural ou geneticamente modificado.

[0192] Merece observação composição de acordo com a presente invenção em que pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é selecionado a partir de inseticidas do grupo que consiste de moduladores de canais de sódio, inibidores da colinesterase, neonicotinóides, lactonas macrocíclicas inseticidas, bloqueadores de canais de cloreto regulados por GABA, inibidores da síntese de quitina, imitadores de hormônios juvenis, ligantes receptores de octopamina, agonistas de ecdisona, ligantes receptores de rianodina, análogos de nereistoxina, inibidores do transporte de elétrons da mitocôndria, inibidores da biossíntese de lipídios, inseticidas de ciclodieno, inibidores da formação de mofo e agentes biológicos que incluem nucleopoliedrovírus, membro de *Bacillus thuringiensis*, delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis* e inseticida viral de ocorrência natural ou geneticamente modificado.

[0193] Merecem observação específica agentes ou compostos biologicamente ativos adicionais selecionados a partir de inseticidas do grupo que consiste de moduladores de canais de sódio, inibidores da colinesterase,

neonicotinóides, lactonas macrocíclicas inseticidas, bloqueadores de canais de cloreto regulados por GABA, inibidores da síntese de quitina, imitadores de hormônios juvenis, ligantes receptores de octopamina, agonistas de ecdisona, ligantes receptores de rianodina, análogos de nereistoxina, inibidores do transporte de elétrons da mitocôndria, inibidores da biossíntese de lipídios, inseticidas de ciclodieno, nucleopoliedrovírus; membro de *Bacillus thuringiensis*, delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis* e inseticida viral de ocorrência natural ou geneticamente modificado.

[0194] Merecem observação adicional agentes ou compostos biologicamente ativos adicionais selecionados a partir de inseticidas do grupo que consiste de piretróides, carbamatos, neonicotinóides, bloqueadores de canais de sódio neuronais, lactonas macrocíclicas inseticidas, antagonistas de ácido γ -aminobutírico, uréias inseticidas e imitadores de hormônios juvenis, membro de *Bacillus thuringiensis*, delta-endotoxina de *Bacillus thuringiensis* e inseticida viral de ocorrência natural ou geneticamente modificado.

[0195] Exemplos desses agentes ou compostos biologicamente ativos com os quais os compostos de acordo com a presente invenção podem ser formulados são: inseticidas tais como abamectina, acefato, acetamiprida, acetoprol, amidoflomet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfós-metil, bifentrina, bifenazato, bistrifluron, buprofezina, carbofuran, cartap, clorfenapir, clorfuazuron, clorantraniliprol (DPX-E2Y45), clorpirifós, clorpirifós-metil, cromafenozida, clotianidina, ciflumetofen, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, gama-cialotrina, lambda-cialotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuron, diazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimeflutrina, dimetoato, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endossulfan, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronil, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim (UR-50701), flufenoxuron, fonofós, halofenozida, hexaflumuron, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb,

isofenfós, lufenuron, malation, metaflumizona, metaldeído, metamidofós, metidation, metomil, metoprene, metoxiclor, metoflutrina, monocrotofós, metoxifenoazida, monocrotofós, nitenpiram, nitiazina, novaluron, noviflumuron (XDE-007), oxamil, paration, paration-metil, permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofós, proflutrina, protrifenbuta, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridil, pirifluquinazon, piriprol, piriproxifen, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno (BSN 2060), espirotetramato, sulprofós, tebufenoazida, teflubenzuron, teflutrina, terbufós, tetraclorvinfós, tiacloprida, tiametoxam, tiodicarb, tiossultap-sódio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfon e triflumuron; fungicidas, tais como acibenzolar, aldimorf, amisulbrom, azaconazol, azoxistrobina, benalaxil, benomil, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropila, binomial, bifenila, bitertanol, blasticidin-S, mistura de Bordéus (sulfato de cobre tribásico), boscalid/nicobifen, bromuconazol, bupirimato, butiobato, carboxina, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, cloroneb, clorotalonil, clozolinato, clotrimazol, oxicloreto de cobre, sais de cobre tais como sulfato de cobre e hidróxido de cobre, ciazofamid, ciflunamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, diclofuanid, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, dicostrobina, ditianon, dodemorf, dodina, econazol, etaconazol, edifenfós, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fencaramid, fenfuram, fenhexamida, fenoxanil, fenciclonil, fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferfurazoato, ferinzone, fluazinam, fludioxonil, flumetover, fluopicolida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetil-alumínio, fuberidazol, furalaxil, furametapir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalil, imibenconazol, iminoctadina, iodicarb, ipconazol, iprobenfós, iprodiona, iprovalicarb, isoconazol, isoprotiolano, casugamicina, cresoxim-metil, mancozeb, mandipropamid,

maneb, mapanipirina, mefenoxam, mepronil, metalaxil, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobin/fenominostrobin, mepanipirim, metrafenona, miconazol, miclobutanil, neo-asozina (metanoarsonato férrico), nuarimol, octilinona, ofurace, orisastrobin, oxadixil, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, paclobutrazol, penconazol, pencicuron, pentiopirad, perfurazato, ácido fosfônico, ftalida, picobenzamid, picoxistrobin, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, cloridrato de propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobin, pirazofós, pirifenox, pirimetanil, pirifenox, pirolnitrina, piroquilon, quinconazol, quinoxifen, quintozone, siltiofam, simeconazol, espiroxamina, estreptomicina, enxofre, tebuconazol, tecrazene, tecloftalam, tecnazene, tetraconazol, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato, tiofanato-metil, tiram, tiadinil, tolclófos-metil, tolfluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazóxido, tridemorf, trimorfamida, triciclazol, trifloxistrobin, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, vinclozolina, zineb, ziram e zoxamida; nematicidas, tais como aldicarb, imiciafós, oxamil e fenamifós; bactericidas, tais como estreptomicina; acaricidas, tais como amitraz, chinometionat, clorobenzilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridaben e tebufenpirad; e agentes biológicos incluindo bactérias entomopatogênicas, tais como *Bacillus thuringiensis* subespécie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespécie *kurstaki* e as delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* (tais como Cellcap, MPV, MPVII); fungos entomopatogênicos, tais como fungo muscardina verde; e vírus entomopatogênicos que incluem bacilovírus, nucleopoliedrovírus (NPV) tais como nucleopoliedrovírus de *Helicoverpa zea* (HzNPV); nucleopoliedrovírus de *Anagrapha falcifera* (AfNPV); e vírus da granulose (GV), tais como vírus da granulose de *Cydia pomonella* (CpGV).

[0196] Os compostos de acordo com a presente invenção e suas composições podem ser aplicados a plantas geneticamente transformadas para expressar proteínas tóxicas para pragas invertebradas (tais como delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*). O efeito dos compostos de controle de pragas invertebradas aplicados de forma exógena de acordo com a presente invenção pode ser sinérgico com as proteínas de toxina expressas.

[0197] Referências gerais para estes protetores agrícolas (ou seja, inseticidas, fungicidas, nematicidas, acaricidas, herbicidas e agentes biológicos) incluem *The Pesticide Manual*, 13ª edição, C. D. S. Tomlin, ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2003, e *The BioPesticide Manual*, segunda edição, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2001.

[0198] Merece observação composição de acordo com a presente invenção em que pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é selecionado a partir do grupo que consiste de abamectina, acefato, acetamiprida, acetoprol, aldicarb, amidoflomet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfós-metil, bifentrina, bifenazato, bistrifluron, buprofezina, carbofuran, cartap, chinometionat, clorfenapir, clorfluazuron, clorantraniliprol, clorpirifós, clorpirifós-metil, clorobenzilato, cromafenozida, clotianidina, ciflumetofen, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, gama-cialotrina, lambda-cialotrina, cihexatina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuron, diazinon, dicofol, dieldrin, dienoclor, diflubenzuron, dimeflutrina, dimetoato, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvalerato, etiprol, etoxazol, fenamifós, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvalerato, fipronil, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim, flufenoxuron, fonofós, halofenozida, hexaflumuron, hexitiazox, hidrametilnon, imiciafós, imidacloprid, indoxacarb, isofenfós, lufenuron, malation, metaflumizona, metaldeído, metamidofós,

metidation, metomil, metoprene, metoxiclor, metoxifenoza, metoflutrina, monocrotofos, nitenpiram, nitiazina, novaluron, noviflumuron, oxamil, paration, paration-metil, permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protrifenbute, pimetozina, pirafluprol, piretrina, piridaben, piridail, pirfluquinazon, piriprol, piriproxifen, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclufen, espiromesifeno, espirotetramato, sulprofos, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzuron, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprida, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap de sódio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfon, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopoliedrovirus, delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*, bacilovirus, bacterias entomopatogênicas, virus entomopatogênicos e fungos entomopatogênicos.

[0199] Também merece observação composição de acordo com a presente invenção em que pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é selecionado a partir do grupo que consiste de abamectina, acetamiprida, amitraz, avermectina, azadiractina, bifentrina, buprofezina, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, lambda-cialotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronil, flonicamida, flubendiamida, flufenoxuron, hexaflumuron, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizona, metomil, metoprene, metoxifenoza, nitenpiram, nitiazina, novaluron, oxamil, pimetozina, piretrina, piridaben, piridail, piriproxifen, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclufen, espiromesifeno, tebufenozida, tiacloprida, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap de sódio, tralometrina, triazamato, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopoliedrovirus e delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*.

[0200] Para realizações em que são utilizados um ou mais desses vários parceiros de mistura, a razão em peso entre esses vários parceiros de mistura (no total) e o composto da Fórmula 1 é tipicamente de cerca de 1:3000 a cerca de 3000:1. Merecem observação razões em peso de cerca de 1:300 a cerca de 300:1 (tais como razões de cerca de 1:30 a cerca de 30:1). Os técnicos no assunto podem determinar facilmente por meio de experimentação simples as quantidades biologicamente eficazes de ingredientes ativos necessários para o espectro desejado de atividade biológica. Será evidente que a inclusão desses componentes adicionais pode expandir o espectro de pragas invertebradas controladas para além do espectro controlado pelo composto da Fórmula 1 isoladamente.

[0201] Em certos casos, combinações de composto de acordo com a presente invenção com outros agentes ou compostos (particularmente de controle de pragas invertebradas) biologicamente ativos (ou seja, ingredientes ativos) podem resultar em efeito maior que o aditivo (ou seja, sinérgico). Sempre é desejável reduzir a quantidade de ingredientes ativos liberados no ambiente ainda que garantindo controle eficaz de pragas. Quando for encontrada sinergia de ingredientes ativos de controle de pragas invertebradas em taxas de aplicação que gerem níveis agronomicamente satisfatórios de controle de pragas invertebradas, essas combinações podem ser vantajosas para reduzir o custo de produção de safras e reduzir a carga ambiental.

[0202] Merece observação combinação de composto da Fórmula 1 com pelo menos um outro ingrediente ativo de controle de pragas invertebradas. Merece observação específica combinação em que o outro ingrediente ativo de controle de pragas invertebradas possui local de ação diferente do composto da Fórmula 1. Em certos casos, combinação com pelo menos um outro ingrediente ativo de controle de pragas invertebradas que possui espectro de controle similar mas local de ação diferente será particularmente vantajosa para administração

de resistência. Desta forma, composição de acordo com a presente invenção pode compreender adicionalmente quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um ingrediente ativo de controle de pragas invertebradas adicional que possui espectro de controle similar mas local de ação diferente. O contato de planta geneticamente modificada para que expresse composto de praga invertebrada (tal como proteína) ou o local da planta com quantidade biologicamente eficaz de composto de acordo com a presente invenção pode também fornecer espectro mais amplo de proteção às plantas e ser vantajoso para a administração de resistência.

[0203] A Tabela A relaciona combinações específicas de composto da Fórmula 1 com outros agentes de controle de pragas invertebradas que ilustram as misturas, composições e métodos de acordo com a presente invenção. A primeira coluna da Tabela A relaciona os agentes de controle de pragas invertebradas específicos (tais como “abamectina” na primeira linha). A segunda coluna da Tabela A relaciona o modo de ação (quando conhecido) ou classe química dos agentes de controle de pragas invertebradas. A terceira coluna da Tabela A relaciona realização(ões) de faixas de razões em peso para taxas em que o agente de controle de pragas invertebradas pode ser aplicado com relação a composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal (tal como “50:1 a 1:50” de abamectina com relação a composto da Fórmula 1 em peso). Desta forma, por exemplo, a primeira linha da Tabela A descreve especificamente que a combinação de composto da Fórmula 1 com abamectina pode ser aplicada em razão em peso de 50:1 a 1:50. As linhas restantes da Tabela A devem ser interpretadas de forma similar. Merece observação adicional que a Tabela A relaciona combinações específicas de composto da Fórmula 1 com outros agentes de controle de pragas invertebradas ilustrativos das misturas, composições e métodos de acordo com a presente invenção e inclui realizações adicionais de faixas de razão em peso para taxas de aplicação.

TABELA A

Agente de controle de pragas invertebradas	Modo de ação ou classes químicas	Razão em peso típica
Abamectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:50
Acetamiprida	Neonicotinóides	150:1 a 1:200
Amitraz	Ligantes receptores de octopamina	200:1 a 1:100
Avermectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:50
Azadiractina	Agonistas de ecdisona	100:1 a 1:120
Beta-ciflutrina	Moduladores de canais de sódio	150:1 a 1:200
Bifentrina	Moduladores de canais de sódio	100:1 a 1:10
Buprofezin	Inibidores da síntese de quitina	500:1 a 1:50
Cartap	Análogos de nereistoxina	100:1 a 1:200
Clorantraniliprol	Ligantes receptores de rianodina	100:1 a 1:120
Clorfenapir	Inibidores do transporte de elétrons mitocondriais	300:1 a 1:200
Clorpirifós	Inibidores da colinesterase	500:1 a 1:200
Clotianidina	Neonicotinóides	100:1 a 1:400
Ciflutrina	Moduladores de canais de sódio	150:1 a 1:200
Cialotrina	Moduladores de canais de sódio	150:1 a 1:200
Cipermetrina	Moduladores de canais de sódio	150:1 a 1:200
Ciromazina	Inibidores da síntese de quitina	400:1 a 1:50
Deltametrina	Moduladores de canais de sódio	50:1 a 1:400
Dieldrin	Inseticidas de ciclodieno	200:1 a 1:100
Dinotefuran	Neonicotinóides	150:1 a 1:200
Diofenolan	Inibidor da muda	150:1 a 1:200
Emamectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:10
Endosulfan	Inseticidas de ciclodieno	200:1 a 1:100
Esfenvalerato	Moduladores de canais de sódio	100:1 a 1:400
Etiprol	Bloqueadores de canais de cloreto	200:1 a 1:100

Agente de controle de pragas invertebradas	Modo de ação ou classes químicas	Razão em peso típica
	regulados por GABA	
Fenotiocarb		150:1 a 1:200
Fenoxicarb	Imitadores de hormônios juvenis	500:1 a 1:100
Fenvalerato	Moduladores de canais de sódio	150:1 a 1:200
Fipronil	Bloqueadores de canais de cloreto regulados por GABA	150:1 a 1:100
Flonicamida		200:1 a 1:100
Flubendiamida	Ligantes receptores de rianodina	100:1 a 1:120
Flufenoxuron	Inibidores da síntese de quitina	200:1 a 1:100
Hexaflumuron	Inibidores da síntese de quitina	300:1 a 1:50
Hidrametilnon	Inibidores de transporte de elétrons mitocondriais	150:1 a 1:250
Imidacloprid	Neonicotinóides	1000:1 a 1:1000
Indoxacarb	Moduladores de canais de sódio	200:1 a 1:50
Lambda-cialotrina	Moduladores de canais de sódio	50:1 a 1:250
Lufenuron	Inibidores da síntese de quitina	500:1 a 1:250
Metaflumizona		200:1 a 1:200
Metomil	Inibidores da colinesterase	500:1 a 1:100
Metoprene	Imitadores de hormônios juvenis	500:1 a 1:100
Metoxifenoziata	Agonistas de ecdisona	50:1 a 1:50
Nitenpiram	Neonicotinóides	150:1 a 1:200
Nitiazina	Neonicotinóides	150:1 a 1:200
Novaluron	Inibidores da síntese de quitina	500:1 a 1:150
Oxamil	Inibidores da colinesterase	200:1 a 1:200
Pimetrozina		200:1 a 1:100
Piretrina	Moduladores de canais de sódio	100:1 a 1:10
Piridaben	Inibidores do transporte de elétrons mitocondriais	200:1 a 1:100

Agente de controle de pragas invertebradas	Modo de ação ou classes químicas	Razão em peso típica
Piridalil		200:1 a 1:100
Piriproxifen	Imitadores de hormônios juvenis	500:1 a 1:100
Rianodina	Ligantes receptores de rianodina	100:1 a 1:120
Espinetoram	Lactonas macrocíclicas	150:1 a 1:100
Espinosad	Lactonas macrocíclicas	500:1 a 1:10
Espirodiclofeno	Inibidores da biossíntese de lipídios	200:1 a 1:200
Espiromesifeno	Inibidores da biossíntese de lipídios	200:1 a 1:200
Tebufenozida	Agonistas de ecdisona	500:1 a 1:250
Tiacloprida	Neonicotinóides	100:1 a 1:200
Tiametoxam	Neonicotinóides	1250:1 a 1:1000
Tiodicarb	Inibidores da colinesterase	500:1 a 1:400
tiosultap de sódio		150:1 a 1:100
Tralometrina	Moduladores de canais de sódio	150:1 a 1:200
Triazamato	Inibidores da colinesterase	250:1 a 1:100
Triflumuron	Inibidores da síntese de quitina	200:1 a 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	Agentes biológicos	50:1 a 1:10
delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	Agentes biológicos	50:1 a 1:10
NPV (tal como Gemstar)	Agentes biológicos	50:1 a 1:10

[0204] Uma realização de agentes de controle de pragas invertebradas (tais como inseticidas e acaricidas) para mistura com compostos de acordo com a presente invenção inclui moduladores de canais de sódio tais como bifentrina, cipermetrina, cialotrina, lambda-cialotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, deltametrina, dimeflutrina, esfenvalerato, fenvalerato, indoxacarb, metoflutrina, proflutrina, piretrina e tralometrina; inibidores da colinesterase, tais como clorpirifós, metomil, oxamil, tiodicarb e triazamato; neonicotinóides, tais

como acetamiprida, clotianidina, dinotefuran, imidacloprid, nitempiram, nitiazina, tiacloprida e tiametoxam; lactonas macrocíclicas inseticidas, tais como espinetoram, espinosad, abamectina, avermectina e emamectina; bloqueadores de canais de cloreto regulados por GABA (ácido γ -aminobutírico), tais como endosulfan, etiprol e fipronil; inibidores da síntese de quitina, tais como buprofezina, ciromazina, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron e triflumuron; imitadores de hormônios juvenis, tais como diofenolan, fenoxicarb, metoprene e piriproxifen; ligantes receptores de octopamina, tais como amitraz; agonistas de ecdisona, tais como azadiractina, metoxifenoazida e tebufenoazida; ligantes receptores de rianodina, tais como rianodina, diamidas antranílicas tais como clorantraniliprol (vide a Patente Norte-Americana nº 6.747.047, Publicações PCT WO 2003/015518 e WO 2004/067528) e flubendiamida (vide Patente Norte-Americana nº 6.603.044); análogos de nereistoxina tais como cartap; inibidores do transporte de elétrons da mitocôndria tais como clorfenapir, hidrametilnon e piridaben; inibidores da biossíntese de lipídios, tais como espiroclorfen e espiromesifeno; inseticidas de ciclodieno tais como dieldrin; ciflumetofen; fenotiocarb; flonicamida; metaflumizona; pirafluprol; piridilil; piriprol; pimezotina; espirotetramato e tiosultap de sódio. Uma realização de agentes biológicos para mistura com compostos de acordo com a presente invenção inclui nucleopoliedrovírus tal como HzNPV e AfNPV; *Bacillus thuringiensis* e delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis*, tais como Cellcap, MPV e MPVII; bem como inseticidas virais de ocorrência natural e geneticamente modificados que incluem membros da família dos bacilovirídeos, bem como fungos entomófagos. Merece observação a composição de acordo com a presente invenção em que o pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é selecionado a partir dos Agentes de Controle de Pragas Invertebradas relacionados na Tabela A acima. Também merece observação a composição de acordo com a presente

invenção em que o pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é selecionado a partir do grupo que consiste de cipermetrina, cialotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, esfenvalerato, fenvalerato, tralometrina, fenotiocarb, metomil, oxamil, tiodicarb, acetamiprida, clotianidina, imidacloprid, tiametoxam, tiacloprida, indoxacarb, espinosad, abamectina, avermectina, emamectina, endosulfan, etiprol, fipronil, flufenoxuron, triflumuron, diofenolan, piriproxifen, pimeprozina, amitraz, *Bacillus thuringiensis aisawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, delta endotoxina de *Bacillus thuringiensis* e fungos entomófagos.

[0205] As razões em peso entre composto, incluindo composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal, e o agente de controle de pragas invertebradas adicional são tipicamente de 1000:1 a 1:1000, em que uma realização é de 500:1 a 1:500, outra realização é de 250:1 a 1:200 e outra realização é de 100:1 a 1:50.

[0206] Encontram-se relacionadas abaixo na Tabela B realizações de composições específicas que compreendem composto da Fórmula 1 (os números de compostos designam compostos nas Tabelas Índice A a C) e agente de controle de pragas invertebradas adicional.

TABELA B

Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent	Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent
A-1	1	and	Abamectin	B-1	2	and	Abamectin
A-2	1	and	Acetamiprid	B-2	2	and	Acetamiprid
A-3	1	and	Amitraz	B-3	2	and	Amitraz
A-4	1	and	Avermectin	B-4	2	and	Avermectin
A-5	1	and	Azadirachtin	B-5	2	and	Azadirachtin
A-6	1	and	Beta-cyfluthrin	B-6	2	and	Beta-cyfluthrin
A-7	1	and	Bifenthrin	B-7	2	and	Bifenthrin

Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent	Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent
A-8	1	and	Buprofezin	B-8	2	and	Buprofezin
A-9	1	and	Cartap	B-9	2	and	Cartap
A-10	1	and	Chlorantraniliprole	B-10	2	and	Chlorantraniliprole
A-11	1	and	Chlorfenapyr	B-11	2	and	Chlorfenapyr
A-12	1	and	Chlorpyrifos	B-12	2	and	Chlorpyrifos
A-13	1	and	Clothianidin	B-13	2	and	Clothianidin
A-14	1	and	Cyfluthrin	B-14	2	and	Cyfluthrin
A-15	1	and	Cyhalothrin	B-15	2	and	Cyhalothrin
A-16	1	and	Cypermethrin	B-16	2	and	Cypermethrin
A-17	1	and	Cyromazine	B-17	2	and	Cyromazine
A-18	1	and	Deltamethrin	B-18	2	and	Deltamethrin
A-19	1	and	Dieldrin	B-19	2	and	Dieldrin
A-20	1	and	Dinotefuran	B-20	2	and	Dinotefuran
A-21	1	and	Diofenolan	B-21	2	and	Diofenolan
A-22	1	and	Emamectin	B-22	2	and	Emamectin
A-23	1	and	Endosulfan	B-23	2	and	Endosulfan
A-24	1	and	Esfenvalerate	B-24	2	and	Esfenvalerate
A-25	1	and	Ethiprole	B-25	2	and	Ethiprole
A-26	1	and	Fenothiocarb	B-26	2	and	Fenothiocarb
A-27	1	and	Fenoxycarb	B-27	2	and	Fenoxycarb
A-28	1	and	Fenvalerate	B-28	2	and	Fenvalerate
A-29	1	and	Fipronil	B-29	2	and	Fipronil
A-30	1	and	Flonicamid	B-30	2	and	Flonicamid
A-31	1	and	Flubendiamide	B-31	2	and	Flubendiamide
A-32	1	and	Flufenoxuron	B-32	2	and	Flufenoxuron
A-33	1	and	Hexaflumuron	B-33	2	and	Hexaflumuron
A-34	1	and	Hydramethylnon	B-34	2	and	Hydramethylnon
A-35	1	and	Imidacloprid	B-35	2	and	Imidacloprid
A-36	1	and	Indoxacarb	B-36	2	and	Indoxacarb
A-37	1	and	Lambda-cyhalothrin	B-37	2	and	Lambda-cyhalothrin
A-38	1	and	Lufenuron	B-38	2	and	Lufenuron
A-39	1	and	Metaflumizone	B-39	2	and	Metaflumizone
A-40	1	and	Methomyl	B-40	2	and	Methomyl
A-41	1	and	Methoprene	B-41	2	and	Methoprene
A-42	1	and	Methoxyfenozide	B-42	2	and	Methoxyfenozide
A-43	1	and	Nitenpyram	B-43	2	and	Nitenpyram
A-44	1	and	Nithiazine	B-44	2	and	Nithiazine

Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent	Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent
A-45	1	and	Novaluron	B-45	2	and	Novaluron
A-46	1	and	Oxamyl	B-46	2	and	Oxamyl
A-47	1	and	Pymetrozine	B-47	2	and	Pymetrozine
A-48	1	and	Pyrethrin	B-48	2	and	Pyrethrin
A-49	1	and	Pyridaben	B-49	2	and	Pyridaben
A-50	1	and	Pyridalyl	B-50	2	and	Pyridalyl
A-51	1	and	Pyriproxyfen	B-51	2	and	Pyriproxyfen
A-52	1	and	Ryanodine	B-52	2	and	Ryanodine
A-53	1	and	Spinetoram	B-53	2	and	Spinetoram
A-54	1	and	Spinosad	B-54	2	and	Spinosad
A-55	1	and	Spirodiclofen	B-55	2	and	Spirodiclofen
A-56	1	and	Spiromesifen	B-56	2	and	Spiromesifen
A-57	1	and	Tebufenozide	B-57	2	and	Tebufenozide
A-58	1	and	Thiacloprid	B-58	2	and	Thiacloprid
A-59	1	and	Thiamethoxam	B-59	2	and	Thiamethoxam
A-60	1	and	Thiodicarb	B-60	2	and	Thiodicarb
A-61	1	and	Thiosultap-sodium	B-61	2	and	Thiosultap-sodium
A-62	1	and	Tralomethrin	B-62	2	and	Tralomethrin
A-63	1	and	Triazamate	B-63	2	and	Triazamate
A-64	1	and	Triflumuron	B-64	2	and	Triflumuron
A-65	1	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>	B-65	2	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>
A-66	1	and	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin	B-66	2	and	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin
A-67	1	and	NPV (e.g., Gemstar)	B-67	2	and	NPV (e.g., Gemstar)
C-1	101	and	Abamectin	D-1	104	and	Abamectin
C-2	101	and	Acetamiprid	D-2	104	and	Acetamiprid
C-3	101	and	Amitraz	D-3	104	and	Amitraz
C-4	101	and	Avermectin	D-4	104	and	Avermectin
C-5	101	and	Azadirachtin	D-5	104	and	Azadirachtin
C-6	101	and	Beta-cyfluthrin	D-6	104	and	Beta-cyfluthrin
C-7	101	and	Bifenthrin	D-7	104	and	Bifenthrin
C-8	101	and	Buprofezin	D-8	104	and	Buprofezin
C-9	101	and	Cartap	D-9	104	and	Cartap
C-10	101	and	Chlorantraniliprole	D-10	104	and	Chlorantraniliprole
C-11	101	and	Chlorfenapyr	D-11	104	and	Chlorfenapyr
C-12	101	and	Chlorpyrifos	D-12	104	and	Chlorpyrifos
C-13	101	and	Clothianidin	D-13	104	and	Clothianidin

Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent	Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent
C-14	101	and	Cyfluthrin	D-14	104	and	Cyfluthrin
C-15	101	and	Cyhalothrin	D-15	104	and	Cyhalothrin
C-16	101	and	Cypermethrin	D-16	104	and	Cypermethrin
C-17	101	and	Cyromazine	D-17	104	and	Cyromazine
C-18	101	and	Deltamethrin	D-18	104	and	Deltamethrin
C-19	101	and	Dieldrin	D-19	104	and	Dieldrin
C-20	101	and	Dinotefuran	D-20	104	and	Dinotefuran
C-21	101	and	Diofenolan	D-21	104	and	Diofenolan
C-22	101	and	Enamectin	D-22	104	and	Enamectin
C-23	101	and	Endosulfan	D-23	104	and	Endosulfan
C-24	101	and	Esfenvalerate	D-24	104	and	Esfenvalerate
C-25	101	and	Ethiprole	D-25	104	and	Ethiprole
C-26	101	and	Fenothiocarb	D-26	104	and	Fenothiocarb
C-27	101	and	Fenoxycarb	D-27	104	and	Fenoxycarb
C-28	101	and	Fenvalerate	D-28	104	and	Fenvalerate
C-29	101	and	Fipronil	D-29	104	and	Fipronil
C-30	101	and	Flonicamid	D-30	104	and	Flonicamid
C-31	101	and	Flubendiamide	D-31	104	and	Flubendiamide
C-32	101	and	Flufenoxuron	D-32	104	and	Flufenoxuron
C-33	101	and	Hexaflumuron	D-33	104	and	Hexaflumuron
C-34	101	and	Hydramethylnon	D-34	104	and	Hydramethylnon
C-35	101	and	Imidacloprid	D-35	104	and	Imidacloprid
C-36	101	and	Indoxacarb	D-36	104	and	Indoxacarb
C-37	101	and	Lambda-cyhalothrin	D-37	104	and	Lambda-cyhalothrin
C-38	101	and	Lufenuron	D-38	104	and	Lufenuron
C-39	101	and	Metaflumizone	D-39	104	and	Metaflumizone
C-40	101	and	Methomyl	D-40	104	and	Methomyl
C-41	101	and	Methoprene	D-41	104	and	Methoprene
C-42	101	and	Methoxyfenozide	D-42	104	and	Methoxyfenozide
C-43	101	and	Nitenpyram	D-43	104	and	Nitenpyram
C-44	101	and	Nithiazine	D-44	104	and	Nithiazine
C-45	101	and	Novaluron	D-45	104	and	Novaluron
C-46	101	and	Oxamyl	D-46	104	and	Oxamyl
C-47	101	and	Pymetrozine	D-47	104	and	Pymetrozine
C-48	101	and	Pyrethrin	D-48	104	and	Pyrethrin
C-49	101	and	Pyridaben	D-49	104	and	Pyridaben
C-50	101	and	Pyridalyl	D-50	104	and	Pyridalyl

Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent	Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent
C-51	101	and	Pyriproxyfen	D-51	104	and	Pyriproxyfen
C-52	101	and	Ryanodine	D-52	104	and	Ryanodine
C-53	101	and	Spinetoram	D-53	104	and	Spinetoram
C-54	101	and	Spinosad	D-54	104	and	Spinosad
C-55	101	and	Spirodiclofen	D-55	104	and	Spirodiclofen
C-56	101	and	Spiromesifen	D-56	104	and	Spiromesifen
C-57	101	and	Tebufenozide	D-57	104	and	Tebufenozide
C-58	101	and	Thiacloprid	D-58	104	and	Thiacloprid
C-59	101	and	Thiamethoxam	D-59	104	and	Thiamethoxam
C-60	101	and	Thiodicarb	D-60	104	and	Thiodicarb
C-61	101	and	Thiosultap-sodium	D-61	104	and	Thiosultap-sodium
C-62	101	and	Tralomethrin	D-62	104	and	Tralomethrin
C-63	101	and	Triazamate	D-63	104	and	Triazamate
C-64	101	and	Triflumuron	D-64	104	and	Triflumuron
C-65	101	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>	D-65	104	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>
C-66	101	and	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin	D-66	104	and	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin
C-67	101	and	NPV (e.g., Gemstar)	D-67	104	and	NPV (e.g., Gemstar)
E-1	8	and	Abamectin	F-1	10	and	Abamectin
E-2	8	and	Acetamiprid	F-2	10	and	Acetamiprid
E-3	8	and	Amitraz	F-3	10	and	Amitraz
E-4	8	and	Avermectin	F-4	10	and	Avermectin
E-5	8	and	Azadirachtin	F-5	10	and	Azadirachtin
E-6	8	and	Beta-cyfluthrin	F-6	10	and	Beta-cyfluthrin
E-7	8	and	Bifenthrin	F-7	10	and	Bifenthrin
E-8	8	and	Buprofezin	F-8	10	and	Buprofezin
E-9	8	and	Cartap	F-9	10	and	Cartap
E-10	8	and	Chlorantraniliprole	F-10	10	and	Chlorantraniliprole
E-11	8	and	Chlorfenapyr	F-11	10	and	Chlorfenapyr
E-12	8	and	Chlorpyrifos	F-12	10	and	Chlorpyrifos
E-13	8	and	Clothianidin	F-13	10	and	Clothianidin
E-14	8	and	Cyfluthrin	F-14	10	and	Cyfluthrin
E-15	8	and	Cyhalothrin	F-15	10	and	Cyhalothrin
E-16	8	and	Cypermethrin	F-16	10	and	Cypermethrin
E-17	8	and	Cyromazine	F-17	10	and	Cyromazine
E-18	8	and	Deltamethrin	F-18	10	and	Deltamethrin
E-19	8	and	Dieldrin	F-19	10	and	Dieldrin

Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent	Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent
E-20	8	and	Dinotefuran	F-20	10	and	Dinotefuran
E-21	8	and	Diofenolan	F-21	10	and	Diofenolan
E-22	8	and	Emamectin	F-22	10	and	Emamectin
E-23	8	and	Endosulfan	F-23	10	and	Endosulfan
E-24	8	and	Esfenvalerate	F-24	10	and	Esfenvalerate
E-25	8	and	Ethiprole	F-25	10	and	Ethiprole
E-26	8	and	Fenothiocarb	F-26	10	and	Fenothiocarb
E-27	8	and	Fenoxycarb	F-27	10	and	Fenoxycarb
E-28	8	and	Fenvalerate	F-28	10	and	Fenvalerate
E-29	8	and	Fipronil	F-29	10	and	Fipronil
E-30	8	and	Flonicamid	F-30	10	and	Flonicamid
E-31	8	and	Flubendiamide	F-31	10	and	Flubendiamide
E-32	8	and	Flufenoxuron	F-32	10	and	Flufenoxuron
E-33	8	and	Hexaflumuron	F-33	10	and	Hexaflumuron
E-34	8	and	Hydramethylnon	F-34	10	and	Hydramethylnon
E-35	8	and	Imidacloprid	F-35	10	and	Imidacloprid
E-36	8	and	Indoxacarb	F-36	10	and	Indoxacarb
E-37	8	and	Lambda-cyhalothrin	F-37	10	and	Lambda-cyhalothrin
E-38	8	and	Lufenuron	F-38	10	and	Lufenuron
E-39	8	and	Metaflumizone	F-39	10	and	Metaflumizone
E-40	8	and	Methomyl	F-40	10	and	Methomyl
E-41	8	and	Methoprene	F-41	10	and	Methoprene
E-42	8	and	Methoxyfenozide	F-42	10	and	Methoxyfenozide
E-43	8	and	Nitenpyram	F-43	10	and	Nitenpyram
E-44	8	and	Nithiazine	F-44	10	and	Nithiazine
E-45	8	and	Novaluron	F-45	10	and	Novaluron
E-46	8	and	Oxamyl	F-46	10	and	Oxamyl
E-47	8	and	Pymetrozine	F-47	10	and	Pymetrozine
E-48	8	and	Pyrethrin	F-48	10	and	Pyrethrin
E-49	8	and	Pyridaben	F-49	10	and	Pyridaben
E-50	8	and	Pyridalyl	F-50	10	and	Pyridalyl
E-51	8	and	Pyriproxyfen	F-51	10	and	Pyriproxyfen
E-52	8	and	Ryanodine	F-52	10	and	Ryanodine
E-53	8	and	Spinetoram	F-53	10	and	Spinetoram
E-54	8	and	Spinosad	F-54	10	and	Spinosad
E-55	8	and	Spirodiclofen	F-55	10	and	Spirodiclofen
E-56	8	and	Spiromesifen	F-56	10	and	Spiromesifen

Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent	Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent
E-57	8	and	Tebufenozide	F-57	10	and	Tebufenozide
E-58	8	and	Thiacloprid	F-58	10	and	Thiacloprid
E-59	8	and	Thiamethoxam	F-59	10	and	Thiamethoxam
E-60	8	and	Thiodicarb	F-60	10	and	Thiodicarb
E-61	8	and	Thiosultap-sodium	F-61	10	and	Thiosultap-sodium
E-62	8	and	Tralomethrin	F-62	10	and	Tralomethrin
E-63	8	and	Triazamate	F-63	10	and	Triazamate
E-64	8	and	Triflumuron	F-64	10	and	Triflumuron
E-65	8	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>	F-65	10	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>
E-66	8	and	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin	F-66	10	and	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin
E-67	8	and	NPV (e.g., Gemstar)	F-67	10	and	NPV (e.g., Gemstar)
G-1	41	and	Abamectin	H-1	51	and	Abamectin
G-2	41	and	Acetamiprid	H-2	51	and	Acetamiprid
G-3	41	and	Amitraz	H-3	51	and	Amitraz
G-4	41	and	Avermectin	H-4	51	and	Avermectin
G-5	41	and	Azadirachtin	H-5	51	and	Azadirachtin
G-6	41	and	Beta-cyfluthrin	H-6	51	and	Beta-cyfluthrin
G-7	41	and	Bifenthrin	H-7	51	and	Bifenthrin
G-8	41	and	Buprofezin	H-8	51	and	Buprofezin
G-9	41	and	Cartap	H-9	51	and	Cartap
G-10	41	and	Chlorantraniliprole	H-10	51	and	Chlorantraniliprole
G-11	41	and	Chlorfenapyr	H-11	51	and	Chlorfenapyr
G-12	41	and	Chlorpyrifos	H-12	51	and	Chlorpyrifos
G-13	41	and	Clothianidin	H-13	51	and	Clothianidin
G-14	41	and	Cyfluthrin	H-14	51	and	Cyfluthrin
G-15	41	and	Cyhalothrin	H-15	51	and	Cyhalothrin
G-16	41	and	Cypermethrin	H-16	51	and	Cypermethrin
G-17	41	and	Cyromazine	H-17	51	and	Cyromazine
G-18	41	and	Deltamethrin	H-18	51	and	Deltamethrin
G-19	41	and	Dieldrin	H-19	51	and	Dieldrin
G-20	41	and	Dinotefuran	H-20	51	and	Dinotefuran
G-21	41	and	Diofenolan	H-21	51	and	Diofenolan
G-22	41	and	Emamectin	H-22	51	and	Emamectin
G-23	41	and	Endosulfan	H-23	51	and	Endosulfan
G-24	41	and	Esfenvalerate	H-24	51	and	Esfenvalerate
G-25	41	and	Ethiprole	D-25	51	and	Ethiprole

Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent	Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent
G-26	41	and	Fenothiocarb	H-26	51	and	Fenothiocarb
C-27	41	and	Fenoxycarb	D-27	51	and	Fenoxycarb
G-28	41	and	Fenvalerate	H-28	51	and	Fenvalerate
G-29	41	and	Fipronil	H-29	51	and	Fipronil
G-30	41	and	Flonicamid	H-30	51	and	Flonicamid
G-31	41	and	Flubendiamide	H-31	51	and	Flubendiamide
G-32	41	and	Flufenoxuron	H-32	51	and	Flufenoxuron
G-33	41	and	Hexaflumuron	H-33	51	and	Hexaflumuron
G-34	41	and	Hydramethylnon	H-34	51	and	Hydramethylnon
G-35	41	and	Imidacloprid	H-35	51	and	Imidacloprid
G-36	41	and	Indoxacarb	H-36	51	and	Indoxacarb
G-37	41	and	Lambda-cyhalothrin	H-37	51	and	Lambda-cyhalothrin
G-38	41	and	Lufenuron	H-38	51	and	Lufenuron
G-39	41	and	Metaflumizone	H-39	51	and	Metaflumizone
G-40	41	and	Methomyl	H-40	51	and	Methomyl
G-41	41	and	Methoprene	H-41	51	and	Methoprene
G-42	41	and	Methoxyfenozide	H-42	51	and	Methoxyfenozide
G-43	41	and	Nitenpyram	H-43	51	and	Nitenpyram
G-44	41	and	Nithiazine	H-44	51	and	Nithiazine
G-45	41	and	Novaluron	H-45	51	and	Novaluron
G-46	41	and	Oxamyl	H-46	51	and	Oxamyl
G-47	41	and	Pymetrozine	H-47	51	and	Pymetrozine
G-48	41	and	Pyrethrin	H-48	51	and	Pyrethrin
G-49	41	and	Pyridaben	H-49	51	and	Pyridaben
G-50	41	and	Pyridalyl	H-50	51	and	Pyridalyl
G-51	41	and	Pyriproxyfen	H-51	51	and	Pyriproxyfen
G-52	41	and	Ryanodine	H-52	51	and	Ryanodine
G-53	41	and	Spinetoram	H-53	51	and	Spinetoram
G-54	41	and	Spinosad	H-54	51	and	Spinosad
G-55	41	and	Spirodiclofen	H-55	51	and	Spirodiclofen
G-56	41	and	Spiromesifen	H-56	51	and	Spiromesifen
G-57	41	and	Tebufenozide	H-57	51	and	Tebufenozide
G-58	41	and	Thiacloprid	H-58	51	and	Thiacloprid
G-59	41	and	Thiamethoxam	H-59	51	and	Thiamethoxam
G-60	41	and	Thiodicarb	H-60	51	and	Thiodicarb
G-61	41	and	Thiosultap-sodium	H-61	51	and	Thiosultap-sodium
G-62	41	and	Tralomethrin	H-62	51	and	Tralomethrin

Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent	Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent
G-63	41	and	Triazamate	H-63	51	and	Triazamate
G-64	41	and	Triflumuron	H-64	51	and	Triflumuron
G-65	41	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>	H-65	51	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>
G-66	41	and	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin	H-66	51	and	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin
G-67	41	and	NPV (e.g., Gemstar)	H-67	51	and	NPV (e.g., Gemstar)

Na tabela B acima:

onde está escrito “*mixture*”, lê-se “mistura”;

onde está escrito “*and*”, lê-se “e”;

onde está escrito “*Invertebrate Pest Control Agent*”, lê-se “Agente de controle de praga invertebrada”;

onde está escrito “*e.g.*”, lê-se “por exemplo”; e

onde está escrito “*sodium*”, lê-se “sódio”

[0207] As misturas específicas relacionadas na Tabela B tipicamente combinam composto da Fórmula 1 com o outro agente de pragas invertebradas nas razões especificadas na Tabela A.

[0208] As pragas invertebradas são controladas em aplicações agronômicas e não agronômicas por meio da aplicação de um ou mais compostos de acordo com a presente invenção, tipicamente na forma de composição, em quantidade biologicamente eficaz, ao ambiente das pragas que inclui o local de infestação agronômico e/ou não agronômico, à área a ser protegida ou diretamente sobre as pragas a serem controladas.

[0209] Desta forma, a presente invenção compreende método de controle de pragas invertebradas em aplicações agronômicas e/ou não agronômicas, que compreende o contato da praga invertebrada ou seu ambiente com quantidade biologicamente eficaz de um ou mais dos compostos de acordo com a presente invenção, ou com composição que compreende pelo menos um desses compostos ou composição que compreende pelo menos um desses compostos e quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um agente ou

composto biologicamente ativo adicional. Exemplos de composições apropriadas que compreendem composto de acordo com a presente invenção e quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional incluem composições granulares, em que o composto ativo adicional está presente sobre o mesmo grânulo do composto de acordo com a presente invenção ou sobre grânulos separados do composto de acordo com a presente invenção.

[0210] Para atingir contato com composto ou composição de acordo com a presente invenção para proteger safra de campo contra pragas invertebradas, o composto ou a composição é aplicada tipicamente à semente da safra antes do plantio, à folhagem (tal como folhas, hastes, flores, frutos) de plantas de safra ou ao solo ou outro meio de crescimento antes ou depois do plantio da safra.

[0211] Uma realização de método de contato é por meio de pulverização. Alternativamente, composição granular que compreende composto de acordo com a presente invenção pode ser aplicada à folhagem da planta ou ao solo. Os compostos de acordo com a presente invenção podem também ser efetivamente fornecidos por meio de absorção da planta por contato da planta com composição que compreende composto de acordo com a presente invenção aplicado na forma de encharcamento de solo com formulação líquida, formulação granular ao solo, tratamento de caixa de mudas ou mergulhamento de transplantes. Merece observação composição de acordo com a presente invenção na forma de formulação líquida para encharcamento de solo. Também merece observação método de controle de pragas invertebradas que compreende o contato da praga invertebrada ou seu ambiente com quantidade biologicamente eficaz de composto de acordo com a presente invenção ou com composição que compreende quantidade biologicamente eficaz de composto de acordo com a presente invenção. Merece observação adicional o método em que o ambiente é solo e a composição

é aplicada ao solo na forma de formulação de encharcamento de solo. Merece observação adicional que compostos de acordo com a presente invenção também são eficazes por meio de aplicação localizada ao local de infestação. Outros métodos de contato incluem a aplicação de composto ou composição de acordo com a presente invenção por meio de pulverizações diretas e residuais, pulverizações aéreas, géis, revestimentos de sementes, microencapsulações, absorção sistêmica, iscas, marcas de orelhas, misturas, nebulizadores, fumigantes, aerossóis, pós e muitos outros. Uma realização de método de contato é grânulo, bastão ou pastilha fertilizante com dimensões estáveis que compreende composto ou composição de acordo com a presente invenção. Os compostos de acordo com a presente invenção podem também ser impregnados em materiais para a fabricação de dispositivos de controle de invertebrados (tais como redes contra insetos).

[0212] Os compostos de acordo com a presente invenção também são úteis em tratamentos de sementes para proteger sementes contra pragas invertebradas. No contexto do presente relatório descritivo e reivindicações, o tratamento de semente indica o contato da semente com quantidade biologicamente eficaz de composto de acordo com a presente invenção, que é tipicamente formulado na forma de composição de acordo com a presente invenção. Este tratamento de semente protege a semente contra pragas invertebradas do solo e geralmente pode também proteger raízes e outras partes da planta em contato com o solo da muda em desenvolvimento a partir da semente em germinação. O tratamento de sementes pode também fornecer proteção da folhagem por meio de translocação do composto de acordo com a presente invenção ou segundo ingrediente ativo na planta em desenvolvimento. Tratamentos de sementes podem ser aplicados a todos os tipos de sementes, incluindo aquelas das quais germinarão plantas geneticamente transformadas para expressar características especializadas. Exemplos representativos incluem

as que expressam proteínas tóxicas para pragas invertebradas, tais como toxina de *Bacillus thuringiensis* ou as que expressam resistência a herbicidas tais como glifosato acetiltransferase, que fornece resistência a glifosato.

[0213] Um método de tratamento de sementes é por meio de pulverização ou polvilhamento da semente com composto de acordo com a presente invenção (ou seja, na forma de composição formulada) antes do plantio das sementes. Composições formuladas para o tratamento de sementes geralmente compreendem agente adesivo ou formador de filme. Portanto, composição de revestimento de sementes de acordo com a presente invenção compreende tipicamente quantidade biologicamente eficaz de composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal e formador de filme ou agente adesivo. As sementes podem ser revestidas por meio de pulverização de concentrado em suspensão fluida diretamente para leito de tombamento de sementes e secagem das sementes em seguida. Alternativamente, outros tipos de formulação tais como pós umedecidos, soluções, suspoemulsões, concentrados emulsionáveis e emulsões em água podem ser pulverizados sobre a semente. Este processo é particularmente útil para aplicação de revestimentos de filme sobre sementes. Vários processos e máquinas de revestimento são disponíveis para os técnicos no assunto. Processos apropriados incluem os relacionados em P. Kusters *et al*, *Seed Treatment: Progress and Prospects*, Monografia BCPC 1994 nº 57, e referências ali relacionadas.

[0214] A semente tratada compreende tipicamente composto de acordo com a presente invenção em quantidade de cerca de 0,1 g a 1 kg por 100 kg de sementes (ou seja, cerca de 0,0001 a 1% em peso da semente antes do tratamento). Suspensão fluida formulada para tratamento de sementes compreende tipicamente cerca de 0,5 a cerca de 70% do ingrediente ativo, cerca de 0,5 a cerca de 30% de adesivo formador de filme, cerca de 0,5 a cerca de 20% de agente dispersante, 0 a cerca de 5%

de espessante, 0 a cerca de 5% de pigmento e/ou tinta, 0 a cerca de 2% de agente antiespumante, 0 a cerca de 1% de conservante e 0 a cerca de 75% de diluente líquido volátil.

[0215] Os compostos de acordo com a presente invenção podem ser incorporados a composição de isca que é consumida por pragas invertebradas ou utilizada em dispositivo tal como armadilha, estação de isca e similares. Essa composição de isca pode apresentar-se na forma de grânulos que compreendem (a) ingredientes ativos, nomeadamente quantidade biologicamente eficaz de composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal, (b) um ou mais materiais alimentícios, opcionalmente (c) um atrativo e, opcionalmente, (d) um ou mais umectantes. Merecem observação grânulos ou composições de isca que compreendem cerca de 0,001 a 5% de ingredientes ativos, cerca de 40 a 99% de material alimentício e/ou atrativo, e, opcionalmente, cerca de 0,05 a 10% de umectantes, que são eficazes no controle de pragas invertebradas do solo em taxas de aplicação muito baixas, particularmente em doses de ingrediente ativo que são letais por ingestão em vez de por contato direto. Alguns materiais alimentícios podem funcionar como fonte de alimento e como atrativo. Os materiais alimentícios incluem carboidratos, proteínas e lipídios. Exemplos de materiais alimentícios são farinha vegetal, açúcar, amidos, gordura animal, óleo vegetal, extratos de levedura e sólidos de leite. Exemplos de atrativos são odorizantes e aromatizantes, tais como extratos de plantas ou de frutas, perfume ou outro componente animal ou vegetal, feromônios ou outros agentes conhecidos por atraírem pragas invertebradas alvo. Exemplos de umectantes, ou seja, agentes retentores de umidade, são glicóis e outros polióis, glicerina e sorbitol. Merece observação composição de isca (e método de uso dessa composição de isca) utilizada para controlar pelo menos uma praga invertebrada selecionada a partir do grupo que consiste de formigas, cupins e baratas. Dispositivo de controle de pragas invertebradas pode compreender a

composição de isca do presente e abrigo adaptado para receber a composição de isca, em que o abrigo possui pelo menos uma abertura dimensionada para permitir que a praga invertebrada passe através da abertura, de forma que a praga invertebrada possa ganhar acesso à composição de isca a partir de local fora do abrigo e em que o abrigo é adicionalmente adaptado para colocação em local de atividade conhecida ou potencial para a praga invertebrada.

[0216] Os compostos de acordo com a presente invenção podem ser aplicados sem outros adjuvantes, mas mais freqüentemente a aplicação será de formulação que compreende um ou mais ingredientes ativos com veículos, diluentes e tensoativos apropriados e, possivelmente, em combinação com alimento, dependendo do uso final contemplado. Um método de aplicação envolve a pulverização de dispersão em água ou solução de óleo refinado de composto de acordo com a presente invenção. Combinações com óleos de pulverização, concentrações de óleo de pulverização, adesivos espalhantes, adjuvantes, outros solventes e sinérgicos tais como butóxido de piperonila freqüentemente aumentam a eficácia do composto. Para usos não agronômicos, essas pulverizações podem ser aplicadas a partir de recipientes de pulverização tais como lata, garrafa ou outro recipiente, seja por meio de bomba ou de sua liberação de recipiente pressurizado, tal como lata de pulverização de aerossol pressurizada. Essas composições de pulverização podem assumir várias formas, tais como pulverizações, névoas, espumas, fumaças ou neblina. Essas composições de pulverização podem compreender adicionalmente, portanto, propelentes, agentes espumantes etc., conforme venha a ser o caso. Merece observação composição de pulverização que compreende quantidade biologicamente eficaz de composto ou composição de acordo com a presente invenção e veículo. Uma realização dessa composição de pulverização compreende quantidade biologicamente eficaz de composto ou composição de acordo com a presente invenção e propelente. Os propelentes representativos

incluem, mas sem limitar-se a metano, etano, propano, butano, isobutano, buteno, pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrofluorcarbonos, clorofluorcarbonos, dimetil éter e misturas dos acima. Merece observação composição de pulverização (e método que utiliza essa composição de pulverização liberada de recipiente de pulverização) utilizada para controlar pelo menos uma praga invertebrada selecionada a partir do grupo que consiste de mosquitos, moscas negras, moscas dos estábulos, moscas dos cervos, moscas dos cavalos, vespas, vespas americanas, vespões, carrapatos, aranhas, formigas, mosquitos e similares, incluindo individualmente ou em combinações.

[0217] Aplicações não agronômicas incluem a proteção de animais, particularmente vertebrados, mais particularmente vertebrados homeotérmicos (tal como mamíferos ou pássaros) e, ainda mais particularmente, mamíferos, contra pragas parasíticas invertebradas por meio da administração de quantidade eficaz como parasiticida (ou seja, biologicamente eficaz) de composto de acordo com a presente invenção, tipicamente na forma de composição formulada para uso veterinário, ao animal a ser protegido. Merece observação, portanto, método de proteção de animais que compreende a administração ao animal de quantidade eficaz como parasiticida de um composto de acordo com a presente invenção. Conforme indicado no presente relatório descritivo e nas reivindicações, as expressões “parasiticida” e “como parasiticida” indicam efeitos observáveis sobre pragas parasitas invertebradas para fornecer proteção de animal contra a praga. Os efeitos parasiticidas referem-se tipicamente à redução da ocorrência ou atividade da praga parasítica invertebrada alvo. Esses efeitos sobre a praga incluem necrose, morte, crescimento retardado, redução da mobilidade ou redução da capacidade de permanecer no animal hospedeiro ou sobre ele, redução da alimentação e inibição da reprodução. Estes efeitos sobre pragas parasitas

invertebradas fornecem controle (incluindo prevenção, redução ou eliminação) de infestação parasítica ou infecção do animal. Exemplos de pragas parasíticas invertebradas controladas por meio da administração de quantidade eficaz como parasiticida de composto de acordo com a presente invenção a animais a serem protegidos incluem ectoparasitas (artrópodes, acarinas etc.) e endoparasitas (helmíntios, tais como nematóides, trematóides, céstodes, acantocéfalos etc.). Particularmente, os compostos de acordo com a presente invenção são eficazes contra ectoparasitas, incluindo: moscas tais como *Haematobia (Lyperosia) irritans* (mosca do chifre), *Stomoxys calcitrans* (mosca dos estábulos), *Simulium spp* (mosca negra), *Glossina spp* (mosca tse-tsé), *Hydrotaea irritans* (mosca da cabeça), *Musca autumnalis* (mosca da face), *Musca domestica* (mosca doméstica), *Morellia simplex* (mosca do suor), *Tabanus spp* (mosca dos cavalos), *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Lucilia sericata*, *Lucilia cuprina* (mosca do sopro verde), *Calliphora spp* (mosca do sopro), *Protophormia spp*, *Oestrus ovis* (mosca do berne nasal), *Culicoides spp* (mosquito pólvora), *Hippobosca equine*, *Gastrophilus intestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* e *Gastrophilus nasalis*; piolhos, tais como *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Bovicola equi*, *Haematopinus asini*, *Felicola subrostratus*, *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* e *Trichodectes canis*; piolhos tais como *Melophagus ovinus*; ácaros, tais como *Psoroptes spp*, *Sarcoptes scabiei*, *Chorioptes bovis*, *Demodex equi*, *Cheyletiella spp*, *Notoedres cati*, *Trombicula spp* e *Otodectes cyanotis* (ácaros dos ouvidos); percevejos, tais como *Ixodes spp*, *Boophilus spp*, *Rhipicephalus spp*, *Amblyomma spp*, *Dermacentor spp*, *Hyalomma spp* e *Haemaphysalis spp*; e pulgas tais como *Ctenocephalides felis* (pulga dos gatos) e *Ctenocephalides canis* (pulga dos cães).

[0218] Aplicações não agronômicas no setor veterinário têm lugar por meios convencionais, tais como por meio de administração enteral na forma de, por exemplo, pastilhas, cápsulas, bebidas, preparações de encharcamento, granulados, pastas, misturas, procedimentos de alimentação ou supositórios; por meio de administração parenteral, tal como por injeção (incluindo intramuscular, subcutânea, intravenosa, intraperitoneal), implantes; por administração nasal; por administração local, tal como na forma de imersão ou mergulhamento, pulverização, lavagem, revestimento com pó ou aplicação a pequena área do animal e por meio de artigos tais como coleiras, marcas na orelha, fitas na cauda, fitas de medição dos membros ou cabrestos que compreendem compostos ou composições de acordo com a presente invenção.

[0219] Tipicamente, composição parasiticida de acordo com a presente invenção compreende mistura de composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal, com um ou mais veículos farmacêutica ou veterinariamente aceitáveis que compreendem excipientes e auxiliares selecionados com relação à via de administração pretendida (tal como administração oral, local ou parenteral como injeção) e de acordo com a prática padrão. Além disso, veículo apropriado é selecionado com base na compatibilidade com um ou mais ingredientes ativos na composição, incluindo considerações tais como estabilidade com relação ao pH e teor de umidade. Merece observação, portanto, composição de proteção de animal contra pragas parasitas invertebradas que compreende quantidade eficaz como parasiticida de composto de acordo com a presente invenção e pelo menos um veículo.

[0220] Para administração parenteral, incluindo injeção intravenosa, intramuscular e subcutânea, composto de acordo com a presente invenção pode ser formulado em suspensão, solução ou emulsão em veículos oleosos ou aquosos e pode conter adjuntos tais como agentes de suspensão, estabilização e/ou dispersão. Composições farmacêuticas para injeção incluem

soluções aquosas de formas hidrossolúveis de ingredientes ativos (tais como sal de composto ativo), preferencialmente em tampões fisiologicamente compatíveis que contêm outros excipientes ou auxiliares, conforme conhecido na técnica de formulação farmacêutica.

[0221] Para administração oral incluindo soluções (a forma mais facilmente disponível de absorção), emulsões, suspensões, pastas, géis, cápsulas, pastilhas, misturas, pós, grânulos, blocos de retenção no rume e blocos de alimentação/água/lambertura, composto de acordo com a presente invenção pode ser formulado com aglutinantes/cargas conhecidos na técnica que sejam apropriados para composições para administração oral, tais como açúcares (como lactose, sacarose, manitol, sorbitol), amido (tais como amido de milho, amido de trigo, amido de arroz, amido de batata), celulose e derivados (tais como metilcelulose, carboximetilcelulose, etil hidroxicelulose), derivados de proteína (tais como zeína e gelatina) e polímeros sintéticos (tais como álcool polivinílico, polivinilpirrolidona). Se desejado, lubrificantes (tais como estearato de magnésio), agentes desintegrantes (tais como polivinilpirrolidinona reticulada, agar, ácido algínico) e tinturas ou pigmentos podem ser adicionados. Pastas e géis freqüentemente também contêm adesivos (tais como acácia, ácido algínico, bentonita, celulose, goma xantana, silicato de alumínio e magnésio coloidal) para ajudar a manter a composição em contato com a cavidade oral sem ser facilmente ejetada.

[0222] Caso as composições parasitocidas encontrem-se na forma de concentrados alimentares, o veículo é tipicamente selecionado a partir de alimentos de alto desempenho, cereais alimentícios ou concentrados de proteína. Essas composições que contêm concentrado alimentício podem compreender, além dos ingredientes ativos parasitocidas, aditivos que promovam a saúde ou crescimento animal, melhorando a qualidade da carne de animais para abate, ou úteis de outra forma para o acasalamento de animais. Estes

aditivos podem incluir, por exemplo, vitaminas, antibióticos, quimioterapêuticos, bactericidas, fungicidas, coccidicidas e hormônios.

[0223] Revelou-se que os compostos de acordo com a presente invenção possuem propriedades farmacocinéticas e farmacodinâmicas favoráveis, fornecendo disponibilidade sistêmica a partir de administração oral e ingestão. Após a ingestão pelo animal a ser protegido, portanto, concentrações eficazes como parasitocidas de compostos de acordo com a presente invenção no fluxo sangüíneo protegem o animal tratado contra pragas sugadoras de sangue, tais como pulgas, camundongos e piolhos. Merece observação, portanto, composição de proteção de animais contra pragas parasitas invertebradas em forma para administração oral (ou seja, que compreendem, além de quantidade eficaz como parasitocida de composto de acordo com a presente invenção, um ou mais veículos selecionados a partir de aglutinantes e cargas apropriadas para administração oral e veículos de concentrados alimentícios).

[0224] Formulações para administração local encontram-se tipicamente na forma de pó, creme, suspensão, pulverização, emulsão, espuma, pasta, aerossol, unguento, pomada ou gel. Mais tipicamente, formulação local é solução hidrossolúvel, que pode apresentar-se na forma de concentrado que é diluído antes do uso. As composições parasitocidas apropriadas para administração local compreendem tipicamente composto de acordo com a presente invenção e um ou mais veículos apropriados para uso local. Em aplicações de composição parasitocida localmente ao lado externo de animais tal como linha ou ponto (ou seja, tratamento “de ponto”), espera-se que o ingrediente ativo migre sobre a superfície do ativo para cobrir, no todo ou em sua maior parte, a sua extensão externa. Como resultado, o animal tratado é particularmente protegido contra pragas invertebradas, o que afasta da epiderme do animal, por exemplo, percevejos, pulgas e piolhos. Formulações para

administração localizada compreendem freqüentemente, portanto, pelo menos um solvente orgânico para facilitar o transporte do ingrediente ativo sobre a pele e/ou a penetração na epiderme do animal. Solventes comumente utilizados como veículos nessas formulações incluem propileno glicol, parafinas, aromáticos, ésteres tais como miristato de isopropila, glicol éteres e álcoois, tais como etanol e *n*-propanol.

[0225] A taxa de aplicação necessária para controle efetivo (ou seja, “quantidade biologicamente eficaz”) dependerá de fatores tais como a espécie de invertebrado a ser controlada, o ciclo de vida da praga, estágio de vida, seu tamanho, localização, época do ano, animal ou safra hospedeira, comportamento alimentar, comportamento de acasalamento, umidade ambiente, temperatura e similares. Sob circunstâncias normais, taxas de aplicação de cerca de 0,01 a 2 kg de ingrediente ativo por hectare são suficientes para controlar pragas em ecossistemas agronômicos, mas até 0,0001 kg/hectare podem ser suficientes ou até 8 kg/hectare podem ser necessários. Para aplicações não agronômicas, taxas de uso eficazes variarão de cerca de 1,0 a 50 mg/metro quadrado, mas até 0,1 mg/metro quadrado podem ser suficientes ou até 150 mg/metro quadrado podem ser necessários. Os técnicos no assunto podem determinar facilmente a quantidade biologicamente eficaz necessária para o nível desejado de controle de pragas invertebradas.

[0226] Geralmente, para uso veterinário, composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal é administrado em quantidade eficaz como parasiticida a animal a ser protegido contra pragas parasitas invertebradas. Quantidade eficaz como parasiticida é a quantidade de ingrediente ativo necessária para atingir efeito observável de redução da ocorrência ou atividade da praga parasita invertebrada alvo. Os técnicos no assunto apreciarão que a dose eficaz como parasiticida pode variar para os diversos compostos e composições de acordo com a presente invenção, o efeito parasiticida e a duração desejada, a espécie

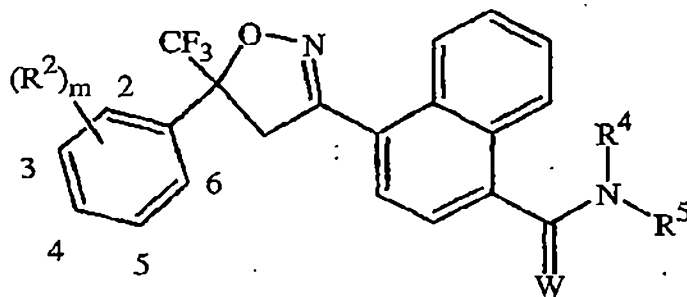
de praga invertebrada alvo, o animal a ser protegido, o modo de aplicação e similares, e a quantidade necessária para atingir resultado específico pode ser determinada por meio de simples experimentação.

[0227] Para administração oral a animais homeotérmicos, a dosagem diária de composto de acordo com a presente invenção varia tipicamente de cerca de 0,01 mg/kg a cerca de 100 mg/kg, mais tipicamente cerca de 0,5 mg/kg a cerca de 100 mg/kg, de peso do corpo do animal. Para administração local (tal como dérmica), mergulhantes e pulverizadores contêm tipicamente cerca de 0,5 ppm a cerca de 5000 ppm, mais tipicamente cerca de 1 ppm a cerca de 3000 ppm, de composto de acordo com a presente invenção.

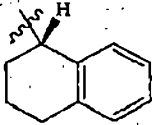
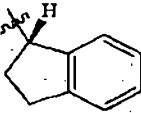
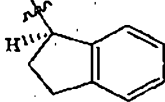
[0228] As abreviações a seguir são utilizadas nas Tabelas Índice A a C que se seguem: *i* é iso, *t* é terc, *c* é ciclo, Me é metila, Et é etila, *c*-Pr é ciclopropila e *t*-Bu é *terc*-butila. Naftila indica naftalenila. (*R*) ou (*S*) indica a quiralidade absoluta do centro de carbono assimétrico. A abreviação “Ex.” representa “Exemplo” e é seguida por número que indica em qual exemplo é preparado o composto. Na Tabela Índice A, (R^2)_m indica a combinação de (R^2)_n com casos de CR² para B¹, B² e B³.

TABELA ÍNDICE A

em que m é 1, 2, 3, 4 ou 5.



Compound	W	(R ²) _m	R ⁴	R ⁵	m.p. (°C)
1 (Ex. 1)	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CF ₃	**
2 (Ex. 2)	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -2-pyridinyl	**
3	O	H	H	CH ₂ CF ₃	*
4	O	H	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
5	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -phenyl	*
6	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -3-pyridinyl	*
7	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -4-pyridinyl	*
8 (Ex. 3)	S	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -2-pyridinyl	**
9	O	3-Cl, 5-Cl	Me	Et	*
10	O	3-Cl, 5-Cl	H	Et	*
11	O	3-Cl, 5-Cl	CO ₂ Me	CH ₂ -2-pyridinyl	*
12	O	3-Cl, 5-Cl	H	Me	*
13	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	*
14	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂ .HCl	*
15	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-phenyl	*
16	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH(CH ₃) ₂	*
17	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(CH ₃)-phenyl	*
Compound	W	(R ²) _m	R ⁴	R ⁵	m.p. (°C)
18	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂	*
19	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ C≡CH	*
20	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ - <i>n</i> -Pr	*
21	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH(CH ₃)-2-pyridinyl	*
22	O	3-Me, 5-Me	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
23	O	3-Cl, 4-Cl	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
24	O	3-F, 5-F	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
25	O	3-Cl	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
26	O	3-Br, 5-Br	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
27	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-2-naphthyl	*
28	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-NO ₂ -phenyl)	*
29	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(CO ₂ CH ₃)-phenyl	*
30	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-Cl-phenyl)	*
31	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-F-phenyl)	*
32	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	*
33	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	*
34	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)- <i>i</i> -Bu	*
35	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ OH	*
36	O	3-Cl, 5-Cl	H	H	*
37	O	3-Cl, 5-Cl		-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -	*

Compound	W	(R ²) _m	R ⁴	R ⁵	m.p. (°C)
38	O	3-Cl, 5-Cl	H		*
39	O	3-Cl, 5-Cl	H		*
40	O	3-Cl, 5-Cl	H		*
41	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	*
42	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ Et	*
43	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ H	*
44	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ Na	*
45	O	3-Cl, 5-Cl	H	NHC(=O)Me	*
46	O	3-Cl, 5-Cl	H	NH-phenyl	*
47	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ NH ₂	*
48	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(Me)CO ₂ Me	*
49	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(<i>i</i> -Pr)CO ₂ Me	*
50	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₅ NH ₂	*
51	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CONHCH ₂ CF ₃	*
52	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CN	*
53	O	3-Cl, 5-Cl	H	NH-2-pyridinyl	*

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

** Vide Exemplos para dados de NMR ¹H.

Na tabela acima:

onde está escrito “*compound*” lê-se “composto”;

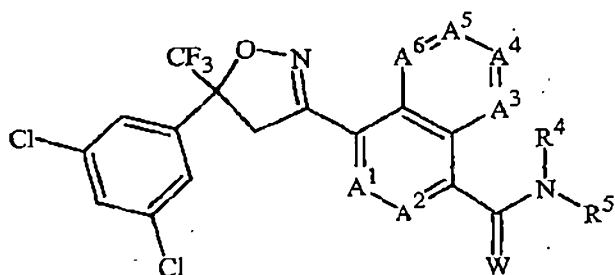
onde está escrito “*m.p.*” lê-se “ponto de fusão”;

onde está escrito “*pyridinyl*” lê-se “piridinila”;

onde está escrito “*phenyl*” lê-se “fenila”;

onde está escrito “*naphthyl*” lê-se “naftila”.

TABELA ÍNDICE B



Compound	W	A ¹	A ²	A ³	A ⁴	A ⁵	A ⁶	R ⁴	R ⁵	m.p. (°C)
101	O	N	CH	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
102	O	CH	N	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
Compound	W	A ¹	A ²	A ³	A ⁴	A ⁵	A ⁶	R ⁴	R ⁵	m.p. (°C)
103 (Ex. 4)	O	CH	CH	N	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	**
104 (Ex. 5)	O	CH	CH	CH	N	CH	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	**
105	O	CH	CH	CH	CH	N	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
106	O	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
107	O	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ CF ₃	*
108	S	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
109	S	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ CF ₃	*
110	O	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
111	O	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ CF ₃	*

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

** Vide Exemplos para dados de NMR ¹H.

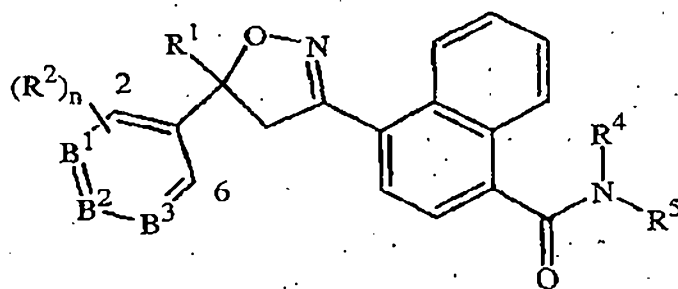
Na tabela acima:

onde está escrito “*compound*” lê-se “composto”;

onde está escrito “*m.p.*” lê-se “ponto de fusão”; e

onde está escrito “*pyridinyl*” lê-se “piridinila”;

TABELA ÍNDICE C



Compound	B ¹	B ²	B ³	(R ²) _n	R ⁴	R ⁵	m.p. (°C)
201	C-Cl	N	CH	H	H	CH ₂ CF ₃	*
202	C-Cl	N	CH	H	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*

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

Na tabela acima:

onde está escrito “*compound*” lê-se “composto”;

onde está escrito “*m.p.*” lê-se “ponto de fusão”; e

onde está escrito “*pyridinyl*” lê-se “piridinila”;

TABELA ÍNDICE D

Comp. nº	Dados de NMR ¹H (solução de CDCl₃ a menos que indicado em contrário)^a
3	δ 8,67 (d, 1H), 8,06 (d, 1H), 7,66-7,45 (m, 7H), 7,39 (d, 1H), 7,29 (d, 1H), 6,78 (br s, 1H), 4,19 (d, 1H), 4,15 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
4	δ 8,82 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,35 (d, 1H), 7,71-7,44 (m, 11H), 7,35 (d, 1H), 7,20 (dd, 1H), 4,83 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,95 (d, 1H).
5	δ 8,78 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,64-7,30 (m, 12H), 6,40 (br t, 1H), 4,71 (d, 2H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
6	δ 8,72 (d, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,49 (dd, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,60-7,52 (m, 4H), 7,45 (m, 2H), 7,36 (d, 1H), 7,27 (m, 1H), 6,93 (br t, 1H), 4,66 (d, 2H), 4,21 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
7	δ 8,72 (d, 1H), 8,50 (d, 2H), 8,19 (d, 1H), 7,61-7,54 (m, 4H), 7,47 (m, 2H), 7,37 (d, 1H), 7,23 (d, 2H), 7,02 (br t, 1H), 4,66 (d, 2H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
9	δ 8,88 (m, 1H), 7,83 (m, 1H), 7,66-7,40 (m, 7H), 4,27 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,80-3,66 e 3,09 (m, 2H), 3,22 e 2,74 (s, 3H), 1,01 e 1,36 (t, 3H).
10	δ 8,78 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,64-7,42 (m, 7H), 6,08 (br s, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,58 (m, 2H), 1,31 (t, 3H).
11	δ 8,92 (d, 1H), 8,63 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,74-7,53 (m, 7H), 7,45 (t, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 5,33 (s, 2H), 4,29 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,43 (s, 3H).
12	δ 8,77 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,63-7,55 (m, 5H), 7,44 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,18 (br s, 1H), 4,23 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 3,07 (d, 3H).
13	δ 8,78 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,39-7,62 (m, H), 6,77 (br s, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,58 (q, 2H), 2,53 (t, 2H), 2,25 (s, 6H).
15	δ 8,63 (dd, 1H), 8,00 (dd, 1H), 7,56 (s, 2H), 7,47-7,16 (m, 9H), 6,78 (dd, 1H), 5,34 (m, 1H), 4,14 (dd, 1H), 3,80 (dd, 1H), 1,60 (d, 3H).
16	δ 8,80 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,66-7,45 (m, 7H), 5,87 (d, 1H), 4,41 (m, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,33 (d, 6H).
17	δ 8,77 (d, 1H), 8,19 (dd, 1H), 7,63-7,30 (m, 12H), 6,30 (d, 1H), 5,44 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 1,67 (d, 1H).

Comp. nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
18	δ 8,80 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,67-7,45 (m, 7H), 6,15 (br t, 1H), 5,99 (m, 1H), 5,31 (d, 1H), 5,24 (d, 1H), 4,25 (d, 1H), 4,17 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
19	δ 8,77 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,64-7,56 (m, 4H), 7,50 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 6,38 (br t, 1H), 4,33 (dd, 2H), 4,23 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 2,32 (t, 1H).
20	δ 8,82 (d, 1H), 8,29 (d, 1H), 7,67-7,45 (m, 7H), 6,14 (br s, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,42 (dd, 2H), 1,12 (m, 1H), 0,59 (m, 2H), 0,32 (m, 2H).
21	δ 8,82 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,72 (dt, qH), 7,67-7,57 (m, 6H), 7,50 (d, 1H), 7,45 (dd, 1H), 7,34 (d, 1H), 7,21 (dd, 1H), 5,45 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 1,66 (d, 3H).
22	δ 8,85 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,36 (d, 1H), 7,72-7,57 (m, 4H), 7,51 (d, 1H), 7,45 (br t, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,25 (s, 2H), 7,21 (dd, 1H), 7,07 (s, 1H), 4,85 (d, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,94 (d, 1H), 2,38 (s, 6H).
23	δ 8,81 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,78-7,46 (m, 9H), 7,36 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
24	δ 8,83 (d, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,39 (d, 1H), 7,74-7,22 (m, H), 6,91 (dt, 1H), 4,87 (d, 2H), 4,27 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
25	δ 8,83 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,73-7,41 (m, 10H), 7,37 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 4,86 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).
26	δ 8,82 (d, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 7,76 (s, 2H), 7,74-7,59 (m, H), 7,52 (d, 1H), 7,44 (br t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 4,87 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
27	δ 8,76 (d, 1H), 8,19 (dd, 1H), 7,87-7,36 (m, 14H), 6,46 (d, 1H), 5,59 (m, 1H), 4,20 (d, 1H), 3,84 (d, 1H), 1,73 (d, 3H).
28	δ 8,77 (d, 1H), 8,23 (d, 2H), 8,14 (dd, 1H), 7,66-7,44 (m, 9H), 6,45 (d, 1H), 5,47 (m, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,66 (d, 3H).
29	δ 8,80 (d, 1H), 8,28 (d, 1H), 7,66-7,37 (m, H), 6,99 (d, 1H), 5,87 (d, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,80 (s, 3H).
30	δ 8,76 (d, 1H), 8,14 (dd, 1H), 7,63-7,35 (m, 1H), 6,35 (d, 1H), 5,38 (m, 1H), 4,21 (d, 1H), 3,85 (d, 1H), 1,62 (d, 3H).

Comp. nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
31	δ 8,76 (d, 1H), 8,16 (dd, 1H), 7,64-7,38 (m, 9H), 7,07 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 6,30 (d, 1H), 5,41 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 1,64 (d, 3H).
32	δ 8,81 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67-7,45 (m, 7H), 5,78 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,25 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,63 (m, 2H), 1,30 (d, 3H), 1,04 (t, 3H).
33	δ 8,81 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67-7,45 (m, 7H), 5,78 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,25 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,63 (m, 2H), 1,30 (d, 3H), 1,04 (t, 3H).
34	δ 8,80 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,68-7,46 (m, 7H), 5,80 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,23 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,24 (d, 3H), 1,01 (s, 9H).
35	δ 8,65 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,52-7,44 (m, 7H), 7,27 (d, 1H), 7,19 (d, 1H), 6,93 (br t, 1H), 4,16 (d, 1H), 3,81 (d, 1H), 3,73 (s br, 2H), 3,53 (m, 2H), 3,27 (br s, 1H).
36	δ 8,75 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,63-7,35 (m, 7H), 6,69 (br s, 1H), 6,32 (br s, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
38	δ 8,79 (m, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,64-7,12 (m, 1H), 6,29 (dd, 1H), 5,50 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 2,82 (m, 2H), 2,24 (m, 1H), 2,05 (m, 1H), 1,91 (m, 2H).
39	δ 8,80 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,65-7,25 (m, H), 6,28 (d, 1H), 5,79 (q, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 3,92-3,07 (m, 2H), 2,77 (m, 1H), 1,99 (m, 1H).
40	δ 8,81 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,67-7,26 (m, H), 6,26 (d, 1H), 5,80 (q, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,09-2,93 (m, 2H), 2,79 (m, 1H), 1,99 (m, 1H).
41	δ 8,82 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,67-7,46 (m, 7H), 6,40 (br t, 1H), 4,25 (d, 1H), 3,89 (d, 1H), 3,75 (q, 2H), 3,63 (dd, 2H), 3,39 (s, 3H).
42	δ 8,84 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,67-7,46 (m, 7H), 6,53 (br t, 1H), 4,33 (d, 2H), 4,29 (q, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 1,34 (t, 3H).
43	DMSO- d_6 : δ 9,02 (t, 1H), 8,81 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,83 (t, 1H), 7,74-7,65 (m, 5H), 4,58 (d, 1H), 4,54 (d, 1H), 4,02 (d, 2H).
44	DMSO- d_6 : δ 8,86 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 7,96-7,67 (m, 8H), 4,61 (s aparente, 2H), 3,64 (d, 2H).
45	DMSO- d_6 : δ 10,44 (s, 1H), 10,10 (s, 1H), 8,86 (d, 1H), 8,46 (d, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,90 (t, 1H), 7,76 (m, 5H), 4,63 (d, 1H), 4,59 (d, 1H), 2,04 (s, 3H).

Comp. nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
46	δ 10,45 (s, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,85-7,63 (m, 7H), 7,22 (t, 2H), 6,90 (d, 2H), 6,78 (t, 1H), 4,57 (s aparente, 2H).
47	δ 8,83 (d, 1H), 8,33 (d, 1H), 7,69-7,46 (m, 9H), 6,54 (br s, 1H), 4,27 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,61 (q, 2H), 3,02 (t, 3H).
48	δ 8,83 (d, 1H), 8,35 (d, 1H), 7,68-7,46 (m, 7H), 6,54 (d, 1H), 4,91 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,83 (s, 3H), 1,60 (d, 3H).
49	δ 8,84 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,70-7,46 (m, 7H), 6,46 (d, 1H), 4,91 (dd, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,36 (m, 1H), 1,10 (d, 3H), 0,99 (d, 3H).
50	DMSO- d_6 : δ 8,79 (d, 1H), 8,71 (t, 1H), 8,19 (d, 1H), 8,08 (br s, 2H), 7,90 (d, 1H), 7,84 (dd, 1H), 7,73-7,66 (m, 4H), 7,62 (d, 1H), 4,54 (s aparente, 2H), 3,35 (m, 2H), 2,76 (m, 2H), 1,60 (m, 4H), 1,39 (m, 4H).
51	δ 8,82 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67-7,46 (m, 7H), 7,09 (m, 2H), 4,28 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,96 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
52	δ 8,79 (d, 1H), 8,23 (d, 1H), 7,68-7,46 (m, 7H), 6,53 (br t, 1H), 4,46 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,89 (d, 1H).
53	δ 8,83 (d, 1H), 8,42 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,70-7,55 (m, 7H), 7,50 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 6,84 (dd, 1H), 6,80 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
101	δ 9,24 (d, 1H), 8,75 (s, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,45 (d, 1H), 7,82-7,70 (m, 3H), 7,64 (br s, 1H), 7,58 (s, 2H), 7,44 (t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4,87 (d, 2H).
102	δ 9,63 (d, 1H), 9,04 (br t, 1H), 8,93 (d, 1H), 8,60 (d, 1H), 8,52 (s, 1H), 7,86 (dd, 1H), 7,74 (dd, 1H), 7,69 (dd, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,46 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,31 (d, 1H), 3,94 (d, 1H).
105	δ 10,17 (s, 1H), 8,64 (d, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,73 (dt, 1H), 7,68 (br t, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,56 (s, 2H), 7,46 (t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,27 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).
106	δ 8,95 (dd, 1H), 8,88 (dd, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,72 (dt, 1H), 7,60-7,50 (m, 4H), 7,43 (t, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,72 (d, 1H), 4,42 (d, 1H).

Comp. nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
107	δ 8,89 (dd, 1H), 8,61 (d, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,45 (m, 2H), 6,89 (br t, 1H), 4,68 (d, 1H), 4,32 (d, 1H), 4,18 (m, 2H).
108	δ 9,41 (br s, 1H), 8,91 (dd, 1H), 8,70 (dd, 1H), 8,46 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,75 (dt, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,47 (dd, 1H), 7,43 (t, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 5,14 (d, 2H), 4,68 (d, 1H), 4,39 (d, 1H).
109	δ 8,88 (d, 1H), 8,47 (dd, 1H), 8,12 (br s, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,53 (s, 2H), 7,47 (m, 3H), 4,74 (m, 2H), 4,59 (d, 1H), 4,25 (d, 1H).
110	δ 8,75 (d, 1H), 8,42 (d, 1H), 7,86 (d, 1H), 7,68 (dt, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,55-7,35 (m, 5H), 7,31 (s, 1H), 7,18 (dd, 1H), 4,82 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 2,44 (s, 3H).
111	δ 8,59 (d, 1H), 7,58 (s, 2H), 7,54 (d, 1H), 7,47 (t, 1H), 7,36-7,44 (m, 2H), 7,10 (s, 1H), 6,80 (br t, 1H), 4,20 (d, 1H), 4,08 (m, 2H), 3,86 (d, 1H), 2,23 (s, 3H).
201	δ 8,71 (d, 1H), 8,48 (m, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,55-7,64 (m, 3H), 7,49 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,35 (dd, 1H), 6,74 (t, 1H), 4,24 (d, 1H), 4,17 (m, 2H), 3,83 (d, 1H).
202	δ 8,79 (d, 1H), 8,50 (m, 2H), 8,35 (d, 1H), 7,50-7,72 (m, 7H), 7,47 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,22 (d, 1H), 4,83 (d, 2H), 4,28 (d, 1H), 3,89 (d, 1H).

^a Os dados de NMR ^1H são em ppm campo abaixo a partir de tetrametilsilano. Os acoplamentos são designados por (s) isolado, (d) dupla, (t) trio, (q) quarteto, (m) múltiplo, (dd) par de duplas, (dt) par de trios, (br s) isolado amplo, (br t) trio amplo.

EXEMPLOS BIOLÓGICOS DA INVENÇÃO

[0229] Os Testes a seguir demonstram a eficácia de controle de compostos de acordo com a presente invenção sobre pragas específicas. “Eficácia de controle” representa a inibição do desenvolvimento de pragas invertebradas (incluindo a mortalidade) que causa redução significativa da alimentação. A proteção de controle de pragas gerada pelos compostos não se limita, entretanto, a essas espécies. Vide as Tabelas Índice A a C para descrições de compostos.

TESTE A

[0230] Para avaliar o controle de traça das crucíferas (*Plutella xylostella*), a unidade de teste consistiu de pequeno recipiente aberto com planta de rabanete com doze a quatorze dias de idade no seu interior. Esta foi previamente infestada com cerca de cinquenta larvas neonatais que foram liberadas na unidade de teste por meio de farelos de espiga de milho utilizando inoculador de bazuca. As larvas moveram-se para a planta de teste após serem liberadas para a unidade de teste.

[0231] Compostos de teste foram formulados utilizando solução contendo 10% de acetona, 90% de água e 300 ppm de tensoativo não iônico Fórmula X-77® Spreader Lo-Foam contendo alquilarilpolioxietileno, ácidos graxos livres, glicóis e isopropanol (Loveland Industries, Inc., Greeley, Colorado, Estados Unidos). Os compostos formulados foram aplicados em 1 ml de líquido por meio de bocal atomizador SUJ2 com corpo customizado 1/8 JJ (Spraying Systems Co., Wheaton, Illinois, Estados Unidos) posicionado a 1,27 cm acima do topo de cada unidade de teste. Todos os compostos experimentais nestes testes foram pulverizados a 250 e/ou 50 ppm e o teste foi repetido por três vezes. Após a pulverização do composto de teste formulado, cada unidade de teste foi mantida para secar por uma hora e, em seguida, tampa com tela preta foi colocada sobre o topo. As unidades de teste foram mantidas por seis dias em câmara de crescimento a 25 °C e umidade relativa de 70%. Os danos por alimentação à planta foram determinados visualmente em seguida com base na folhagem consumida e avaliação da mortalidade das pragas também foi contada e calculada para cada unidade de teste.

[0232] Dos compostos da Fórmula 1 testados, os seguintes forneceram níveis muito bons a excelentes de proteção da planta (20% ou menos de danos por alimentação ou 80% ou mais de mortalidade): 1, 2, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 19, 20; 21, 22, 23, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33,

34, 35, 36, 38, 39; 41, 42, 43, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51; 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107*, 108*, 109*, 110, 111; 201 e 202.

* indica níveis muito bons a excelentes de eficácia de controle observados apenas a 250 ppm.

TESTE B

[0233] Para avaliação do controle de lagarta dos cereais de outono (*Spodoptera frugiperda*), a unidade de teste consistiu de pequeno recipiente aberto com planta de milho com quatro a cinco dias de idade no seu interior. Esta foi previamente infestada (utilizando amostrador central) com dez a quinze larvas com um dia de idade sobre um pedaço de alimento de insetos. Compostos de teste foram formulados e pulverizados a 250 e/ou 50 ppm conforme descrito para o Teste A e repetidos por três vezes. Após a pulverização, as unidades de teste foram mantidas em câmara de crescimento e a eficácia de controle foi avaliada em seguida para cada unidade de teste conforme descrito para o Teste A.

[0234] Dos compostos da Fórmula 1 testados, os seguintes forneceram níveis muito bons a excelentes de eficácia de controle (20% ou menos de danos por alimentação ou 80% ou mais de mortalidade): 1, 2, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 19, 20; 21, 22, 23, 25, 26, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 39; 41, 42, 46, 49, 51; 101, 102, 103, 104, 106*, 107*, 110*, 111*; 201 e 202.

* indica níveis muito bons a excelentes de eficácia de controle observados apenas a 250 ppm.

TESTE C

[0235] Para avaliação do controle de gafanhoto da batata (*Empoasca fabae*, Harris) por meio de contato e/ou meios sistêmicos, a unidade de teste consistiu de pequeno recipiente aberto com planta de feijão Soleil com cinco a seis dias de idade (folhas primárias emergiram) no seu interior. Adicionou-se areia branca ao topo do solo e uma das folhas primárias foi extirpada antes da aplicação. Os compostos de teste foram formulados e

pulverizados a 250 e/ou 50 ppm e o teste foi repetido por três vezes conforme descrito para o Teste A. Após a pulverização, as unidades de teste foram mantidas para secar por uma hora antes que fossem infestadas com cinco gafanhotos da batata (adultos com 18 a 21 dias de idade). Tampa preta com tela foi colocada sobre o cilindro. As unidades de teste foram mantidas por seis dias em câmara de crescimento a 19-21 °C e umidade relativa de 50 a 70%. A eficácia de controle de cada unidade de teste foi determinada visualmente em seguida pela mortalidade dos insetos.

[0236] Dos compostos da Fórmula 1 testados, os seguintes forneceram níveis muito bons a excelentes de controle de pragas (80% de mortalidade ou mais): 1, 2, 8, 10, 11, 14*, 15, 16, 18*, 19, 20; 21, 26, 28, 31, 32*, 34, 36, 38; 46*, 101, 102* e 106*.

* indica níveis muito bons a excelentes de eficácia de controle observados apenas a 250 ppm.

TESTE D

[0237] Para avaliação do controle de tripe das flores do oeste (*Frankliniella occidentalis*) por meio de contato e/ou meios sistêmicos, a unidade de teste consistiu de pequeno recipiente aberto com planta de feijão Soleil com cinco a sete dias de idade no seu interior. Os compostos de teste foram formulados e pulverizados a 250 e/ou 50 ppm e o teste foi repetido por três vezes conforme descrito para o Teste A. Após a pulverização, as unidades de teste foram mantidas para secar por uma hora, 22 a 27 tripes adultos foram adicionados em seguida à unidade e tampa com tela preta foi colocada sobre ela. As unidades de teste foram mantidas por seis dias a 25 °C e umidade relativa de 45 a 55%. Foi determinada avaliação de mortalidade junto com avaliação de danos à planta para cada unidade de teste.

[0238] Dos compostos da Fórmula 1 testados, os seguintes forneceram níveis muito bons a excelentes de eficácia de controle (20% ou

menos de danos por alimentação ou 80% ou mais de mortalidade): 1, 2, 8, 10, 11, 13*, 14*, 15*, 16, 18, 19, 20*; 21, 26, 32, 33*, 34*, 35, 39*, 41, 42, 45*, 46*, 47*, 48*, 49, 51, 101 e 104.

* indica níveis muito bons a excelentes de eficácia de controle observados apenas a 250 ppm.

TESTE E

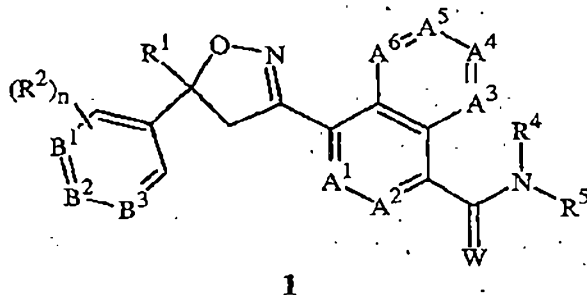
[0239] Para avaliação do controle da pulga dos gatos (*Ctenocephalides felis*, Bouche), camundongo CD-1® (cerca de 30 g, macho, obtido por meio de Charles River Laboratories, Wilmington MA) recebeu dosagem oral de composto de teste em quantidade de 10 mg/kg solubilizada em propileno glicol/glicerol formal (60:40). Duas horas após a administração oral do composto de teste, cerca de oito a dezesseis pulgas adultas foram aplicadas a cada camundongo. As pulgas tiveram avaliada em seguida a mortalidade 48 horas após a aplicação da pulga ao camundongo.

[0240] Dos compostos da testados, os compostos a seguir causaram 30% de mortalidade ou mais: 1*, 2, 10*, 41* e 51*.

* indica que o composto causou 50% de mortalidade ou mais.

REIVINDICAÇÕES

1. COMPOSTO, de fórmula 1 seu *N*-óxido ou sal:



caracterizado pelo fato de que:

- A¹, A², A³, A⁴, A⁵ e A⁶ são selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de CR³ e N, desde que no máximo três dentre A¹, A², A³, A⁴, A⁵ e A⁶ sejam N;
- B¹, B² e B³ são selecionados independentemente a partir do grupo que consiste de CR² e N;
- W é O ou S;
- R¹ é CF₃, CF₂CF₃ e CF(CF₃)₂;
- cada R² é independentemente H, 2-Cl, 3-Cl, 4-Cl, 5-Cl, 2-F, 3-F, 4-F, 5-F, 3-CF₃, 4-CF₃, 5-CF₃, 3-Br, 4-Br, 5-Br, 3-I, 4-I, 3-CN, 4-CN, 3-Me, 4-Me, 3-OMe, 4-OMe, 3-OCF₃ e 4-OCF₃;
- cada R³ é independentemente H, metila e Cl;
- R⁴ é H, metila, CO₂-metila e C(O)-metila;
- R⁵ é CH₂CF₃, CH₂-2-piridinila, CH₂-3-piridinila, CH₂-4-piridinila, H, metila, etila, isopropila, CH₂-fenila, CH₂CO₂-metila, CH₂CN, CH₂-2-tiazolila, CH₂-4-tiazolila, CH₂-5-tiazolila e CH₂C(O)NHCH₂CF₃; ou
- R⁴ e R⁵ são tomados em conjunto com o nitrogênio ao qual são ligados para formar um anel que contém dois a seis átomos de carbono e, opcionalmente, um átomo adicional selecionado a partir do grupo que consiste de N, S e O, em que o mencionado anel é opcionalmente substituído com um a quatro substituintes selecionados independentemente a partir do grupo que

consiste de alquila C₁-C₂, halogênio, -CN, -NO₂ e alcóxi C₁-C₂;

- n é 0, 1 ou 2.

2. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que cada R² é independentemente H, Cl, F, Br, I ou -CN.

3. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 2, caracterizado pelo fato de que:

- B¹, B² e B³ são independentemente CR²;
- W é O;
- R⁴ é H ou metila; e
- R⁵ é H, metila ou etila.

4. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que cada R² é independentemente H, CF₃, OCF₃, Cl, F, Br, I ou -CN, e cada R³ é independentemente H ou metila.

5. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que R⁴ é H e R⁵ é metila ou etila.

6. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 5, caracterizado pelo fato de que:

- R¹ é CF₃;
- A¹, A², A³, A⁴, A⁵ e A⁶ são CR³ cada um;
- B² é CR²; e
- cada R³ é independentemente H ou metila.

7. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 6, caracterizado pelo fato de que:

- B² é CH;
- cada R² é independentemente Cl, F, Br ou I;
- R³ é H;
- R⁵ é CH₂CF₃ ou CH₂-2-piridinila; e

- n é 0.

8. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que é selecionado a partir do grupo que consiste de:

- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- *N*-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalenocarboxamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- *N*-(2-piridinilmetil)-1-naftalenocarboxamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- *N*-(2-piridinilmetil)-1-naftalenocarbotioamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- *N*-etil-1-naftalenocarboxamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- *N*-(2-metoxietil)-1-naftalenocarboxamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- *N*-[2-(2,2,2-trifluoroetil)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida;
- 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- *N*-(2-piridinilmetil)-8-quinolinocarboxamida;
- 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- *N*-(2-piridinilmetil)-8-isoquinolinocarboxamida; e
- 1-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]
- *N*-(2-piridinilmetil)-4-isoquinolinocarboxamida.

9. COMPOSIÇÃO, caracterizada pelo fato de que compreende um composto conforme a reivindicação 1 e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativo, diluente sólido e diluente líquido, em que a mencionada composição opcionalmente compreende ainda pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional.

10. COMPOSIÇÃO DE CONTROLE DE PRAGAS INVERTEBRADAS, caracterizada pelo fato de que compreende uma quantidade

biologicamente eficaz de composto conforme definido na reivindicação 1 e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de tensoativo, diluente sólido e diluente líquido, em que a mencionada composição opcionalmente compreende ainda uma quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional.

11. COMPOSIÇÃO, de acordo com a reivindicação 10, caracterizada pelo fato de que o pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é selecionado a partir do grupo que consiste de abamectina, acefato, acetamiprida, acetoprol, aldicarb, amidoflomet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfós-metil, bifentrina, bifenazato, bistrifluron, buprofezina, carbofuran, cartap, chinometionat, clorfenapir, clorfluazuron, cloranthraniliprol, clorpirifós, clorpirifós-metil, clorobenzilato, cromafenozida, clotianidina, ciflumetofen, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, gama-cialotrina, lambda-cialotrina, cihexatina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuron, diazinon, dicofol, dieldrin, dienoclor, diflubenzuron, dimeflutrina, dimetoato, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvalerato, etiprol, etoxazol, fenamifós, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvalerato, fipronil, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim, flufenoxuron, fonofós, halofenozida, hexaflumuron, hexitiazox, hidrametilnon, imiciafós, imidacloprid, indoxacarb, isofenfós, lufenuron, malation, metaflumizona, metaldeído, metamidofós, metidation, metomil, metoprene, metoxiclor, metoxifenoazida, metoflutrina, monocrotofós, nitenpiram, nitiazina, novaluron, noviflumuron, oxamil, paration, paration-metil, permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofós, proflutrina, propargita, protrifenbute, pimetozina, pirafluprol, piretrina, piridaben, piridalil, pirifluquinazon, piriprol, piriproxifen, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramato, sulprofós, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzuron, teflutrina,

terbufós, tetraclorvinfós, tiacloprida, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap de sódio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfon, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subespécie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespécie *kurstaki*, nucleopoliedrovírus, delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*, bacilovírus, bactérias entomopatogênicas, vírus entomopatogênicos e fungos entomopatogênicos.

12. COMPOSIÇÃO, de acordo com a reivindicação 11, caracterizada pelo fato de que o pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é selecionado a partir do grupo que consiste de abamectina, acetamiprida, amitraz, avermectina, azadiractina, bifentrina, buprofezina, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifós, clotianidina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, lambda-cialotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronil, flonicamida, flubendiamida, flufenoxuron, hexaflumuron, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizona, metomil, metoprene, metoxifenoizida, nitenpiram, nitiazina, novaluron, oxamil, pimetozina, piretrina, piridaben, piridalil, piriproxifen, rianodina, espinoteram, espinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, tebufenoizida, tiacloprida, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap de sódio, tralometrina, triazamato, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subespécie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespécie *kurstaki*, nucleopoliedrovírus e delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*.

13. COMPOSIÇÃO, de acordo com a reivindicação 10, caracterizada pelo fato de ser na forma de formulação líquida para encharcamento de solo.

14. COMPOSIÇÃO DE PULVERIZAÇÃO, para controlar pragas invertebradas, caracterizada pelo fato de que compreende:

(a) uma quantidade biologicamente eficaz do composto

conforme definido na reivindicação 1 ou da composição conforme definida na reivindicação 10; e

(b) um propelente.

15. COMPOSIÇÃO DE ISCA, para controle de pragas invertebradas, caracterizada pelo fato de que compreende:

(a) uma quantidade biologicamente eficaz do composto conforme definido na reivindicação 1 ou da composição conforme definida na reivindicação 10;

(b) um ou mais materiais alimentícios;

(c) opcionalmente um atrativo; e

(d) opcionalmente um umectante.

16. DISPOSITIVO DE ARMADILHA, para controle de pragas invertebradas, caracterizado pelo fato de que compreende:

(a) a composição de isca conforme definida na reivindicação 15;

e

(b) um abrigo adaptado para receber a composição de isca, em que o abrigo possui pelo menos uma abertura dimensionada para permitir a passagem da praga invertebrada através da abertura, de forma que a praga invertebrada possa ter acesso à composição de isca a partir de local fora do abrigo e em que o abrigo é adicionalmente adaptado para que seja colocado em local de atividade conhecida ou de atividade potencial da praga invertebrada ou perto deste local.

17. MÉTODO DE CONTROLE DE PRAGAS INVERTEBRADAS, caracterizado pelo fato de que compreende o contato da praga invertebrada ou seu ambiente com quantidade biologicamente eficaz de composto conforme definido na reivindicação 1.

18. MÉTODO DE CONTROLE DE PRAGAS INVERTEBRADAS, caracterizado pelo fato de que compreende o contato da

praga invertebrada ou seu ambiente com a composição conforme definida na reivindicação 10.

19. MÉTODO, de acordo com a reivindicação 18, caracterizado pelo fato de que o ambiente é solo e a composição é aplicada ao solo na forma de formulação de encharcamento do solo.

20. MÉTODO, de controle de baratas, formigas ou cupins, caracterizado pelo fato de que compreende o contato da barata, formiga ou cupim com a composição de isca em um dispositivo de armadilha conforme definido na reivindicação 16.

21. MÉTODO, de controle de mosquitos, moscas pretas, moscas dos estábulos, moscas dos cervos, moscas dos cavalos, vespas, vespas americanas, vespões, carrapatos, aranhas, formigas ou mosquitos, caracterizado pelo fato de que compreende o contato de mosquitos, moscas pretas, moscas dos estábulos, moscas dos cervos, moscas dos cavalos, vespas, vespas americanas, vespões, carrapatos, aranhas, formigas ou mosquitos com a composição de pulverização conforme definida na reivindicação 14 liberada a partir de recipiente de pulverização.

22. MÉTODO DE PROTEÇÃO DE SEMENTES CONTRA PRAGAS INVERTEBRADAS, caracterizado pelo fato de que compreende o contato da semente com uma quantidade biologicamente eficaz de composto conforme definido na reivindicação 1.

23. MÉTODO, de acordo com a reivindicação 22, caracterizado pelo fato de que a semente é revestida com o composto conforme definido na reivindicação 1, formulado na forma de composição que compreende agente formador de filme ou adesivo.

24. SEMENTE REVESTIDA, caracterizada pelo fato de que compreende um composto conforme definido na reivindicação 1 em quantidade de cerca de 0,0001 a 1% em peso da semente antes do tratamento.

25. COMPOSIÇÃO DE PROTEÇÃO DE ANIMAIS CONTRA PRAGAS PARASÍTICAS INVERTEBRADAS, caracterizada pelo fato de que compreende quantidade parasiticidamente eficaz de composto conforme definido na reivindicação 1 e pelo menos um veículo.

26. COMPOSIÇÃO, de acordo com a reivindicação 25, caracterizada pelo fato de ser em uma forma para administração oral.