

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

(21) PI0710403-0 A2



* B R P I 0 7 1 0 4 0 3 A 2 *

(22) Data de Depósito: 13/04/2007
(43) Data da Publicação: 09/08/2011
(RPI 2118)

(51) Int.CI.:

C07D 231/06 2006.01
C07D 401/04 2006.01
C07D 401/12 2006.01
C07D 401/14 2006.01
C07D 403/10 2006.01
A01N 43/40 2006.01
A01N 43/50 2006.01
A01N 43/653 2006.01

(54) Título: COMPOSTO COMPOSIÇÃO,
COMPOSIÇÃO DE CONTROLE, DE PULVERIZAÇÃO,
DE ISCA, DISPOSITIVO DE ARMADILHA, MÉTODOS
DE CONTROLE, MÉTODOS DE PROTEÇÃO,
SEMENTE TRATADA, COMPOSIÇÃO DE PROTEÇÃO

(30) Prioridade Unionista: 20/04/2006 US 60/793.576

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

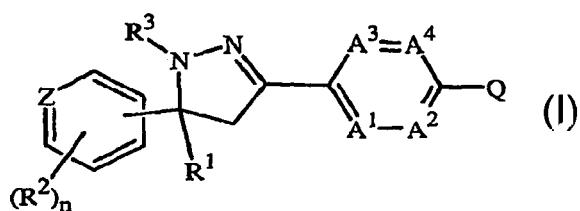
(72) Inventor(es): Brenton Todd Smith, STEPHEN FREDERICK MCCANN

(74) Procurador(es): Cristiane Araújo Rodrigues

(86) Pedido Internacional: PCT US2007009184 de 13/04/2007

(87) Publicação Internacional: WO 2007/123855de 01/11/2007

(57) Resumo: COMPOSTO, COMPOSIÇÃO, COMPOSIÇÃO DE CONTROLE, DE PULVERIZAÇÃO, DE ISCA, DISPOSITIVO DE ARMADILHA, MÉTODOS DE CONTROLE, MÉTODOS DE PROTEÇÃO, SEMENTE TRATADA, COMPOSIÇÃO DE PROTEÇÃO. São descritos compostos da Fórmula 1, incluindo todos os seus isômeros geométricos e estereoisômeros, N-óxidos e sais, em que Z é N ou CR²; R¹ é ciano; ou 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 R¹⁷; R³ é H, ciano ou -CHO; ou alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, fenila, alquilcarbonila C₂-C₆, alcoxcarbonila C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆ ou dialquilaminocarbonila C₃-C₉, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹⁸; Q é um heterocírculo saturado ou insaturado com cinco ou seis membros opcionalmente substituído; ou Q é C(O)NR¹²R¹³, C(S)NR¹²R¹³, S(O) 2NR¹⁴R¹⁵ ou R¹⁶; e R², R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, A¹, A², A³, A⁴ e n são conforme definido no relatório descritivo. Também são descritas composições que contêm os compostos da Fórmula 1 e métodos de controle de pragas invertebradas que compreendem o contato da praga invertebrada ou seu ambiente com uma quantidade biologicamente eficaz de um composto ou composição de acordo com a presente invenção.





PI0710403-0

**“COMPOSTO, COMPOSIÇÃO, COMPOSIÇÃO DE CONTROLE, DE
PULVERIZAÇÃO, DE ISCA, DISPOSITIVO DE ARMADILHA, MÉTODOS DE
CONTROLE, MÉTODOS DE PROTEÇÃO, SEMENTE TRATADA,
COMPOSIÇÃO DE PROTEÇÃO”**

5

CAMPO DA INVENÇÃO

A presente invenção refere-se a certas pirazolininas, 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 10 não agronômicos.

10

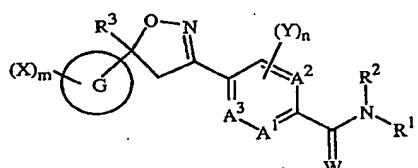
ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

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 15 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 20 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.

25

A Patente PCT n° WO 05/085216 descreve derivados de

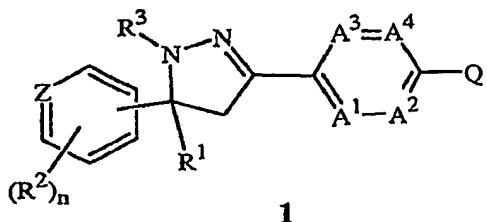
isoxazolina da Fórmula 1 como inseticidas:



em que, entre outros, cada um dentre A¹, A² e A³ são independentemente C ou N; G é um anel de benzeno; W é O ou S; e X é halogênio ou haloalquila C₁-C₆.

DESCRÍÇÃO RESUMIDA DA INVENÇÃO

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



em que:

- Z é N ou CR²;
- A¹ é CR⁴ ou N;
- A² é CR⁵ ou N;
- A³ é CR⁶ ou N;
- A⁴ é CR⁷ ou N;
- Q é um heterociclo saturado ou insaturado com cinco ou seis membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de 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-C₈, ciano, nitro, C(O)NR⁸R⁹, C(O)OR¹⁰, fenila e piridinila, em que cada fenila e piridinila é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹¹;
- ou

- Q é $C(O)NR^{12}R^{13}$, $C(S)NR^{12}R^{13}$, $S(O)_2NR^{14}R^{15}$ ou R^{16} ;
- R^1 é ciano; ou alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquicicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^{17} ;
 - cada R^2 é, independentemente, H, halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfínila C₁-C₆, haloalquilsulfínila C₁-C₆, alquilsulfônila C₁-C₆, haloalquilsulfônila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈, 10 alcoxícarbonila C₂-C₄, alquilaminocarbonila C₂-C₄, dialquilaminocarbonila C₃-C₉, ciano ou nitro;
 - R^3 é H, ciano ou -CHO; ou alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquicicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, fenila, alquilcarbonila C₂-C₆, alcoxícarbonila C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆ 15 ou dialquilaminocarbonila C₃-C₉, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R^{18} ;
 - R^4 , R^5 , R^6 e R^7 são selecionados independentemente a partir de H, halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, 20 haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfínila C₁-C₆, haloalquilsulfínila C₁-C₆, alquilsulfônila C₁-C₆, haloalquilsulfônila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈, ciano e nitro; ou
 - R^6 e R^7 são tomados em conjunto para formar um anel aromático fundido, em que o anel aromático fundido contém como membros de 25 anéis, além dos átomos de cabeça de ponte A³ e A⁴, três átomos selecionados a partir de um a dois átomos de carbono, zero a dois átomos de nitrogênio, zero a um átomo de oxigênio e zero a um átomo de enxofre ou quatro átomos selecionados a partir de dois a quatro átomos de carbono e zero a dois átomos

de nitrogênio;

- cada R⁸, R¹² e R¹⁴ é independentemente H, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, alquilcarbonila C₂-C₇,
5 alcoxialquila C₂-C₆ ou aloxicarbonila C₂-C₇;
- cada R⁹, R¹⁰, R¹³ e R¹⁵ é independentemente H, 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 R¹⁹;
- 10 - cada R¹¹, R²³ e R²⁴ é independentemente 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, alquilaminossulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈, aloxicarbonila C₂-C₄, ciano ou nitro;
- 15 - R¹⁶ é 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-C₈, ciano ou nitro;
- 20 - cada R¹⁷ e R¹⁸ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, ciano ou nitro;
- cada R¹⁹ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆,
25 alquilcarbonila C₂-C₆, aloxicarbonila C₂-C₆, trialquilsilila C₃-C₆, ciano, nitro ou Q¹;
- cada Q¹ é independentemente fenila ou um heterociclo saturado ou insaturado com cinco ou seis membros, cada qual opcionalmente

substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de 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-C₈, ciano, nitro, C(O)NR²⁰R²¹, C(O)OR²², fenila e piridinila, em que cada fenila e piridinila é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R²³;

5 - cada R²⁰ é independentemente H, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, alcoxialquila C₂-C₆, alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcoxicarbonila C₂-C₇;

10 - cada R²¹ e R²² é independentemente H, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, fenila ou piridinila; em que cada fenila ou piridinila é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R²⁴; e

15 - n é 1, 2, 3 ou 4.

A presente invenção também fornece uma composição que

20 compreende um composto da Fórmula 1, seu N-óxido ou sal e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de um tensoativo, um diluente sólido e um diluente líquido. Em uma realização, a presente invenção também fornece uma composição de controle de pragas invertebradas que compreende uma quantidade biologicamente eficaz de um

25 composto da Fórmula 1, seu N-óxido ou sal e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste de um tensoativo, diluente sólido e diluente líquido, em que a mencionada composição compreende ainda opcionalmente uma quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um

agente ou composto biologicamente ativo adicional.

A presente invenção também fornece uma composição de pulverização para controle de pragas invertebradas que compreende uma quantidade biologicamente eficaz de um composto da Fórmula 1, um de seus sais ou *N*-óxidos ou da composição descrita acima e um propelente. A presente invenção também fornece uma composição de isca para controlar pragas invertebradas que compreende uma quantidade biologicamente eficaz de um composto da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal, ou das composições descritas nas realizações acima, um ou mais materiais alimentícios, opcionalmente um atrativo e opcionalmente um umectante.

A presente invenção fornece ainda um dispositivo de armadilha para controle de pragas invertebradas que compreende a mencionada composição de isca e um 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 um local fora do abrigo e em que o abrigo é adicionadamente adaptado para colocação em um local de atividade conhecida ou potencial para as pragas invertebradas ou perto dele.

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

e um diluente líquido, em que a mencionada composição compreende ainda opcionalmente uma quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional.

A presente invenção também fornece um método de proteção de 5 sementes contra pragas invertebradas que compreende o contato da semente com uma quantidade biologicamente eficaz de um composto da Fórmula 1, seu N-óxido ou sal (tal como uma composição descrita no presente). A presente invenção também se refere à semente tratada. A presente invenção fornece ainda um método de proteção de animais contra pragas parasitas 10 invertebradas que compreende a administração ao animal de uma quantidade eficaz como parasiticida de um composto da Fórmula 1, seu N-óxido ou sal (tal como uma composição descrita no presente).

DESCRÍÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO

Da forma utilizada no presente, as expressões “compreende”, 15 “que comprehende”, “inclui”, “que inclui”, “tem”, “que tem”, “contém”, “que contém” ou qualquer de suas variações destinam-se a cobrir uma inclusão não exclusiva. Uma 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 20 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. Uma 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 25 é verdadeiro (ou presente) ou ambos, A e B, são verdadeiros (ou presentes).

Além disso, os artigos indefinidos “um” e “uma” que precedem um elemento ou componente de acordo com a presente invenção destinam-se a ser não restritivos com relação ao número de casos (ou seja, ocorrências) do

elemento ou componente. “Um” ou “uma”, 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.

5 Conforme indicado na presente, a expressão “praga invertebrada” inclui artrópodes, gastrópodes e nematóides de importância econômica como pragas. O termo “artrópode” inclui insetos, ácaros, aranhas, escorpiões, centopéias, miríápodes, cochonilhas e afídeos. O termo “gastrópode” inclui caracóis, lesmas e outros estiliomatóforos. O termo “helmíntios” inclui vermes 10 do filo dos nematelmíntios, platielmíntios e acantocéfalos tais como vermes redondos, parasitas cardíacos e nematóides fitófagos (nematóides), fascíolas (trematóides), céstodes (céstodes) e ctenóforos.

No contexto do presente relatório descritivo, “controle de pragas 15 invertebradas” indica a inibição do desenvolvimento de pragas invertebradas (incluindo mortalidade, redução da alimentação e/ou rompimento do acasalamento) e expressões relativas são definidas de forma análoga.

O termo “agronômico” indica a produção de safras de campo, tais 20 como para alimentos e fibras, e inclui o crescimento de safras de milho, soja e outros legumes, arroz, cereais (tais como trigo, aveia, cevada, centeio, arroz e milho), vegetais folhosos (tais como alface, repolho e outras safras de couve), legumes frutíferos (tais como tomates, pimenta, berinjela, crucíferas e abóboras), batatas, batatas doces, uvas, algodão, árvores frutíferas (tais como frutas em pomos, drupas e cítricas), frutas pequenas (bagas, cerejas) e outras safras especializadas (tais como canola, girassol, azeitonas). A expressão “não 25 agronômico” indica aplicações em outras safras hortícolas (tais como plantas de estufa, mudas ou ornamentais não cultivadas em um 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, administração de vegetação e agroflorestal, saúde pública (humana) e saúde animal (tal como animais domesticados como animais domésticos, animais de criação e aves, animais não domesticados tais como 5 vida selvagem).

Nas descrições acima, o termo “alquila”, utilizado isoladamente ou em palavras compostas tais como “alquiltio” ou “haloalquila”, inclui alquila de cadeia linear ou ramificado, tal como metila, etila, *n*-propila, *i*-propila ou os diferentes isômeros de butila, pentila ou hexila. “Alquenila” inclui alquenos de cadeia linear ou ramificados tais como etenila, 1-propenila, 2-propenila e os diferentes isômeros de butenila, pentenila e hexenila. “Alquenila” também inclui polienos tais como 1,2-propadienila e 2,4-hexadienila. “Alquinila” inclui alquinas de cadeia linear ou ramificadas tais como etinila, 1-propinila, 2-propinila e os diferentes isômeros de butinila, pentinila e hexinila. “Alquinila” pode também 10 incluir porções que compreendem diversas uniões triplas múltiplas, tais como 15 2,5-hexadiinila.

“Alcóxi” inclui, por exemplo, metóxi, etóxi, *n*-propilóxi, isopropilóxi e os diferentes isômeros de butóxi, pentóxi e hexilóxi. O termo “alcoxialquila” indica substituição alcóxi sobre uma porção alquila. Exemplos de “alcoxialquila” 20 incluem metoximetila, 1-etoxietila, etoximetila e *t*-butoximetila. “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 um grupo alquilsulfinila. Exemplos de “alquilsulfinila” 25 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 30 hexilsulfonila.

análoga aos exemplos acima. Exemplos de “alquilaminossulfonila” incluem CH₃NHS(O)₂⁻, CH₃CH₂NHS(O)₂⁻, CH₃CH₂CH₂NHS(O)₂⁻, (CH₃)₂CHNHS(O)₂⁻ e os diferentes isômeros de butilamino ou pentilaminossulfonila. “Cicloalquila” inclui, por exemplo, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila e ciclohexila. O termo “alquilcicloalquila” indica substituição alquila sobre uma porção cicloalquila e inclui, por exemplo, etilciclopropila, *i*-propilciclobutila, 3-metilciclopentila e 4-metilciclohexila. O termo “cicloalquilalquila” indica substituição cicloalquila sobre uma porção alquila. Exemplos de “cicloalquilalquila” incluem ciclopropilmetila, ciclopentiletila e outras porções cicloalquila unidas a grupos alquila de cadeia reta ou ramificados. 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 F₃C-, ClCH₂⁻, CF₃CH₂⁻ e CF₃CCl₂⁻. Os termos “halocicloalquila”, “haloalcóxi”, “haloalquiltio” e similares são definidos de forma análoga ao termo “haloalquila”. Exemplos de “haloalcóxi” incluem CF₃O-, CCl₃CH₂O-, HCF₂CH₂CH₂O- e CF₃CH₂O-. Exemplos de “haloalquiltio” incluem CCl₃S-, CF₃S-, CCl₃CH₂S- e ClCH₂CH₂CH₂S-. Exemplos de “haloalquilsulfinila” incluem CF₃S(O)-, CCl₃S(O)-, CF₃CH₂S(O)- e CF₃CF₂S(O)-. Exemplos de “haloalquilsulfonila” incluem CF₃S(O)₂⁻, CCl₃S(O)₂⁻, CF₃CH₂S(O)₂⁻ e 25 CF₃CF₂S(O)₂⁻.

“Alquilcarbonila” indica porções alquila de cadeia linear ou ramificada unidas a uma porção C(=O). Exemplos de “alquilcarbonila” incluem CH₃C(O)-, CH₃CH₂CH₂C(O)- e (CH₃)₂CHC(O)-. Exemplos de “alcoxicarbonila”

incluem $\text{CH}_3\text{OC(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC(O)-}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC(O)-}$ e os diferentes isômeros de butóxi ou pentoxicarbonila. Exemplos de “alquilaminocarbonila” incluem $\text{CH}_3\text{NHC(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC(O)-}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC(O)-}$ e os diferentes isômeros de 5 butilamino ou pentilaminocarbonila. Exemplos de “dialquilaminocarbonila” incluem $(\text{CH}_3)_2\text{NC(O)-}$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC(O)-}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C(O)-}$ e $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC(O)-}$.

“Trialquilsilila” inclui três radicais alquila de cadeia linear e/ou ramificada anexados e ligados por meio de um átomo de silício tal como 10 trimetilsilila, trietilsilila e *t*-butil-dimetilsilila.

A quantidade total de átomos de carbono em um grupo substituinte é indicada pelo prefixo “ $\text{C}_i\text{-C}_j$ ”, em que i e j são números inteiros de 1 a 9. Alquilsulfonila $\text{C}_1\text{-C}_4$, por exemplo, designa metilsulfonila até butilsulfonila; alcoxialquila C_2 designa CH_3OCH_2 ; alcoxialquila C_3 designa, por exemplo, $\text{CH}_3\text{CH(OCH}_3)$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ ou $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$; e alcoxialquila C_4 designa os vários isômeros de um grupo alquila substituído com um grupo alcóxi que contém um total de quatro átomos de carbono, em que exemplos 15 incluem $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ e $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

Quando um composto for substituído com um substituinte que 20 contém um subscrito que indica que o número dos mencionados substituintes pode exceder 1, os mencionados substituintes (quando excederem 1) são selecionados independentemente a partir do grupo de substituintes definidos, tal como $(\text{R}^2)_n$, n é 1, 2, 3 ou 4. Quando um grupo contiver um substituinte que pode ser hidrogênio, tal como R^2 , quando esse substituinte for tomado como hidrogênio, 25 reconhece-se que ele é equivalente ao mencionado grupo que não é substituído.

O termo “heterociclo”, “anel heterocíclico” ou “sistema de anéis heterocíclicos” indica anéis ou sistemas de anéis em que pelo menos um átomo de anel não é carbono, tal como nitrogênio, oxigênio ou enxofre.

Tipicamente, um anel heterocíclico contém não mais de quatro nitrogênios, não mais de dois oxigênios e não mais de dois enxofres. O anel heterocíclico pode ser ligado por meio de qualquer carbono ou nitrogênio disponível por substituição de hidrogênio sobre o mencionado carbono ou nitrogênio. O anel heterocíclico pode ser um anel saturado, parcialmente insaturado ou totalmente insaturado. Quando um anel heterocíclico totalmente insaturado satisfizer a lei de Hückel, o mencionado anel também é denominado um “anel heteroaromático” ou “anel heterocíclico aromático”.

A expressão “anel aromático” ou “sistema de anéis aromáticos” indica carbociclos e heterociclos totalmente insaturados em que 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” indica um sistema de anéis que contém dois anéis fundidos, no qual cada anel pode ser saturado, parcialmente saturado ou totalmente insaturado. A expressão “sistema de anéis heterobicíclicos fundidos” indica um sistema de anéis que contém dois anéis fundidos em que pelo menos um átomo de anel não é carbono e que pode ser aromático ou não aromático, conforme definido acima.

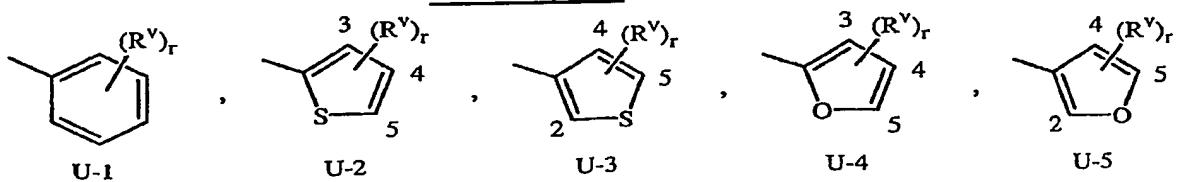
A expressão “opcionalmente substituído”, com relação aos anéis heterocíclicos, indica grupos que não são substituídos ou contêm pelo menos um substituinte não de hidrogênio que não elimina a atividade biológica possuída pelo análogo não substituído. Da forma utilizada no presente, aplicar-se-ão as definições a seguir a menos que indicado em contrário. A expressão “opcionalmente substituído” é utilizada de forma intercambiável com a expressão “substituído ou não substituído” ou com a expressão “(não) substituído”. A menos que indicado em contrário, um grupo opcionalmente substituído pode conter um substituinte em cada posição substituível do grupo e cada substituição é independente da outra.

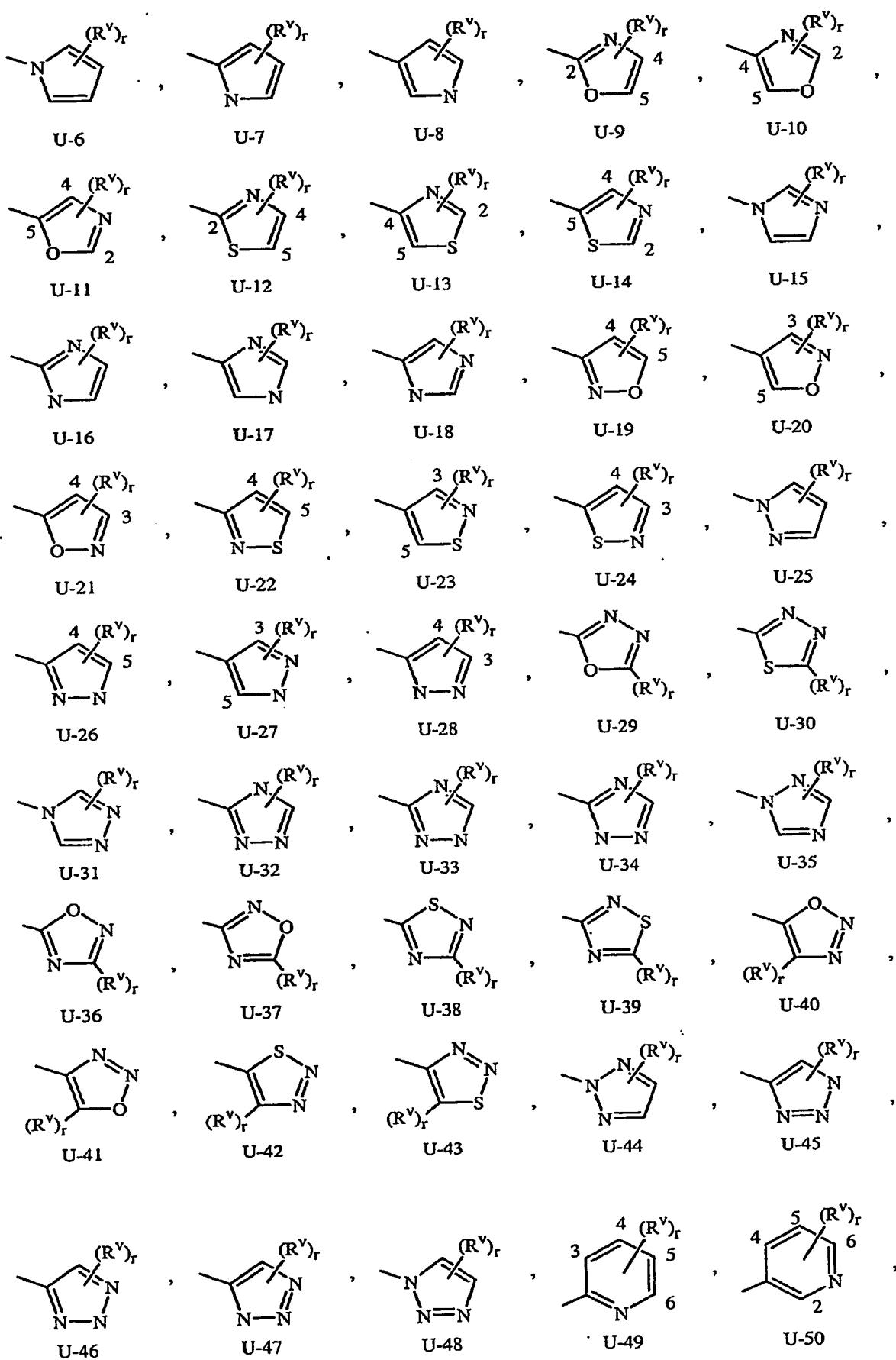
Conforme indicado acima, Q^1 pode ser (entre outros) fenila opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir do grupo de substituintes de acordo com a Descrição Resumida da Invenção. Um exemplo de fenila opcionalmente substituído com um ou mais substituintes é o anel ilustrado como U-1 na Ilustração 1, em que R^V é qualquer substituinte de acordo com a Descrição Resumida da Invenção para Q^1 e r é um número inteiro de 0 a 5.

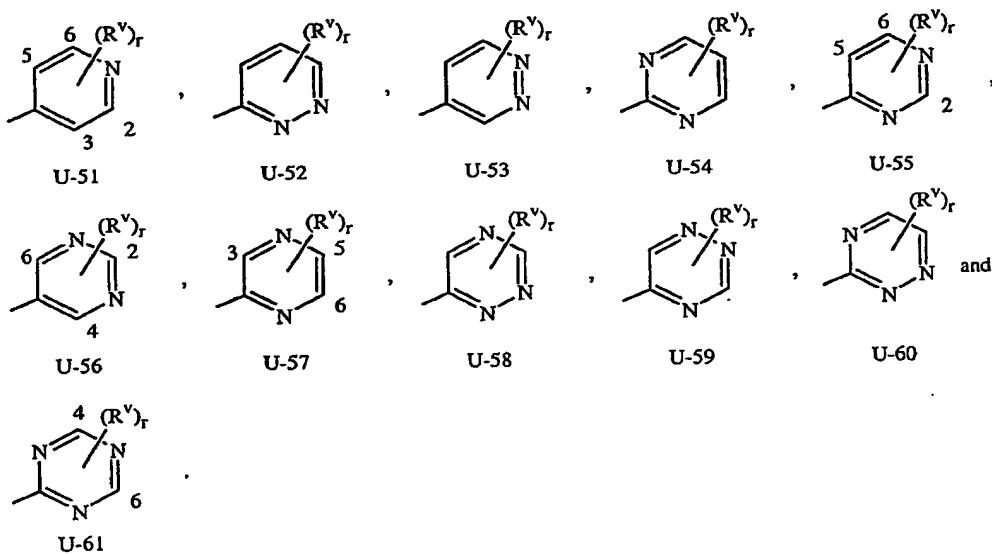
Conforme indicado acima, Q ou Q^1 pode ser (entre outros) heterociclos saturados ou insaturados com cinco ou seis membros, opcionalmente substituídos com um ou mais substituintes selecionados a partir do grupo de substituintes de acordo com a Descrição Resumida da Invenção. Exemplos de heterociclos aromáticos saturados com cinco ou seis membros opcionalmente substituídos com um ou mais substituintes incluem os anéis U-2 a U-61 exibidos na Ilustração 1 em que R^V é qualquer substituinte de acordo com a Descrição Resumida da Invenção para Q ou Q^1 e r é um número inteiro de 0 a 4. Observe-se que alguns grupos U somente podem ser substituídos com menos de quatro grupos R^V (tais como U-2 a U-5, U-7 a U-48 e U-52 a U-61).

Quando Q for um heterociclo que contém nitrogênio com cinco membros, ele pode ser ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de qualquer átomo de anel de nitrogênio ou carbono disponível, a menos que descrito em contrário. De forma similar, quando Q^1 for um heterociclo que contém nitrogênio com cinco membros, ele pode ser ligado por meio de qualquer átomo de anel de nitrogênio ou carbono disponível, a menos que descrito em contrário.

ILUSTRAÇÃO 1



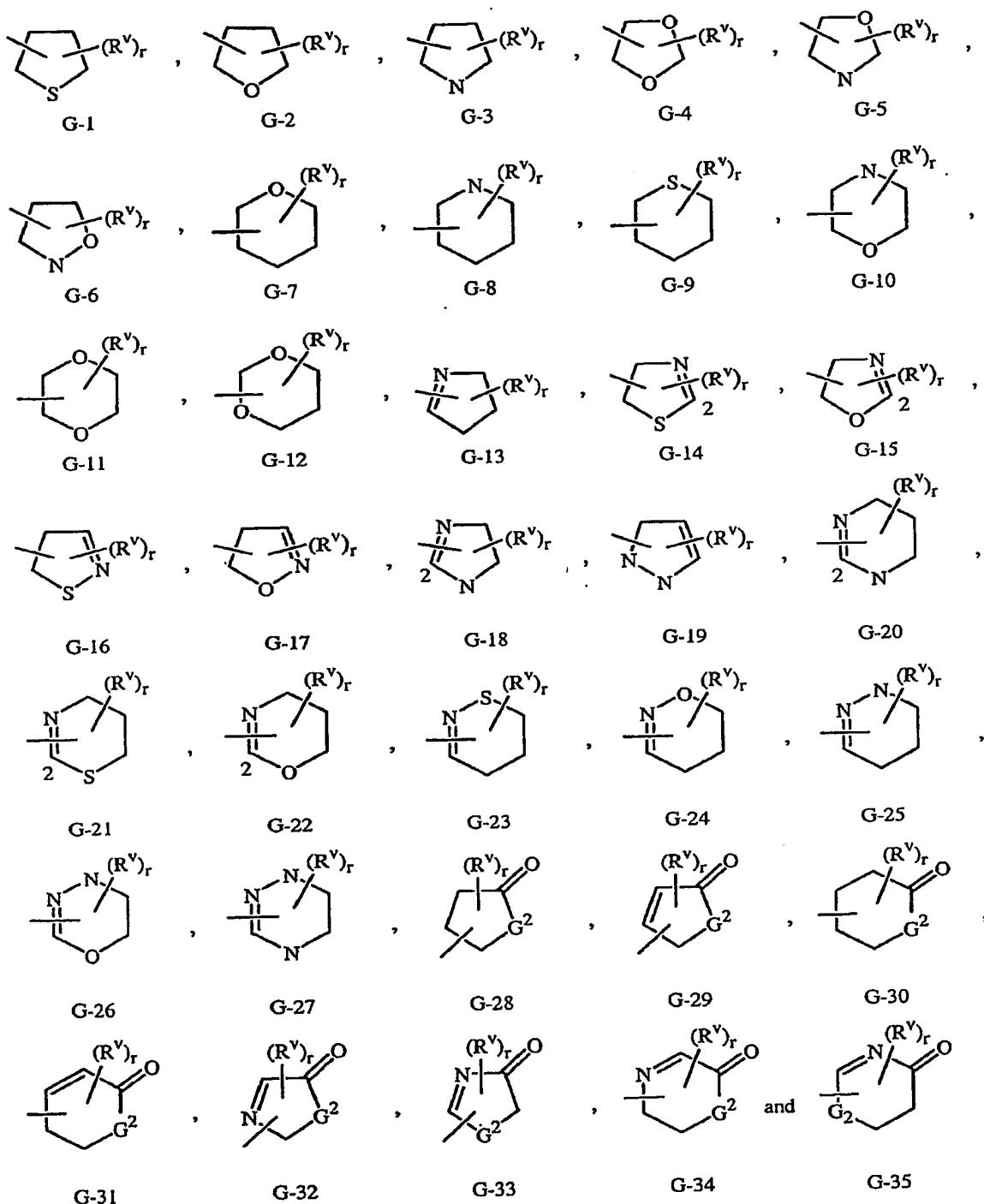




Observe-se que, quando Q ou Q^1 for um heterociclo não aromático saturado ou insaturado com cinco ou seis membros opcionalmente substituídos com um ou mais substituintes selecionados a partir do grupo de substituintes conforme definido na Descrição Resumida da Invenção para Q ou Q^1 , um ou dois membros de anéis de carbono do heterociclo podem estar opcionalmente na forma oxidada de uma porção carbonila.

Exemplos de heterociclos insaturados não aromáticos ou saturados com cinco ou seis membros incluem os anéis G-1 a G-35, conforme exibido na Ilustração 2. Observe-se que, quando o ponto de ligação sobre o grupo Q ou Q^1 for ilustrado como flutuante, o grupo Q ou Q^1 pode ser ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de qualquer carbono ou nitrogênio disponível do grupo Q ou Q^1 por substituição de um átomo de hidrogênio. Os substituintes opcionais podem ser ligados a qualquer carbono ou nitrogênio disponível por meio da substituição de um átomo de hidrogênio.

Observe-se que, quando Q ou Q^1 compreender um anel selecionado a partir de G-28 até G-35, G² é selecionado a partir de O, S ou N. Observe-se que, quando G² 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 ou Q^1 .

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 meio de substituição de um átomo de hidrogênio. Observe-se que, quando o ponto de ligação entre $(R^V)_r$ e o grupo G (ou U) for ilustrado como flutuante, $(R^V)_r$ pode

ser ligado a qualquer átomo de carbono ou átomo de nitrogênio disponível do grupo G (ou U). Embora os grupos R^v sejam exibidos nas estruturas U-1 a U-61 e G-1 a G-35, observa-se que eles não necessitam estar presentes, pois são substituintes opcionais. Observe-se que, quando R^v for H quando ligado a um átomo, este é o mesmo que se o mencionado átomo não for substituído. Além disso, os átomos de nitrogênio que necessitam de substituição para preencher a sua valência são substituídos com H ou R^v.

Os compostos de acordo com a presente invenção podem existir na forma de um ou mais estereoisômeros. Os diversos estereoisômeros incluem enantiômeros, diaestereômeros, atropisômeros e isômeros geométricos. Os técnicos no assunto apreciarão que um estereoisômero pode ser mais ativo e/ou pode exibir efeitos benéficos quando enriquecido com relação ao(s) outro(s) estereoisômero(s) ou quando separado do(s) outro(s) estereoisômero(s). Além disso, os técnicos no assunto sabem como separar, enriquecer e/ou preparar seletivamente os mencionados estereoisômeros. Conseqüentemente, a presente invenção compreende compostos selecionados a partir de compostos da Fórmula 1, seus N-óxidos e sais apropriados para uso agrícola. Os compostos de acordo com a presente invenção podem estar presentes na forma de uma mistura de estereoisômeros, estereoisômeros individuais ou em uma forma oticamente ativa.

Os técnicos no assunto apreciarão que nem todos os heterociclos que contêm nitrogênio podem formar N-óxidos, pois o nitrogênio requer um par isolado disponível para oxidação no óxido; os técnicos no assunto reconhecerão os heterociclos que contêm nitrogênio que podem formar N-óxidos. Os técnicos no assunto também reconhecerão que aminas terciárias podem formar N-óxidos. Os métodos sintéticos de preparação de N-óxidos de heterociclos e aminas terciárias são muito bem conhecidos dos técnicos no assunto, incluindo a oxidação de heterociclos e aminas terciárias com ácidos

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

Os sais dos compostos de acordo com a presente invenção incluem sais de adição de ácidos com ácidos orgânicos ou inorgânicos tais como ácido bromídrico, clorídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, 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 uma porção ácida, tal como quando Q for substituído com C(O)OR¹⁰ e R¹⁰ é H.

Conseqüentemente, a presente invenção compreende compostos selecionados a partir de compostos da Fórmula 1, seus *N*-óxidos e sais.

Realizações da presente invenção de acordo com a Descrição Resumida da Invenção incluem:

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 R¹⁷.

Realização 2. Composto da Realização 1 em que R¹ é alquila C₁-C₃ opcionalmente substituído com um ou mais halogênios.

Realização 3. Composto da Realização 2 em que R¹ é CF₃.

Realização 4. Composto da Fórmula 1 em que Z é CR².

Realização 5. Composto da Fórmula 1 em que cada R² é independentemente hidrogênio, halogênio ou haloalquila C₁-C₂.

Realização 6. Composto da Realização 5 em que R² é hidrogênio, halogênio ou CF₃.

Realização 7. Composto da Fórmula 1 em que n é 1 ou 2.

Realização 8. Composto da Fórmula 1 em que R³ é H ou ciano; ou alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais halogênios.

Realização 9. Composto da Realização 8 em que R³ é metila, etila ou CH₂CF₃.

Realização 10. Composto da Fórmula 1 em que no máximo três dentre A¹, A², A³ e A⁴ são N.

Realização 11. Composto da Fórmula 1 em que no máximo dois dentre A¹, A², A³ e A⁴ são N.

Realização 12. Composto da Fórmula 1 em que no máximo um dentre A¹, A², A³ e A⁴ é N.

Realização 13. Composto da Fórmula 1 em que A¹, A², A³ e A⁴ são diferentes de N.

Realização 14. Composto da Fórmula 1 em que A¹ é CR⁴.

Realização 15. Composto da Fórmula 1 em que A² é CR⁵.

Realização 16. Composto da Fórmula 1 em que A³ é CR⁶.

Realização 17. Composto da Fórmula 1 em que A⁴ é CR⁷.

Realização 18. Composto da Fórmula 1 em que R⁴ e R⁵ são selecionados independentemente a partir de H, halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, ciano e nitro.

Realização 19. Composto da Fórmula 1 em que R⁶ e R⁷ são selecionados independentemente a partir de H, halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, ciano e nitro.

Realização 20. Composto da Fórmula 1 em que R⁶ e R⁷ são tomados em conjunto para formar um anel aromático fundido, em que o anel aromático fundido contém como membros de anéis, além dos átomos de cabeça de ponte A³ e A⁴, quatro átomos selecionados a partir de três a quatro átomos de carbono e zero a um átomo de nitrogênio.

Realização 21. Composto da Realização 20 em que R⁶ e R⁷ são tomados em conjunto para formar um anel aromático fundido, em que o anel aromático fundido contém quatro átomos de carbono como membros de anéis, além dos átomos de cabeça de ponte A³ e A⁴.

Realização 22. Composto da Fórmula 1 em que Q é um heterociclo insaturado com cinco ou seis membros selecionado a partir de piridinila, pirimidinila, triazinila, pirazolila, triazolila, imidazolila, oxazolila, isoxazolila, tiazolila e isotiazolila, em que cada heterociclo é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de 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-C₈, ciano, nitro, C(O)NR⁸R⁹, C(O)OR¹⁰, fenila e piridinila, em que cada fenila e piridinila é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹¹; ou Q é C(O)NR¹²R¹³, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵ ou R¹⁶.

Realização 23. Composto da Realização 22 em que Q é

$C(O)NR^{12}R^{13}$ ou R^{16} .

Realização 24. Composto da Realização 23 em que Q é $C(O)NR^{12}R^{13}$.

Realização 25. Composto da Realização 22 em que Q é
5 $S(O)_2NR^{14}R^{15}$.

Realização 26. Composto da Realização 23 em que Q é R^{16} .

Realização 27. Composto da Fórmula 1 em que Q é diferente de
 R^{16} .

Realização 28. Composto da Realização 22 em que Q é um
10 heterociclo insaturado com cinco ou seis membros selecionado a partir de piridinila, pirimidinila, triazinila, pirazolila, triazolila, imidazolila, oxazolila, isoxazolila, tiazolila e isotiazolila, em que cada heterociclo é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆,
15 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-C₈, ciano, nitro, C(O)NR⁸R⁹, C(O)OR¹⁰, fenila e piridinila, em que cada fenila e piridinila é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados
20 independentemente a partir de R¹¹.

Realização 29. Composto da Realização 28 em que Q é um heterociclo insaturado com cinco membros selecionado a partir de pirazolila, triazolila e imidazolila, em que cada heterociclo é ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de nitrogênio e opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, cicloalquila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₄, ciano, nitro, C(O)NR⁸R⁹, C(O)OR¹⁰, fenila e piridinila, em que cada fenila e piridinila é

opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹¹.

Realização 30. Composto da Realização 29 em que Q é um heterociclo insaturado com cinco membros selecionado a partir de pirazolila, triazolila e imidazolila, em que cada heterociclo é ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de nitrogênio e opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, ciano, nitro, C(O)NR⁸R⁹ e C(O)OR¹⁰.

Realização 31. Composto da Realização 30 em que Q é um heterociclo insaturado com cinco membros selecionado a partir de pirazolila, triazolila e imidazolila, em que cada heterociclo é ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de nitrogênio e opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₃ e haloalquila C₁-C₃.

Realização 32. Composto da Realização 31 em que Q é um heterociclo insaturado com cinco membros selecionado a partir de triazolila e imidazolila, em que cada heterociclo é ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de nitrogênio e opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₃ e haloalquila C₁-C₃.

Realização 33. Composto da Fórmula 1 em que cada R⁸ é independentemente H, alquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₇ ou aloxicarbonila C₂-C₇.

Realização 34. Composto da Realização 33 em que cada R⁸ é H.

Realização 35. Composto da Fórmula 1 em que cada R⁹ é independentemente H; ou alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, alquilcicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual

opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹.

Realização 36. Composto da Realização 35 em que cada R⁹ é independentemente alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹.

Realização 37. Composto da Realização 36 em que cada R⁹ é independentemente alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, ciano e no máximo um Q¹.

Realização 38. Composto da Fórmula 1 em que cada R¹⁰ é independentemente H; ou alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, alquilcicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹.

Realização 39. Composto da Realização 38 em que cada R¹⁰ é independentemente alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹.

Realização 40. Composto da Realização 39 em que cada R¹⁰ é independentemente alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, ciano e no máximo um Q¹.

Realização 41. Composto da Fórmula 1 em que R¹² é H, alquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcoxicarbonila C₂-C₇.

Realização 42. Composto da Realização 41 em que R¹² é H.

Realização 43. Composto da Fórmula 1 em que R¹³ é H; ou alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, alquilcicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹.

Realização 44. Composto da Realização 43 em que R¹³ é H; ou alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹.

Realização 45. Composto da Realização 44 em que R¹³ é H; ou
5 alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxcarbonila C₂-C₄, ciano, nitro e no máximo um Q¹.

Realização 46. Composto da Realização 45 em que R¹³ é H; ou
10 alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, ciano e no máximo um Q¹.

Realização 47. Composto da Realização 46 em que R¹³ é H; ou
15 alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais halogênios e no máximo um Q¹.

Realização 48. Composto da Realização 47 em que R¹³ é H; ou
alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais flúores e no máximo um Q¹.

Realização 49. Composto da Fórmula 1 em que R¹⁴ é H, alquila
20 C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcoxcarbonila C₂-C₇.

Realização 50. Composto da Realização 49 em que R¹⁴ é H.

Realização 51. Composto da Fórmula 1 em que R¹⁵ é H; ou
alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, alquilcicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente
25 substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹.

Realização 52. Composto da Realização 51 em que R¹⁵ é H; ou
alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes
selecionados a partir de R¹⁹.

Realização 53. Composto da Realização 52 em que cada R¹⁵ é H; ou alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxcarbonila C₂-C₄, ciano e, no máximo, um Q¹.

Realização 54. Composto da Realização 53 em que R¹⁵ é H; ou alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, ciano e no máximo um Q¹.

Realização 55. Composto da Realização 54 em que R¹⁵ é H; ou alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais halogênios e no máximo um Q¹.

Realização 56. Composto da Realização 55 em que R¹⁵ é H; ou alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais flúores e no máximo um Q¹.

Realização 57. Composto da Fórmula 1 em que R¹⁶ é halogênio, haloalquila C₁-C₃, dialquilamino C₂-C₄, ciano ou nitro.

Realização 58. Composto da Fórmula 1 em que cada R¹⁹ é selecionado independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxcarbonila C₂-C₄, ciano, nitro e Q¹.

Realização 59. Composto da Fórmula 1 em que cada R¹⁹ é selecionado independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, ciano e Q¹.

Realização 60. Composto da Fórmula 1 em que cada R¹⁹ é selecionado independentemente a partir de halogênio e Q¹.

Realização 61. Composto da Fórmula 1 em que cada R¹⁹ é selecionado independentemente a partir de flúor e Q¹.

Realização 62. Composto da Fórmula 1 em que cada Q¹ é selecionado independentemente a partir de fenila, piridinila e tiazolila, em que cada qual é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, ciano, 5 fenila e piridinila.

Realização 63. Composto da Realização 62 em que Q¹ é fenila, piridinila ou tiazolila.

As realizações da presente invenção, incluindo as Realizações 1 a 63 acima bem como quaisquer outras realizações descritas no presente, 10 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 de partida e compostos intermediários. Além disso, realizações da presente invenção, incluindo as Realizações 1 a 63 acima bem como quaisquer outras realizações descritas no presente e qualquer de suas 15 combinações, referem-se às composições e métodos de acordo com a presente invenção.

Combinações das Realizações 1 a 63 são ilustradas por:

Realização A. Composto da Fórmula 1 em que:

- Q é um heterociclo insaturado com cinco ou seis membros 20 selecionado a partir de piridinila, pirimidinila, triazinila, pirazolila, triazolila, imidazolila, oxazolila, isoxazolila, tiazolila e isotiazolila, em que cada heterociclo é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, cicloalquila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₆, haloalcóxi C₁-C₆, 25 alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, haloalquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, haloalquilsulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈, ciano, nitro, C(O)NR⁸R⁹, C(O)OR¹⁰, fenila e piridinila, em que cada fenila e piridinila é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes

selecionados independentemente a partir de R¹¹; ou Q é C(O)NR¹²R¹³, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵ ou R¹⁶;

- Z é CR²;
- no máximo um dentre A¹, A², A³ e A⁴ é N;
- R¹ é alquila C₁-C₃ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹⁷;

5 - cada R² é selecionado independentemente a partir de hidrogênio, halogênio ou haloalquila C₁-C₂;

- R³ é H ou ciano; ou alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais halogênios;

10 - R⁴ e R⁵ são selecionados independentemente a partir de H, halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, ciano e nitro;

- R⁶ e R⁷ são selecionados independentemente a partir de H, halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, ciano e nitro; ou R⁶ e R⁷ são tomados em conjunto para formar um anel aromático fundido, em que o anel aromático fundido contém como membros de anéis, além dos átomos de cabeça de ponte A³ e A⁴, quatro átomos selecionados a partir de três a quatro átomos de carbono e zero a um átomo de nitrogênio;

15 - cada R⁸ é independentemente H, alquila C₁-C₆,

20 alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcoxicarbonila C₂-C₇;

- cada R⁹ e R¹⁰ é independentemente H, alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, alquilcicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹;

25 - cada R¹² e R¹⁴ é independentemente H, alquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcoxicarbonila C₂-C₇;

- cada R¹³ e R¹⁵ é independentemente H, alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, alquilcicloalquila C₄-C₇ ou

cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹;

- R¹⁶ é halogênio, haloalquila C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₄, ciano ou nitro;

5 - cada R¹⁹ é selecionado independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxcarbonila C₂-C₄, ciano, nitro e Q¹;

10 - cada Q¹ é selecionado independentemente a partir de fenila, piridinila e tiazolila, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, ciano, fenila e piridinila; e

- n é 1 ou 2.

Realização B. Composto da Realização A em que:

15 - R¹ é alquila C₁-C₃ substituído com um ou mais halogênios.

Realização C. Composto da Realização B em que:

20 - Q é um heterociclo insaturado com cinco membros selecionado a partir de pirazolila, triazolila e imidazolila, em que cada heterociclo é ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de nitrogênio e opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, ciano, nitro, C(O)NR⁸R⁹ e C(O)OR¹⁰; ou Q é C(O)NR¹²R¹³;

- R¹ é CF₃;

25 - R⁶ e R⁷ são selecionados independentemente a partir de H, halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, ciano e nitro; ou R⁶ e R⁷ são tomados em conjunto para formar um anel aromático fundido, em que o anel aromático fundido contém quatro átomos de carbono como membros de anéis

além dos átomos de cabeça de ponte A³ e A⁴;

- cada R⁸ é H;
- cada R⁹ e R¹⁰ é independentemente alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, ciano e, no máximo, um Q¹;
- cada R¹² e R¹⁴ é independentemente H;
- cada R¹³ e R¹⁵ é independentemente H; ou alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹; e
- cada R¹⁹ é selecionado independentemente a partir de halogênio e Q¹.

Realização D. Composto da Realização C em que R³ é metila, etila ou CH₂CF₃.

Realizações específicas incluem compostos da Fórmula 1

selecionados a partir do grupo que consiste de:

- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]-2-metil-N-(2-piridinilmetil)benzamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]-N-(2,2,2-trifluoroetyl)benzamida;
- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-(2,2,2-trifluoroetyl)-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]-N-(2-piridinilmetil)benzamida; e
- 1-[4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]fenil]-1H-1,2,4-triazol.

Realizações específicas adicionais incluem qualquer combinação

dos compostos da Fórmula 1 selecionados a partir do grupo imediatamente acima.

Merece observação que os compostos de acordo com a presente

invenção são caracterizados por padrões metabólicos e/ou residuais no solo favoráveis e exibem atividade de controle de um espectro de pragas invertebradas agronômicas e não agronômicas.

Merece observação específica, por motivos de importância econômica e espectro de controle de pragas invertebradas, que a proteção de safras agronômicas contra lesões ou danos causados por pragas invertebradas por meio do controle de pragas invertebradas é uma realização 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 de plantas que não são colocadas diretamente em contato com um composto da Fórmula 1 ou uma composição que compreende o composto.

Também merecem observação como realizações da presente invenção composições de controle de pragas invertebradas que compreendem uma quantidade biologicamente eficaz de um 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 um tensoativo, diluente sólido e diluente líquido, em que a mencionada composição compreende ainda opcionalmente uma 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 uma quantidade biologicamente eficaz de um composto de acordo com qualquer das realizações anteriores (tais como na forma de uma composição descrita no presente).

Realizações da presente invenção também incluem uma composição que compreende um 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 uma composição líquida na forma de encharcamento do solo que compreende uma 5 quantidade biologicamente eficaz de um composto de acordo com qualquer das realizações anteriores.

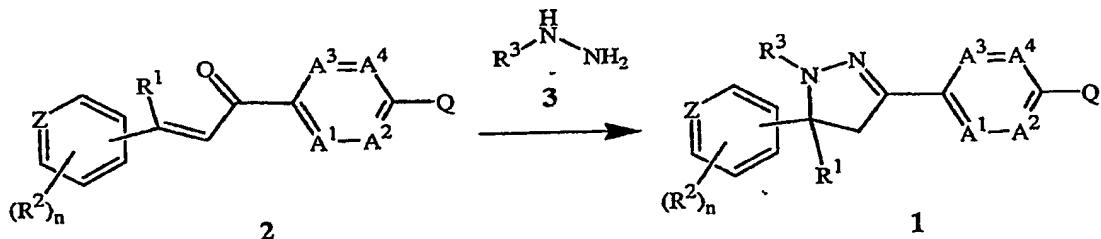
Realizações da presente invenção também incluem uma composição de pulverização para controle de pragas invertebradas que compreende uma quantidade biologicamente eficaz de um composto de acordo 10 com qualquer das realizações anteriores e um propelente. Realizações da presente invenção incluem ainda uma composição de isca para controle de pragas invertebradas que compreende uma quantidade biologicamente eficaz de um composto de acordo com qualquer das realizações anteriores, um ou mais materiais alimentícios, opcionalmente um atrativo e opcionalmente um 15 umectante. Realizações da presente invenção também incluem um dispositivo de controle de pragas invertebradas que compreende a mencionada composição de isca e um 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 20 abertura, de forma que a praga invertebrada possa ter acesso à mencionada composição de isca a partir de um local fora do abrigo e em que o abrigo é adicionaismente adaptado para colocação em um local de atividade conhecida ou potencial para a praga invertebrada ou perto dele.

Os compostos da Fórmula 1 podem ser preparados por meio de 25 um ou mais dos métodos e variações a seguir conforme descrito nos Esquemas 1 a 15. As definições de R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , R^{12} , R^{13} , A^1 a A^4 , Q, n e Z nos compostos das Fórmulas 1 a 25 abaixo são conforme definido acima na Descrição Resumida da Invenção a menos que indicado em contrário. As

Fórmulas 1a, 6 e 8 são subconjuntos da Fórmula 1 e a Fórmula 13a é um subconjunto da Fórmula 13.

Os compostos da Fórmula 1 podem ser preparados por meio da cicloadição de enonas da Fórmula 2 com hidrazinas da Fórmula 3, conforme descrito no Esquema 1. Acredita-se que a reação processe-se geralmente por meio da intermediação de uma hidrazone formada *in situ*. Em um procedimento típico, os reagentes são combinados em um solvente prótico polar tal como etanol ou metanol. A adição de bases amina tais como piridina ou trietilamina à mistura de reação pode ser vantajosa. A reação pode ser conduzida em uma ampla variedade de solventes, que inclui tetraidrofuran, dietil éter, cloreto de metíleno, dioxano e tolueno e as temperaturas ideais variam da temperatura ambiente à temperatura de refluxo do solvente. Os procedimentos gerais de cicloadição de hidrazinas com enonas são bem documentados na literatura química. Para referências relevantes, vide Dandia et al, *Heterocyclic Communications* 1996, 2, 281-286 e Sibi et al, *Tetrahedron: Asymmetry* 2004, 15, 3353-3356, bem como referências ali mencionadas. O método do Esquema 1 é ilustrado no Exemplo 1, Etapa C.

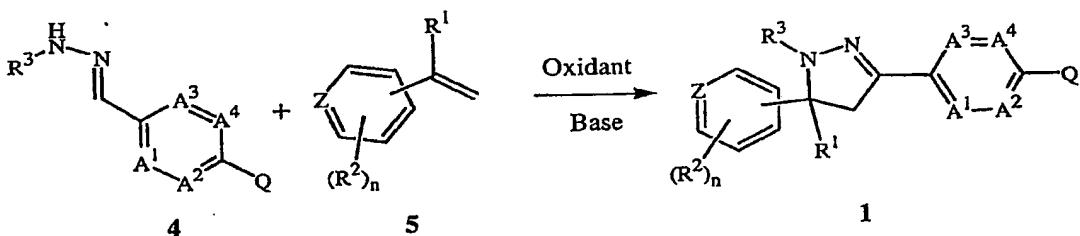
ESQUEMA 1



Alternativamente, os compostos da Fórmula 1 podem ser preparados utilizando métodos ilustrados pelo Esquema 2, por meio dos quais hidrazonas da Fórmula 4 reagem com estirenos da Fórmula 5 sob condições oxidativas. A reação ilustrada no Esquema 2 é um exemplo de cicloadição dipolar [3+2] que envolve a formação oxidativa de um nitrilo-imina dipolo derivado da hidrazone da Fórmula 4 que se cicliza em seguida com o estireno

da Fórmula 5. Acredita-se que a reação processe-se geralmente por meio da intermediação de um cloreto de hidrazonoíla gerado *in situ*. Em um procedimento típico, um reagente clorante tal como hipoclorito de sódio, *N*-clorossuccinimida ou sal de sódio de *N*-cloro-*p*-toluenossulfonamida (Clorammina T) é combinado com a hidrazone 4 na presença do estireno 5. A adição de bases amina tais como piridina ou trietilamina ou bases carbonato tais como carbonato de potássio ou bicarbonato de sódio é freqüentemente vantajosa e pode ser necessária. A reação pode ser conduzida em uma ampla variedade de solventes, que inclui tetraidrofuran, dietil éter, cloreto de metileno, dioxano e tolueno, e as temperaturas ideais variam da temperatura ambiente à temperatura de refluxo do solvente. Exemplos de reações análogas à reação exibida no Esquema 2 são encontrados em *J. Het. Chem.* 2004, 41, 677-680 e *Tetrahedron* 1994, 50, 7543-7556.

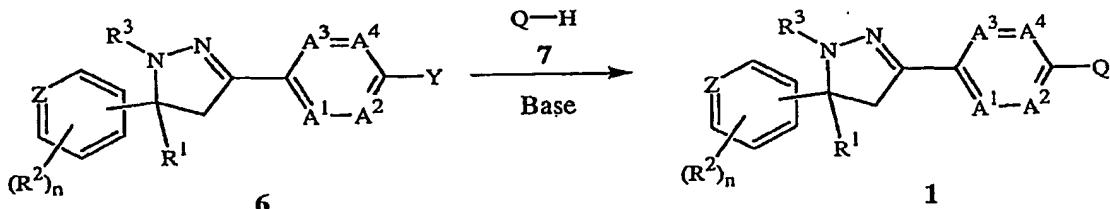
ESQUEMA 2



Os compostos da Fórmula 1, em que Q é um anel heterocíclico *N*-ligado com cinco membros, podem também ser preparados por meio de deslocamento direto de um haleto de arila da Fórmula 6 em que Y é um átomo de halogênio com um anel heterocíclico azol da Fórmula 7 conforme exibido no Esquema 3. Anéis heterocíclicos azol típicos da Fórmula 7 incluem pirazóis, imidazóis e triazóis opcionalmente substituídos. Brometos da Fórmula 6 (em que Y é Br) podem ser deslocados com o uso de iodeto de cobre e um catalisador de paládio; vide, por exemplo, Cristau et al, *European Journal of Organic Chemistry* 2004, 695-709. Para deslocamento de fluoreto da Fórmula 6 (em que Y é F), a reação é tipicamente conduzida em um solvente aprótico

polar tal como *N,N*-dimetilformamida ou *N,N*-dimetilacetamida e na presença de uma base inorgânica tal como carbonato de sódio ou potássio.

ESQUEMA 3



Y é um átomo de halogênio e Q-H é um heterociclo aromático

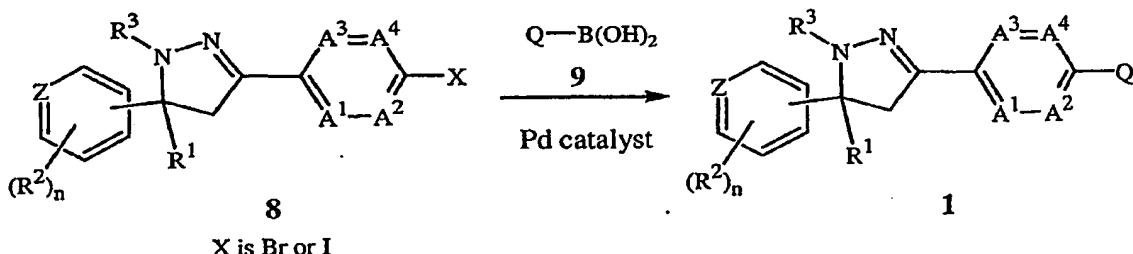
5 com cinco membros.

Uma preparação alternativa dos compostos da Fórmula 1 inclui a reação Suzuki bem conhecida que envolve acoplamento cruzado catalisado por Pd de um brometo ou iodeto de arila da Fórmula 8 com um ácido aril ou heteroaril borônico da Fórmula 9 (Esquema 4). Muitos catalisadores de paládio
10 são úteis para este tipo de transformação; um catalisador típico é tetraquis(trifenilfosfino)paládio (0). Solventes tais como tetraidrofuran, acetonitrila, dietil éter e dioxano são apropriados. Os ácidos borônicos da Fórmula 9 são disponíveis comercialmente ou podem ser preparados por meio de métodos conhecidos. Outros métodos que incluem os procedimentos de
15 acoplamento de Heck, Stille, Kumada e Buchwald-Hartwig oferecem muitas alternativas de introdução de grupos heterocíclicos Q. Para referências importantes, vide, por exemplo, Zifcsak, C. A. e Hlasta, D. J., *Tetrahedron* 2004, 60, 8991-9016. Para uma análise completa da química de paládio aplicável à síntese de grupos Q heterocíclicos, vide Li, J. J.; Gribble, G. W.;
20 Editores; *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist*. Elsevier, Oxford, Grã-Bretanha, 2000.

A Fórmula 6 é a Fórmula 1 em que Q é Y e a Fórmula 8 é a Fórmula 1 em que Q é X. Os compostos das Fórmulas 6 e 8 podem ser preparados, portanto, por meio do método descrito para compostos da Fórmula

1 no Esquema 1.

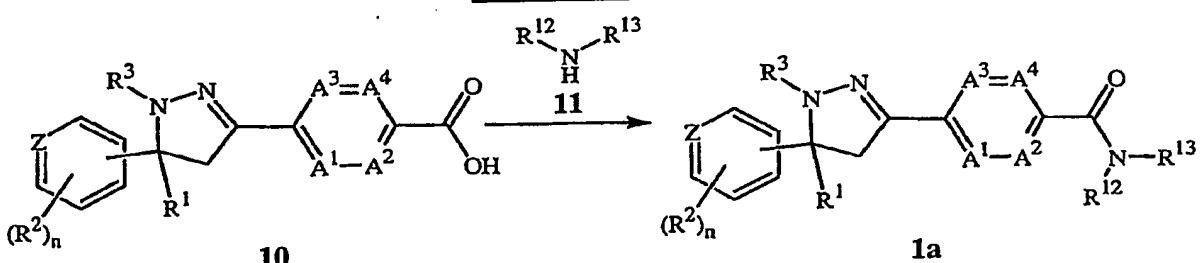
ESQUEMA 4



Existe uma ampla variedade de métodos alternativos de preparação de grupos Q heterocíclicos encontrados na Fórmula 1. Estes 5 podem ser preparados a partir de transformações de grupos funcionais bem documentados de cetonas, ésteres, ácidos, aldeídos, nitrilas e similares. Para referências principais, vide Tanaka et al, *J. Med. Chem.* 1998, 41, 2390-2410 e referências ali mencionadas.

Os compostos da Fórmula 1a (Fórmula 1 em que Q é CONR¹²R¹³) 10 podem ser preparados por meio de acoplamento de ácidos carboxílicos da Fórmula 10 com compostos amino adequadamente substituídos da Fórmula 11 conforme exibido no Esquema 5. O método do Esquema 5 é ilustrado no Exemplo 2, Etapa E.

ESQUEMA 5

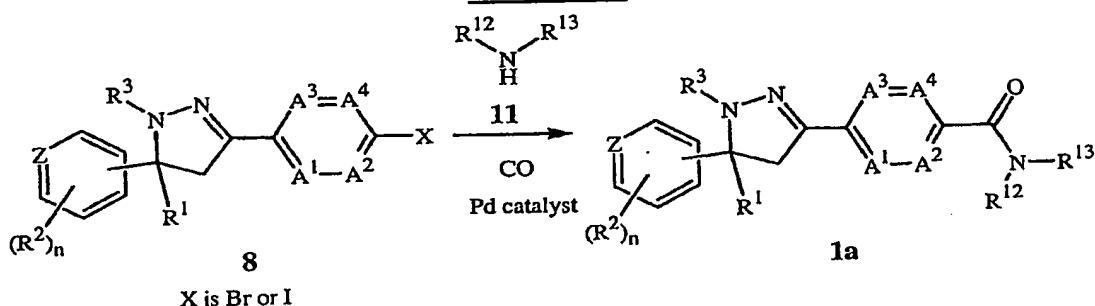


15 Esta reação é conduzida na presença de um reagente de acoplamento desidratante tal como diciclohexil carbodiimida, 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etylcarbodiimida, anidrido cíclico de ácido 1-propanofosfônico ou carbonil diimidazol na presença de uma base tal como trietilamina, piridina, 4-(dimetilamino)piridina ou N,N-diisopropiletilamina em um

solvente aprótico anidro tal como diclorometano ou tetraidrofuran em uma temperatura tipicamente da temperatura ambiente a 70 °C.

Alternativamente, os compostos da Fórmula 1a podem também ser preparados por meio de acoplamento dos haletos da Fórmula 8 com compostos amino adequadamente substituídos da Fórmula 11 na presença de catalisadores de paládio sob atmosfera de monóxido de carbono, conforme exibido no Esquema 6. O método do Esquema 6 é ilustrado no Exemplo 1, Etapa D.

ESQUEMA 6



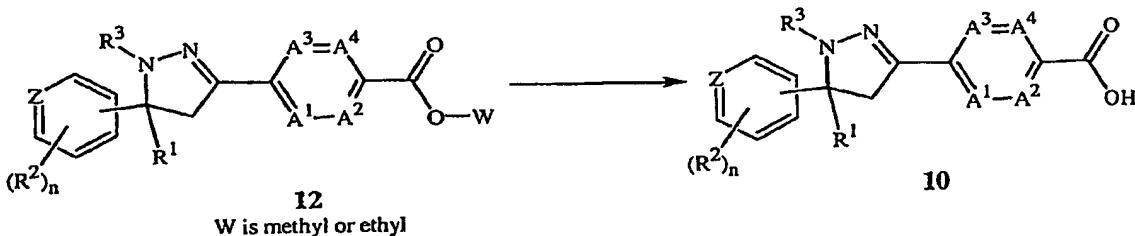
Os catalisadores de paládio utilizados para o método do Esquema 6 encontram-se tipicamente na forma de compostos que compreendem paládio em um estado de oxidação formal de 0 (ou seja, Pd(0)) ou 2 (ou seja, Pd(II)). Uma ampla variedade desses complexos e compostos que contêm paládio é útil como catalisadores para este método. Exemplos de complexos e compostos que contêm paládio úteis como catalisadores no método do Esquema 6 incluem PdCl₂(PPh₃)₂, Pd(PPh₃)₄ (tetraquis(trifenilfosfino)paládio (0)), Pd(C₅H₇O)₂ (acetilacetonato de paládio (II)) e Pd₂(dba)₃ (tris(dibenzilidenoacetona)dipaládio (0)) e [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaládio (II). O método do Esquema 6 é geralmente conduzido em uma fase líquida e, portanto, para que seja mais eficaz, o catalisador de paládio possui preferencialmente boa solubilidade na fase líquida. Os solventes úteis incluem, por exemplo, éteres tais como 1,2-dimetoxietano, amidas tais como *N,N*-dimetilacetamida e hidrocarbonetos

aromáticos não halogenados, tais como tolueno.

O método do Esquema 6 pode ser conduzido ao longo de uma ampla faixa de temperaturas, que inclui cerca de 25 a cerca de 150 °C. Merecem observação temperaturas de cerca de 60 a cerca de 110 °C, que tipicamente fornecem altas velocidades de reação e altos rendimentos de produto. Métodos e procedimentos gerais de aminocarbonilação com um brometo de arila e uma amina são bem conhecidos na literatura; vide, por exemplo, H. Horino et al, *Synthesis* 1989, 715-718; e J. J. Li, G. W. Gribble, editores, *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist*, 2000.

Os compostos da Fórmula 10 podem ser preparados por meio de hidrólise do éster da Fórmula 12, em que W é metila ou etila, conforme exibido no Esquema 7.

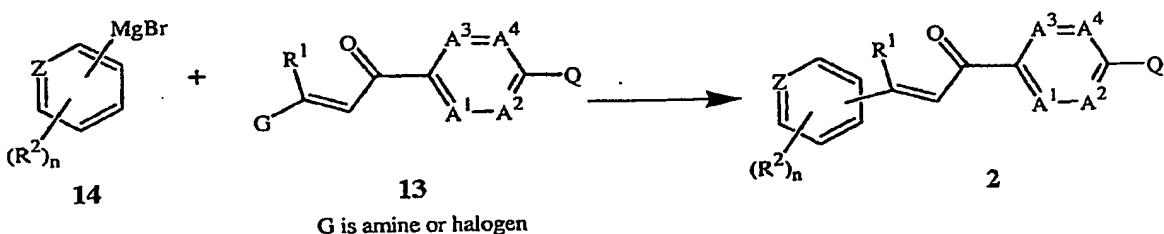
ESQUEMA 7



W é metila ou etila

Neste método, o composto éster da Fórmula 12 é convertido no ácido carboxílico correspondente da Fórmula 10 por meio de procedimentos gerais bem conhecidos na técnica, tais como por meio de tratamento com hidróxido de lítio aquoso em tetraidrofuran, seguido por acidificação. O método do Esquema 7 é ilustrado no Exemplo 2, Etapa D.

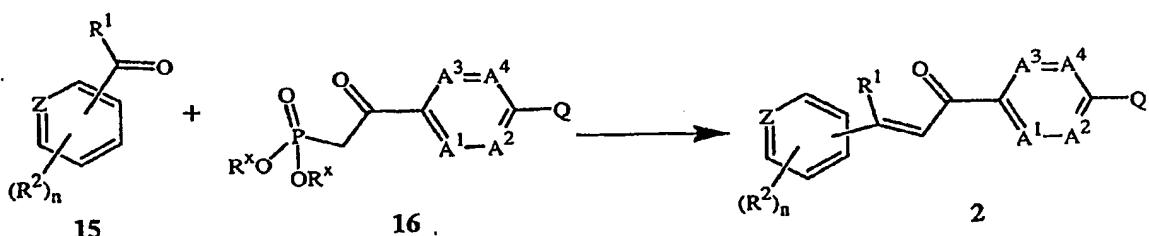
Conforme exibido no Esquema 8, enonas da Fórmula 2 são disponíveis por meio de reações de eliminação de adição de reagentes organometálicos tais como reagentes Grignard da Fórmula 14 com β-enaminas ou β-enaminas ou β-haloenonas da Fórmula 13.

ESQUEMA 8

G é amina ou halogênio.

A reação pode ser conduzida em uma série de solventes que inclui tetraidrofuran, dietil éter, dioxano ou cloreto de metileno e temperaturas ideais variam de -78 °C à temperatura de refluxo do solvente. Procedimentos 5 gerais de adições de reagentes Grignard a enaminas e haloenonas são bem documentados na literatura química; vide, por exemplo, Jeong et al, *Journal of Fluorine Chemistry* 2004, 125, 1629-1638, bem como referências ali mencionadas. O método do Esquema 8 é ilustrado no Exemplo 1, Etapa B.

10 Alternativamente, conforme exibido no Esquema 9, enonas da Fórmula 2 podem ser formadas por meio da condensação de cetonas da Fórmula 15 com compostos de fosfonato da Fórmula 16 conforme a modificação de Wadsworth-Emmons da Reação de Wittig.

ESQUEMA 9

15 em que R^x é, por exemplo, metila ou etila.

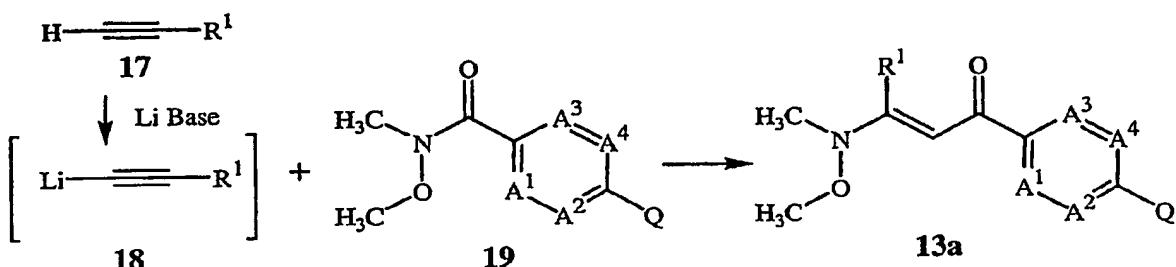
Neste método, o composto de fosfonato da Fórmula 16 é desprotonado com uma base tal como piridina, trietilamina, NaH, $NaHCO_3$ ou diisopropilamida de lítio (LDA) em um solvente tal como tetraidrofuran, dietil éter, dioxano ou cloreto de metileno para formar um intermediário ilídio e a cetona da Fórmula 15 é adicionada para formar o composto da Fórmula 2.

Temperaturas ideais variam de 0 °C à temperatura de refluxo do solvente. As condições gerais de reação da Reação de Wittig são bem documentadas na literatura química. Vide, por exemplo, Dull et al, *J. Org. Chem.* 1967, 32, 1622-1623.

5 Existe uma ampla variedade de métodos alternativos de preparação de enonas da Fórmula 2. Estas enonas podem ser preparadas por meio de reações de transformação de grupos funcionais, adição e eliminação.

10 β -Enaminas da Fórmula 13a (um subconjunto de compostos da Fórmula 13 em que G é N(CH₃)OCH₃) podem ser preparadas a partir de 15 alquinas da Fórmula 17 e reagentes de amida Weinreb da Fórmula 19 conforme exibido no Esquema 10.

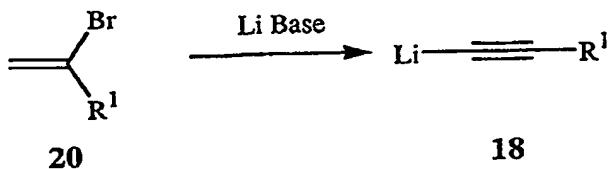
ESQUEMA 10



Neste método, a alquina da Fórmula 17 reage com uma base de lítio forte tal como *n*-BuLi para formar o composto alquinila litiado da Fórmula 18 sob temperaturas que variam de -78 a -30 °C, seguida pela adição da amida de Weinreb da Fórmula 19 e aquecimento a 0 °C. Para referências importantes sobre este método geral, vide Jeong et al, *Journal of Fluorine Chemistry* 2004, 125, 1629-1638, bem como as referências ali mencionadas.

20 Alternativamente, o composto alquinila litiado da Fórmula 18 pode ser formado por meio da reação de eliminação do composto bromoalqueno da Fórmula 20 com uma base não nucleofílica forte conforme exibido no Esquema 11.

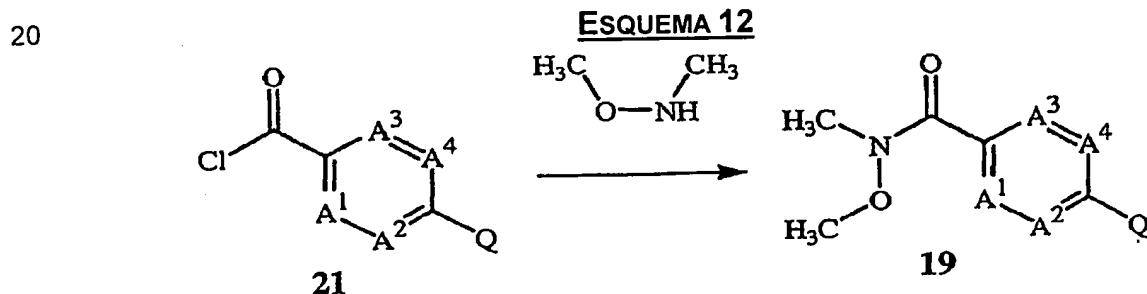
ESQUEMA 11



Nesta variação do método do Esquema 10, compostos litiados da Fórmula 18 são preparados *in situ* por meio da reação de compostos bromoalqueno da Fórmula 20 sob temperaturas que variam de -78 a -30 °C com dois ou mais equivalentes de base de lítio forte tal como LDA, sec-BuLi ou 5 hexametildissilazida de lítio (LiHMDS), seguida pela adição do reagente de Weinreb da Fórmula 19 conforme exibido no Esquema 10. Para referências importantes sobre este método geral, vide Chae et al, *Journal of Fluorine Chemistry* 2003, 120, 185-193 e Konno et al, *Tetrahedron* 2003, 59, 7571-7580. O método do Esquema 11 é ilustrado no Exemplo 1, Etapa B.

10 Compostos da Fórmula 13 em que G é halogênio podem ser preparados por meio de uma ampla variedade de métodos conhecidos na técnica. Para referências importantes, vide Laurent, A. et al, *Tetrahedron Letters* 1991, 32, 3071-3074 e Okano, T. et al, *Synlett* 1990, 403-404.

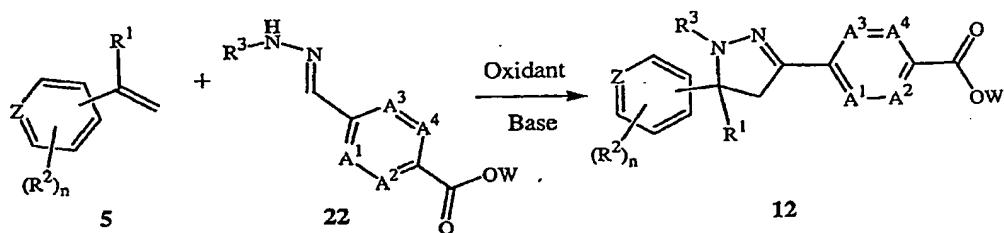
15 As amidas de Weinreb da Fórmula 19 são disponíveis comercialmente ou podem ser preparadas a partir dos cloretos ácidos correspondentes da Fórmula 21 conforme exibido no Esquema 12. Os cloretos ácidos podem ser preparados por meio de uma ampla variedade de métodos conhecidos na literatura sintética e muitos são compostos conhecidos ou disponíveis comercialmente.



Ésteres da Fórmula 12 podem ser preparados sob condições

oxidativas conforme ilustrado no Esquema 13. As condições do método do Esquema 13 são análogas às já descritas para o método do Esquema 2. O método do Esquema 13 é ilustrado no Exemplo 2, Etapa C.

ESQUEMA 13

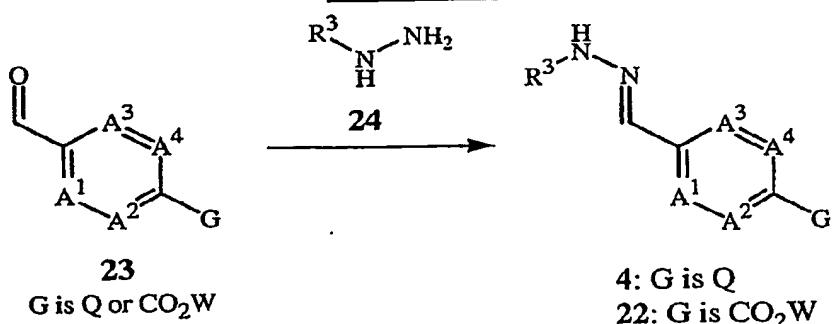


A conversão de ésteres da Fórmula 12 em amidas da Fórmula 1a

já foi descrita para a combinação de métodos dos Esquemas 7 e 5.

Hidrazonas das Fórmulas 4 e 22 podem ser preparadas por meio da reação de aldeídos da Fórmula 23 com hidrazinas da Fórmula 24 conforme exibido no Esquema 14. Quantidades excessivas ou estequiométricas de hidrazina 24 são tipicamente empregadas nesta reação. Solventes típicos incluem alcoóis tais como metanol ou etanol e éteres tais como tetraidrofuran ou 1,4-dioxano. A reação é tipicamente conduzida sob temperaturas que variam de 0 °C à temperatura de refluxo do solvente para gerar término em 0,5 a 48 horas. Um catalisador ácido tal como ácido *p*-toluenossulfônico ou ácido acético às vezes é utilizado no método do Esquema 14. Os procedimentos deste método são encontrados nas referências a seguir: *Eur. J. Med. Chem.* 2004, 39, 499-505; *Bioorg. Med. Chem.* 2003, 11, 4161-4169. O método do Esquema 14 é ilustrado no Exemplo 2, Etapa A.

ESQUEMA 14

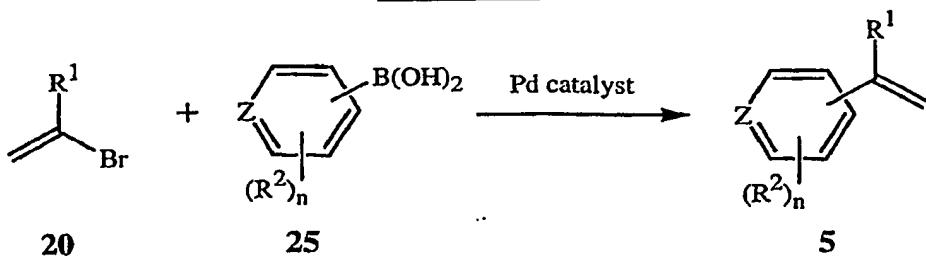


Os aldeídos da Fórmula 23 podem ser preparados por meio de uma ampla variedade de métodos conhecidos na técnica; alguns dos aldeídos são compostos conhecidos ou disponíveis comercialmente.

Estirenos da Fórmula 5 podem ser preparados conforme exibido no Esquema 15. Este método envolve o acoplamento catalisado por paládio de bromoalquenos da Fórmula 20 com ácidos aril borônicos da Fórmula 25. Para análises deste método geral, vide as referências relacionadas para o método do Esquema 4. Um procedimento típico deste método é ilustrado pelo Exemplo 2, Etapa B.

10

ESQUEMA 15



Os técnicos no assunto 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. 15 Também se reconhece 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 20 produtos desejados. O uso e a seleção dos grupos protetores serão evidentes para os técnicos no assunto de 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 na forma em que é

ilustrado em qualquer esquema individual, pode ser necessário realizar etapas sintéticas de rotina adicionais não descritas em detalhes para completar a síntese de compostos da Fórmula 1. Os técnicos no assunto também reconhecerão que pode ser necessário realizar uma combinação das etapas 5 ilustradas nos esquemas acima em uma ordem diferente da indicada pela seqüência específica apresentada para preparar os compostos da Fórmula 1.

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 10 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, "br s" indica isolado amplo e "br t" indica triplo amplo.

15 EXEMPLO 1

Preparação de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-metil-5-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-3-il]-2-metil-N-(2-piridinilmetil)benzamida:

ETAPA A: PREPARAÇÃO DE 4-BROMO-N-METÓXI-N,3-DIMETILBENZAMIDA.

Uma solução agitada de ácido 4-bromo-3-metilbenzóico (15 g, 69,0 20 mmol) em cloreto de tionila (60 ml) foi aquecida sob refluxo por duas horas e concentrada a vácuo em seguida. O cloreto de acila residual foi dissolvido em diclorometano (300 ml) e adicionado a uma solução agitada de cloridrato de *N,O*-dimetil hidroxilamina (7,2 g, 72,0 mmol) e piridina (16,8 ml, 207,0 mmol) em diclorometano (450 ml) a -20 °C. A mistura de reação foi mantida em aquecimento à temperatura ambiente por uma noite e lavada em seguida com 25 1 M de solução aquosa de carbonato de potássio. A solução aquosa foi extraída com diclorometano. Os extratos orgânicos foram concentrados sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia sobre sílica gel

utilizando 50% hexanos/acetato de etila como eluente para gerar o produto título na forma de óleo amarelo claro (17,81 g, 69,0 mol, rendimento de 100%).

NMR ^1H (CDCl_3): δ 7,55 (m, 2H), 7,37 (m, 1H), 3,54 (s, 3H), 3,34 (s, 3H), 2,42 (s, 3H).

5 **ETAPA B: PREPARAÇÃO DE (2E/Z)-1-(4-BROMO-3-METILFENIL)-3-(3,5-DICLOROFENIL)-4,4,4-TRIFLUORO-2-BUTEN-1-ONA.**

A uma solução agitada de diisopropilamina (11,1 ml, 83,3 mmol) em tetraidrofuran (100 ml) a -78 °C, adicionou-se 2,5 M de *n*-BuLi em hexanos (33,31 ml, 83,3 mmol). A mistura de reação foi mantida em aquecimento a 0 °C, agitada por vinte minutos e resfriada em seguida a -78 °C. Adicionou-se 2-bromo-3,3,3-trifluoropropeno (6,78 g, 38,7 mmol) à mistura de reação, que foi agitada por trinta minutos. Em seguida, adicionou-se uma solução de 4-bromo-*N*-metóxi-*N*,3-dimetilbenzamida (ou seja, o produto da Etapa A) (5,0 g, 19,4 mmol) em tetraidrofuran (20 ml) à mistura de reação a -78 °C, que foi aquecida em seguida a 0 °C. Adicionou-se água (25 ml) à mistura, que foi agitada em seguida por uma hora a 0 °C. A mistura de reação foi extraída com éter, concentrada sob pressão reduzida e o resíduo oleoso foi purificado por meio de cromatografia sobre sílica gel para gerar uma mistura de (2E/Z)-3-[bis(1-metiletil)amino]-1-(4-bromo-3-metilfenil)-4,4,4-trifluoro-2-buten-1-ona e (2E/Z)-1-(4-bromo-3-metilfenil)-4,4,4-trifluoro-3-(metoximetilamino)-2-buten-1-ona (razão 2,5:1 por meio de LCMS) (6,55 g, rendimento de cerca de 92%) na forma de óleo laranja brilhante.

Esta mistura bruta (3 g, cerca de 8,5 mmol) foi diluída com tetraidrofuran (40 ml), resfriada a -78 °C e adicionou-se brometo de 3,5-ticlorofenil magnésio (0,5 M em tetraidrofuran) (51 ml, 25,5 mmol). A mistura de reação foi aquecida à temperatura ambiente, agitada por duas horas, resfriada em seguida com uma solução aquosa de cloreto de amônio saturado e extraída com dietil éter. A solução orgânica foi concentrada sob pressão

reduzida e o óleo residual foi purificado por meio de cromatografia sobre sílica gel utilizando 10% acetato de etila/hexanos como eluente para gerar o produto título na forma de óleo amarelo (3,24 g, rendimento de 87%).

ETAPA C: PREPARAÇÃO DE 3-(4-BROMO-3-METILFENIL)-5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-

DI-HIDRO-1-METIL-5-(TRIFLUOROMETIL)-1H-PIRAZOL.

5 Adicionou-se metil hidrazina (55 mg, 1,18 mmol) a uma solução de (2E/Z)-1-(4-bromo-3-metilfenil)-3-(3,5-diclorofenil)-4,4,4-trifluoro-2-buten-1-ona (ou seja, o produto da Etapa B) (400 mg, 0,91 mmol) em etanol (3 ml). A mistura de reação foi aquecida sob refluxo por duas horas e resfriada em 10 seguida à temperatura ambiente. A mistura de reação foi resfriada por meio da adição de água (5 ml) e extraída com dietil éter. Os extratos orgânicos foram concentrados sob pressão reduzida e o resíduo foi purificado por meio de cromatografia sobre sílica gel utilizando 10% acetato de etila/hexanos como eluente para gerar o produto título na forma de óleo amarelo claro (130 mg, 15 rendimento de 31%).

NMR ¹H (CDCl₃) δ 7,51 (d, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,39-7,36 (m, 3H), 7,22 (m, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,36 (d, 1H), 3,07 (s, 3H), 2,39 (s, 3H).

ETAPA D: PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-1-METIL-5-

(TRIFLUOROMETIL)-1H-PIRAZOL-3-IL]-2-METIL-N-(2-PIRIDINILMETIL)BENZAMIDA.

20 A uma solução agitada de 3-(4-bromo-3-metilfenil)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol (ou seja, o produto da Etapa C) (110 mg, 0,24 mmol) em tolueno (5 ml), adicionou-se 2-(aminometil)piridina (38 mg, 0,35 mmol), [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaládio (II) (10 mg, 0,01 mmol) e trietilamina (0,5 ml). Gás monóxido de carbono foi borbulhado na mistura de reação por dez minutos e, em seguida, a mistura de reação foi aquecida a 90 °C por uma noite sob uma atmosfera de monóxido de carbono mantida com um balão cheio de monóxido de carbono. A mistura de reação foi concentrada e o óleo residual foi

purificado por meio de cromatografia sobre sílica gel utilizando acetato de etila a 100% como eluente para gerar o produto título, um composto de acordo com a presente invenção, na forma de óleo amarelo claro (53 mg, rendimento de 42%).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 8,51 (d, 1H), 7,67 (m, 1H), 7,48 (m, 2H), 7,39 (m, 3H), 7,30 (m, 1H), 7,19 (m, 2H), 4,72 (d, 2H), 3,90 (d, 1H), 3,38 (d, 1H), 3,07 (s, 3H), 2,48 (s, 3H).

EXEMPLO 2

PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-1-METIL-5-

(TRIFLUOROMETIL)-1H-PIRAZOL-3-IL]-N-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)BENZAMIDA:

10 ETAPA A: PREPARAÇÃO DE 4-[*(E*)-(METIL HIDRAZONO)METIL]BENZOATO DE METILA.

Uma solução de 4-formilbenzoato de metila (1,0 g, 6,1 mmol), sulfato de metil hidrazina (0,88 g, 6,1 mmol), carbonato de potássio (0,92 g, 6,7 mmol) e 1,4-dioxano (25 ml) foi aquecida sob refluxo por oito horas. A mistura resultante foi resfriada à temperatura ambiente e tratada com água com gelo em excesso. O produto bruto foi recolhido por meio de filtragem e seco em ar para gerar o produto título, que foi utilizado na etapa a seguir sem purificação adicional.

15 ETAPA B: PREPARAÇÃO DE 1,3-DICLORO-5-[1-(TRIFLUOROMETIL)ETENIL]BENZENO.

A uma mistura de tetraidrofuran (33 ml), etileno glicol dimetil éter (33 ml) e hidróxido de potássio aquoso (4 N, 33 ml) em um 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), seguidos pela adição de tetraquis(trifenilfosfino)paládio (0) (264 mg, 0,23 mmol). 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 extraído com dietil éter (2 x 20 ml). Os extratos orgânicos foram combinados, secos (MgSO_4) e concentrados sob pressão reduzida para fornecer um resíduo. O resíduo foi purificado por meio de cromatografia sobre sílica gel utilizando 10% acetato de etila/hexanos como eluente para gerar o composto título na forma de óleo transparente (4,42 g).

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-1-METIL-5-(TRIFLUOROMETIL)-1H-PIRAZOL-3-IL]BENZOATO DE METILA.

A uma solução de 4-[(E)-(metil hidrazono)metil]benzoato de metila (ou seja, o produto da Etapa A) (0,475 g, 2,49 mmol) e 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benzeno (ou seja, o produto da Etapa B) (0,20 g, 0,83 mmol) em acetato de etila (6 ml) à temperatura ambiente, adicionou-se seqüencialmente *N*-clorossuccinimida (0,22 g, 1,7 mmol) e carbonato de potássio (0,23 g, 1,7 mmol). Após agitação por doze horas, a mistura de reação foi repartida entre água com gelo e acetato de etila. A fase orgânica foi lavada com água e salmoura, seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada. Purificação por meio de cromatografia de coluna sobre sílica gel entrou em eluição com acetato de etila a 2% em éter de petróleo e gerou o produto título na forma de semi-sólido (35 mg).

NMR ^1H (CDCl_3) δ 8,03 (d, 2H), 7,61 (d, 2H), 7,39 (s aparente, 3H), 3,92 (s, 3H), 3,91 (d, 1H), 3,40 (d, 1H), 3,11 (3H).

ETAPA D: PREPARAÇÃO DE ÁCIDO 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-1-METIL-5-(TRIFLUOROMETIL)-1H-PIRAZOL-3-IL]BENZÓICO.

A uma solução de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-metil-5-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-3-il]benzoato de metila (ou seja, o produto da Etapa C) (50 mg, 0,12 mmol) em etanol (2 ml), adicionou-se hidróxido de sódio (1 ml de uma solução aquosa de 0,24 M, 0,24 mmol) e a mistura resultante foi agitada a 60 °C por três horas. A mistura resultante foi concentrada para remover solvente e o resíduo foi acidificado até pH 2 e extraído em seguida com acetato de etila. Os extratos orgânicos foram combinados, lavados com salmoura, secos sobre sulfato de sódio anidro e concentrados para gerar o ácido carboxílico título (50 mg), que foi utilizado na etapa seguinte sem purificação.

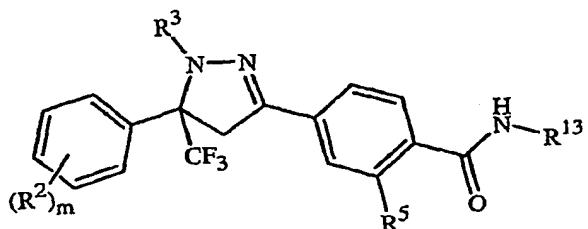
ETAPA E: PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DI-HIDRO-1-METIL-5-(TRIFLUOROMETIL)-1H-PIRAZOL-3-IL]-N-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)BENZAMIDA.

Uma solução de ácido 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-metil-5-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-3-il]benzóico (ou seja, o produto bruto da Etapa D) (50 mg, 0,12 mmol) e trietilamina (0,026 ml, 0,19 mmol) em tetraidrofuran (2 ml) à temperatura ambiente foi tratada com cloroformato de metila (0,014 ml, 0,19 mmol) e a mistura de reação foi agitada por trinta minutos. Em seguida, 2,2,2-trifluoroetilamina (0,015 ml, 0,19 mmol) foi adicionada à mistura de reação à temperatura ambiente, que foi agitada por mais duas horas e resfriada em 10 seguida por meio de despejamento em gelo. A mistura de reação foi extraída com acetato de etila e os extractos orgânicos foram lavados com água e salmoura, secos sobre sulfato de sódio anidro e concentrados. Purificação por meio de cromatografia sobre sílica gel em eluição com acetato de etila a 25% em éter de petróleo gerou o produto título, um composto de acordo com a 15 presente invenção, na forma de um sólido (40 mg, rendimento de 70%).

NMR ^1H (CDCl_3): δ 7,81 (d, 2H), 7,63 (d, 2H), 7,39 (s aparente, 3H), 6,36 (br t, 1H), 4,22-4,08 (m, 2H), 3,91 (d, 1H), 3,38 (d, 1H), 3,12 (s, 3H).

Por meio dos procedimentos descritos no presente, junto com métodos conhecidos na técnica, podem ser preparados os compostos a seguir 20 das Tabelas 1 a 8. As abreviações a seguir são utilizadas nas Tabelas que se seguem: CN indica ciano, NO₂ indica nitro, Me indica metila, Et indica etila, PR indica propila, c-Pr indica ciclopropila e OMe indica metóxi. $(\text{R}^2)_m$, conforme exibido, designa a combinação de $(\text{R}^2)_n$ quando Z é CR².

TABELA 1



$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-Cl	H	H	CH_2CF_3	3-Cl	H	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	H	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	H	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	H	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	3-CF ₃	H	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Br	H	H	CH_2CF_3	3-Br	H	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	3-Cl	Me	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	Me	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	3-CF ₃	Me	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Br	Me	H	CH_2CF_3	3-Br	Me	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$

$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	Et	H	CH_2CF_3	3-Cl	Et	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	Et	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	Et	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	Et	H	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	Et	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	Et	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	Et	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	Et	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Et	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	Et	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	Et	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	Et	H	CH_2CF_3	3-CF ₃	Et	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	H	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Br	Et	H	CH_2CF_3	3-Br	Et	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	Et	H	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	Et	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	CH_2CF_3	H	CH_2CF_3	3-Cl	CH_2CF_3	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	H	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	CH_2CF_3	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	CH_2CF_3	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	CH_2CF_3	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	CH_2CF_3	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	CH_2CF_3	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	CH_2CF_3	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	CH_2CF_3	H	CH_2CF_3	3-CF ₃	CH_2CF_3	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH_2CF_3	H	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH_2CF_3	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Br	CH_2CF_3	H	CH_2CF_3	3-Br	CH_2CF_3	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	H	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	CN	H	CH_2CF_3	3-Cl	CN	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	CN	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	CN	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	CN	H	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	CN	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	CN	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	CN	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	CN	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	CN	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	CN	H	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	CN	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	CN	H	CH_2CF_3	3-CF ₃	CN	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	H	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Br	CN	H	CH_2CF_3	3-Br	CN	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	CN	H	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	CN	H	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	H	NO_2	CH_2CF_3	3-Cl	H	NO_2	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	H	NO_2	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	NO_2	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	H	NO_2	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	NO_2	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	H	NO_2	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	H	NO_2	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	H	NO_2	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	H	NO_2	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	H	NO_2	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	H	NO_2	$CH_2-2\text{-pyridinyl}$

$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-CF ₃	H	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	H	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	H	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Br	H	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	H	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	H	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	Me	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl	Me	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	Me	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	Me	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	Me	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	Me	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	Me	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	Me	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	Me	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	Me	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	Me	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Br	Me	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	Me	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	Et	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl	Et	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	Et	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Et	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	Et	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Et	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	Et	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	Et	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	Et	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Et	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	Et	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Et	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	Et	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	Et	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	Et	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Br	Et	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	Et	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Et	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	CN	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl	CN	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	CN	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	CN	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	CN	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CN	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl

$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-Cl, 4-F	CN	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	CN	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	CN	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	CN	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	CN	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	CN	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	CN	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	CN	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	CN	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Br	CN	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	CN	NO ₂	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	CN	NO ₂	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl	H	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	H	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	H	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Br	H	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	H	Me	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	H	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	Me	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	Me	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Br	Me	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	Me	Me	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	Et	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl	Et	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	Et	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Et	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	Et	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Et	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	Et	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	Et	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	Et	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Et	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	Et	Me	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Et	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	Et	Me	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	Et	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	Me	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	Et	Me	CH ₂ CF ₃	3-Br	Et	Me	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	Et	Me	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Et	Me	CH ₂ -2-pyridinyl

$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-Cl	CH_2CF_3	Me	CH_2CF_3	3-Cl	CH_2CF_3	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	Me	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	CH_2CF_3	Me	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	CH_2CF_3	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	CH_2CF_3	Me	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	CH_2CF_3	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	CH_2CF_3	Me	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	CH_2CF_3	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	CH_2CF_3	Me	CH_2CF_3	3-CF ₃	CH_2CF_3	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH_2CF_3	Me	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH_2CF_3	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br	CH_2CF_3	Me	CH_2CF_3	3-Br	CH_2CF_3	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	Me	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	CN	Me	CH_2CF_3	3-Cl	CN	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	CN	Me	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	CN	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	CN	Me	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	CN	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	CN	Me	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	CN	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	CN	Me	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	CN	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	CN	Me	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	CN	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	CN	Me	CH_2CF_3	3-CF ₃	CN	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	Me	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br	CN	Me	CH_2CF_3	3-Br	CN	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	CN	Me	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	CN	Me	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	H	Cl	CH_2CF_3	3-Cl	H	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	H	Cl	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	H	Cl	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	H	Cl	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	H	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	H	Cl	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	H	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	H	Cl	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	H	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	H	Cl	CH_2CF_3	3-CF ₃	H	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	Cl	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br	H	Cl	CH_2CF_3	3-Br	H	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	H	Cl	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	H	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	Me	Cl	CH_2CF_3	3-Cl	Me	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	Me	Cl	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	Me	Cl	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	Me	Cl	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	Me	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	Me	Cl	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	Me	Cl	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	Me	Cl	CH_2CF_3	3-CF ₃	Me	Cl	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$

$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Br	Me	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	Et	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl	Et	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	Et	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Et	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	Et	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Et	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	Et	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	Et	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	Et	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Et	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	Et	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Et	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	Et	Cl	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	Et	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	Cl	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	Et	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Br	Et	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	Et	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Et	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Br	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	CN	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl	CN	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	CN	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	CN	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	CN	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CN	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	CN	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	CN	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	CN	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	CN	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	CN	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	CN	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	CN	Cl	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	CN	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	Cl	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	CN	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Br	CN	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	CN	Cl	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	CN	Cl	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl	H	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	H	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl

$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-Cl, 4-CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Br	H	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	H	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	Me	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl	Me	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	Me	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	Me	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	Me	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	Me	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	Me	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	Me	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	Me	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Br	Me	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	Me	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	Et	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl	Et	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	Et	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Et	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	Et	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Et	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	Et	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	Et	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	Et	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Et	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	Et	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Et	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	Et	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	Et	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	Et	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Br	Et	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	Et	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Et	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Br	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	CN	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl	CN	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl

$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-Cl, 4-Cl	CN	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	CN	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	CN	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CN	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	CN	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	CN	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	CN	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	CN	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	CN	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	CN	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	CN	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	CN	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	CN	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Br	CN	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	CN	CF ₃	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	CN	CF ₃	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	H	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl	H	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	H	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	H	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	H	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	H	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	H	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	H	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	H	CN	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	H	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	CN	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	H	CN	CH ₂ CF ₃	3-Br	H	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	H	CN	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	H	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	Me	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl	Me	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	Me	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	Me	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	Me	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	Me	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	Me	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	Me	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	Me	CN	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	Me	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	CN	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br	Me	CN	CH ₂ CF ₃	3-Br	Me	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Br, 5-Br	Me	CN	CH ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl	Et	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl	Et	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Cl	Et	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Et	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 5-Cl	Et	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Et	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-F	Et	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-F	Et	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-CF ₃	Et	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Et	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-Cl, 4-Br	Et	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Et	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃	Et	CN	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃	Et	CN	CH ₂ -2-pyridinyl
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	CN	CH ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	CN	CH ₂ -2-pyridinyl

$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-Br	Et	CN	CH_2CF_3	3-Br	Et	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	Et	CN	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	Et	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	CH_2CF_3	CN	CH_2CF_3	3-Cl	CH_2CF_3	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CN	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CN	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	CH_2CF_3	CN	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	CH_2CF_3	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	CH_2CF_3	CN	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	CH_2CF_3	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	CH_2CF_3	CN	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	CH_2CF_3	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	CH_2CF_3	CN	CH_2CF_3	3-CF ₃	CH_2CF_3	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH_2CF_3	CN	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH_2CF_3	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br	CH_2CF_3	CN	CH_2CF_3	3-Br	CH_2CF_3	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	CN	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	CN	CN	CH_2CF_3	3-Cl	CN	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	CN	CN	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	CN	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	CN	CN	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	CN	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	CN	CN	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	CN	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	CN	CN	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	CN	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	CN	CN	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	CN	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	CN	CN	CH_2CF_3	3-CF ₃	CN	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	CN	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br	CN	CN	CH_2CF_3	3-Br	CN	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	CN	CN	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	CN	CN	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	H	OMe	CH_2CF_3	3-Cl	H	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	H	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	H	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	H	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	H	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	H	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	H	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	H	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	H	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	H	OMe	CH_2CF_3	3-CF ₃	H	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	OMe	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br	H	OMe	CH_2CF_3	3-Br	H	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	H	OMe	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	H	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	Me	OMe	CH_2CF_3	3-Cl	Me	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	Me	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	Me	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	Me	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	Me	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	Me	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$

$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-Cl, 4-Br	Me	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	Me	OMe	CH_2CF_3	3-CF ₃	Me	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	OMe	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br	Me	OMe	CH_2CF_3	3-Br	Me	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	Me	OMe	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	Me	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	Et	OMe	CH_2CF_3	3-Cl	Et	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	Et	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	Et	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	Et	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	Et	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	Et	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	Et	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	Et	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Et	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	Et	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	Et	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	Et	OMe	CH_2CF_3	3-CF ₃	Et	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	OMe	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br	Et	OMe	CH_2CF_3	3-Br	Et	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	Et	OMe	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	Et	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	CH_2CF_3	OMe	CH_2CF_3	3-Cl	CH_2CF_3	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	CH_2CF_3	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	CH_2CF_3	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	CH_2CF_3	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	CH_2CF_3	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	CH_2CF_3	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	CH_2CF_3	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	CH_2CF_3	OMe	CH_2CF_3	3-CF ₃	CH_2CF_3	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH_2CF_3	OMe	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH_2CF_3	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br	CH_2CF_3	OMe	CH_2CF_3	3-Br	CH_2CF_3	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	OMe	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	CN	OMe	CH_2CF_3	3-Cl	CN	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Cl	CN	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Cl	CN	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 5-Cl	CN	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 5-Cl	CN	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-F	CN	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-F	CN	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-CF ₃	CN	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	CN	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl, 4-Br	CN	OMe	CH_2CF_3	3-Cl, 4-Br	CN	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃	CN	OMe	CH_2CF_3	3-CF ₃	CN	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	OMe	CH_2CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br	CN	OMe	CH_2CF_3	3-Br	CN	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Br, 5-Br	CN	OMe	CH_2CF_3	3-Br, 5-Br	CN	OMe	$CH_2\text{-}2\text{-pyridinyl}$
3-Cl	H	H	Et	3-Cl	H	NO ₂	Et
3-Cl, 4-Cl	H	H	Et	3-Cl, 4-Cl	H	NO ₂	Et

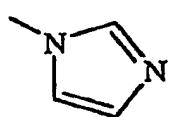
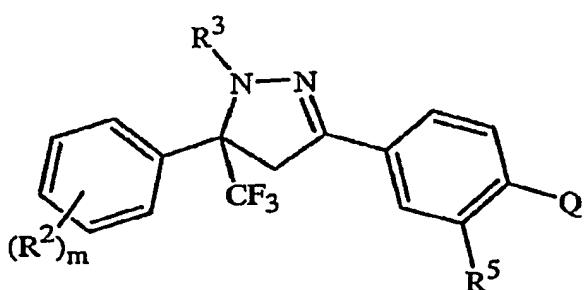
$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-Cl, 5-Cl	H	H	Et	3-Cl, 5-Cl	H	NO ₂	Et
3-Cl, 4-F	H	H	Et	3-Cl, 4-F	H	NO ₂	Et
3-Cl, 4-CF ₃	H	H	Et	3-Cl, 4-CF ₃	H	NO ₂	Et
3-Cl, 4-Br	H	H	Et	3-Cl, 4-Br	H	NO ₂	Et
3-CF ₃	H	H	Et	3-CF ₃	H	NO ₂	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	NO ₂	Et
3-Br	H	H	Et	3-Br	H	NO ₂	Et
3-Br, 5-Br	H	H	Et	3-Br, 5-Br	H	NO ₂	Et
3-Cl	Me	H	Et	3-Cl	Me	NO ₂	Et
3-Cl, 4-Cl	Me	H	Et	3-Cl, 4-Cl	Me	NO ₂	Et
3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et	3-Cl, 5-Cl	Me	NO ₂	Et
3-Cl, 4-F	Me	H	Et	3-Cl, 4-F	Me	NO ₂	Et
3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	Et	3-Cl, 4-CF ₃	Me	NO ₂	Et
3-Cl, 4-Br	Me	H	Et	3-Cl, 4-Br	Me	NO ₂	Et
3-CF ₃	Me	H	Et	3-CF ₃	Me	NO ₂	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	NO ₂	Et
3-Br	Me	H	Et	3-Br	Me	NO ₂	Et
3-Br, 5-Br	Me	H	Et	3-Br, 5-Br	Me	NO ₂	Et
3-Cl	Et	H	Et	3-Cl	Et	NO ₂	Et
3-Cl, 4-Cl	Et	H	Et	3-Cl, 4-Cl	Et	NO ₂	Et
3-Cl, 5-Cl	Et	H	Et	3-Cl, 5-Cl	Et	NO ₂	Et
3-Cl, 4-F	Et	H	Et	3-Cl, 4-F	Et	NO ₂	Et
3-Cl, 4-CF ₃	Et	H	Et	3-Cl, 4-CF ₃	Et	NO ₂	Et
3-Cl, 4-Br	Et	H	Et	3-Cl, 4-Br	Et	NO ₂	Et
3-CF ₃	Et	H	Et	3-CF ₃	Et	NO ₂	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	H	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	NO ₂	Et
3-Br	Et	H	Et	3-Br	Et	NO ₂	Et
3-Br, 5-Br	Et	H	Et	3-Br, 5-Br	Et	NO ₂	Et
3-Cl	CH ₂ CF ₃	H	Et	3-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Et
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	H	Et	3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Et
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	H	Et	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Et
3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	H	Et	3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Et
3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	Et	3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Et
3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	H	Et	3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Et
3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	Et	3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Et
3-Br	CH ₂ CF ₃	H	Et	3-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Et

$(R^2)_m$	R ³	R ⁵	R ¹³	$(R^2)_m$	R ³	R ⁵	R ¹³
3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	H	Et	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Et
3-Cl	CN	H	Et	3-Cl	CN	NO ₂	Et
3-Cl, 4-Cl	CN	H	Et	3-Cl, 4-Cl	CN	NO ₂	Et
3-Cl, 5-Cl	CN	H	Et	3-Cl, 5-Cl	CN	NO ₂	Et
3-Cl, 4-F	CN	H	Et	3-Cl, 4-F	CN	NO ₂	Et
3-Cl, 4-CF ₃	CN	H	Et	3-Cl, 4-CF ₃	CN	NO ₂	Et
3-Cl, 4-Br	CN	H	Et	3-Cl, 4-Br	CN	NO ₂	Et
3-CF ₃	CN	H	Et	3-CF ₃	CN	NO ₂	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	H	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	NO ₂	Et
3-Br	CN	H	Et	3-Br	CN	NO ₂	Et
3-Br, 5-Br	CN	H	Et	3-Br, 5-Br	CN	NO ₂	Et
3-Cl	H	Me	Et	3-Cl	H	Cl	Et
3-Cl, 4-Cl	H	Me	Et	3-Cl, 4-Cl	H	Cl	Et
3-Cl, 5-Cl	H	Me	Et	3-Cl, 5-Cl	H	Cl	Et
3-Cl, 4-F	H	Me	Et	3-Cl, 4-F	H	Cl	Et
3-Cl, 4-CF ₃	H	Me	Et	3-Cl, 4-CF ₃	H	Cl	Et
3-Cl, 4-Br	H	Me	Et	3-Cl, 4-Br	H	Cl	Et
3-CF ₃	H	Me	Et	3-CF ₃	H	Cl	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	Me	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	Cl	Et
3-Br	H	Me	Et	3-Br	H	Cl	Et
3-Br, 5-Br	H	Me	Et	3-Br, 5-Br	H	Cl	Et
3-Cl	Me	Me	Et	3-Cl	Me	Cl	Et
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	Et	3-Cl, 4-Cl	Me	Cl	Et
3-Cl, 5-Cl	Me	Me	Et	3-Cl, 5-Cl	Me	Cl	Et
3-Cl, 4-F	Me	Me	Et	3-Cl, 4-F	Me	Cl	Et
3-Cl, 4-CF ₃	Me	Me	Et	3-Cl, 4-CF ₃	Me	Cl	Et
3-Cl, 4-Br	Me	Me	Et	3-Cl, 4-Br	Me	Cl	Et
3-CF ₃	Me	Me	Et	3-CF ₃	Me	Cl	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	Me	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	Cl	Et
3-Br	Me	Me	Et	3-Br	Me	Cl	Et
3-Br, 5-Br	Me	Me	Et	3-Br, 5-Br	Me	Cl	Et
3-Cl	Et	Me	Et	3-Cl	Et	Cl	Et
3-Cl, 4-Cl	Et	Me	Et	3-Cl, 4-Cl	Et	Cl	Et
3-Cl, 5-Cl	Et	Me	Et	3-Cl, 5-Cl	Et	Cl	Et
3-Cl, 4-F	Et	Me	Et	3-Cl, 4-F	Et	Cl	Et
3-Cl, 4-CF ₃	Et	Me	Et	3-Cl, 4-CF ₃	Et	Cl	Et
3-Cl, 4-Br	Et	Me	Et	3-Cl, 4-Br	Et	Cl	Et

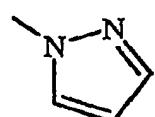
$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-CF ₃	Et	Me	Et	3-CF ₃	Et	Cl	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	Me	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	Cl	Et
3-Br	Et	Me	Et	3-Br	Et	Cl	Et
3-Br, 5-Br	Et	Me	Et	3-Br, 5-Br	Et	Cl	Et
3-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	Et	3-Cl	CH ₂ CF ₃	Cl	Et
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	Et	3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Cl	Et
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	Et	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Cl	Et
3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	Me	Et	3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	Cl	Et
3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Me	Et	3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl	Et
3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	Me	Et	3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	Cl	Et
3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Me	Et	3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Me	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	Cl	Et
3-Br	CH ₂ CF ₃	Me	Et	3-Br	CH ₂ CF ₃	Cl	Et
3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	Me	Et	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	Cl	Et
3-Cl	CN	Me	Et	3-Cl	CN	Cl	Et
3-Cl, 4-Cl	CN	Me	Et	3-Cl, 4-Cl	CN	Cl	Et
3-Cl, 5-Cl	CN	Me	Et	3-Cl, 5-Cl	CN	Cl	Et
3-Cl, 4-F	CN	Me	Et	3-Cl, 4-F	CN	Cl	Et
3-Cl, 4-CF ₃	CN	Me	Et	3-Cl, 4-CF ₃	CN	Cl	Et
3-Cl, 4-Br	CN	Me	Et	3-Cl, 4-Br	CN	Cl	Et
3-CF ₃	CN	Me	Et	3-CF ₃	CN	Cl	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	Me	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	Cl	Et
3-Br	CN	Me	Et	3-Br	CN	Cl	Et
3-Br, 5-Br	CN	Me	Et	3-Br, 5-Br	CN	Cl	Et
3-Cl	H	CF ₃	Et	3-Cl	H	CN	Et
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	Et	3-Cl, 4-Cl	H	CN	Et
3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	Et	3-Cl, 5-Cl	H	CN	Et
3-Cl, 4-F	H	CF ₃	Et	3-Cl, 4-F	H	CN	Et
3-Cl, 4-CF ₃	H	CF ₃	Et	3-Cl, 4-CF ₃	H	CN	Et
3-Cl, 4-Br	H	CF ₃	Et	3-Cl, 4-Br	H	CN	Et
3-CF ₃	H	CF ₃	Et	3-CF ₃	H	CN	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	CF ₃	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	CN	Et
3-Br	H	CF ₃	Et	3-Br	H	CN	Et
3-Br, 5-Br	H	CF ₃	Et	3-Br, 5-Br	H	CN	Et
3-Cl	Me	CF ₃	Et	3-Cl	Me	CN	Et
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	Et	3-Cl, 4-Cl	Me	CN	Et
3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	Et	3-Cl, 5-Cl	Me	CN	Et

$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-Cl, 4-F	Me	CF ₃	Et	3-Cl, 4-F	Me	CN	Et
3-Cl, 4-CF ₃	Me	CF ₃	Et	3-Cl, 4-CF ₃	Me	CN	Et
3-Cl, 4-Br	Me	CF ₃	Et	3-Cl, 4-Br	Me	CN	Et
3-CF ₃	Me	CF ₃	Et	3-CF ₃	Me	CN	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	CF ₃	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	CN	Et
3-Br	Me	CF ₃	Et	3-Br	Me	CN	Et
3-Br, 5-Br	Me	CF ₃	Et	3-Br, 5-Br	Me	CN	Et
3-Cl	Et	CF ₃	Et	3-Cl	Et	CN	Et
3-Cl, 4-Cl	Et	CF ₃	Et	3-Cl, 4-Cl	Et	CN	Et
3-Cl, 5-Cl	Et	CF ₃	Et	3-Cl, 5-Cl	Et	CN	Et
3-Cl, 4-F	Et	CF ₃	Et	3-Cl, 4-F	Et	CN	Et
3-Cl, 4-CF ₃	Et	CF ₃	Et	3-Cl, 4-CF ₃	Et	CN	Et
3-Cl, 4-Br	Et	CF ₃	Et	3-Cl, 4-Br	Et	CN	Et
3-CF ₃	Et	CF ₃	Et	3-CF ₃	Et	CN	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	CF ₃	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	CN	Et
3-Br	Et	CF ₃	Et	3-Br	Et	CN	Et
3-Br, 5-Br	Et	CF ₃	Et	3-Br, 5-Br	Et	CN	Et
3-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Et	3-Cl	CH ₂ CF ₃	CN	Et
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Et	3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CN	Et
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Et	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CN	Et
3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Et	3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	CN	Et
3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Et	3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CN	Et
3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Et	3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	CN	Et
3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Et	3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CN	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	CN	Et
3-Br	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Et	3-Br	CH ₂ CF ₃	CN	Et
3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Et	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	CN	Et
3-Cl	CN	CF ₃	Et	3-Cl	CN	CN	Et
3-Cl, 4-Cl	CN	CF ₃	Et	3-Cl, 4-Cl	CN	CN	Et
3-Cl, 5-Cl	CN	CF ₃	Et	3-Cl, 5-Cl	CN	CN	Et
3-Cl, 4-F	CN	CF ₃	Et	3-Cl, 4-F	CN	CN	Et
3-Cl, 4-CF ₃	CN	CF ₃	Et	3-Cl, 4-CF ₃	CN	CN	Et
3-Cl, 4-Br	CN	CF ₃	Et	3-Cl, 4-Br	CN	CN	Et
3-CF ₃	CN	CF ₃	Et	3-CF ₃	CN	CN	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	CF ₃	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	CN	Et
3-Br	CN	CF ₃	Et	3-Br	CN	CN	Et
3-Br, 5-Br	CN	CF ₃	Et	3-Br, 5-Br	CN	CN	Et

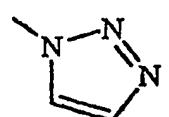
$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}	$(R^2)_m$	R^3	R^5	R^{13}
3-Cl	H	OMe	Et	3-Cl	Et	OMe	Et
3-Cl, 4-Cl	H	OMe	Et	3-Cl, 4-Cl	Et	OMe	Et
3-Cl, 5-Cl	H	OMe	Et	3-Cl, 5-Cl	Et	OMe	Et
3-Cl, 4-F	H	OMe	Et	3-Cl, 4-F	Et	OMe	Et
3-Cl, 4-CF ₃	H	OMe	Et	3-Cl, 4-CF ₃	Et	OMe	Et
3-Cl, 4-Br	H	OMe	Et	3-Cl, 4-Br	Et	OMe	Et
3-CF ₃	H	OMe	Et	3-CF ₃	Et	OMe	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	OMe	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	OMe	Et
3-Br	H	OMe	Et	3-Br	Et	OMe	Et
3-Br, 5-Br	H	OMe	Et	3-Br, 5-Br	Et	OMe	Et
3-Cl	Me	OMe	Et	3-Cl	CH ₂ CF ₃	OMe	Et
3-Cl, 4-Cl	Me	OMe	Et	3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	OMe	Et
3-Cl, 5-Cl	Me	OMe	Et	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	OMe	Et
3-Cl, 4-F	Me	OMe	Et	3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	OMe	Et
3-Cl, 4-CF ₃	Me	OMe	Et	3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	OMe	Et
3-Cl, 4-Br	Me	OMe	Et	3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	OMe	Et
3-CF ₃	Me	OMe	Et	3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	OMe	Et
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	OMe	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	OMe	Et
3-Br	Me	OMe	Et	3-Br	CH ₂ CF ₃	OMe	Et
3-Br, 5-Br	Me	OMe	Et	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	OMe	Et
3-Cl	CN	OMe	Et	3-Cl, 4-Br	CN	OMe	Et
3-Cl, 4-Cl	CN	OMe	Et	3-CF ₃	CN	OMe	Et
3-Cl, 5-Cl	CN	OMe	Et	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	OMe	Et
3-Cl, 4-F	CN	OMe	Et	3-Br	CN	OMe	Et
3-Cl, 4-CF ₃	CN	OMe	Et	3-Br, 5-Br	CN	OMe	Et

TABELA 2

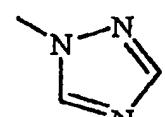
Q-1



Q-2



Q-3



Q-4

$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q	$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q
3-Cl, 5-Cl	H	H	Q-1	3-Br, 5-Br	H	H	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Me	H	Q-1	3-Br, 5-Br	Me	H	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Et	H	Q-1	3-Br, 5-Br	Et	H	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	H	Q-1	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	H	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CN	H	Q-1	3-Br, 5-Br	CN	H	Q-1
3-Cl, 5-Cl	H	NO_2	Q-1	3-Br, 5-Br	H	NO_2	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Me	NO_2	Q-1	3-Br, 5-Br	Me	NO_2	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Et	NO_2	Q-1	3-Br, 5-Br	Et	NO_2	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	NO_2	Q-1	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	NO_2	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CN	NO_2	Q-1	3-Br, 5-Br	CN	NO_2	Q-1
3-Cl, 5-Cl	H	Me	Q-1	3-Br, 5-Br	H	Me	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Me	Me	Q-1	3-Br, 5-Br	Me	Me	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Et	Me	Q-1	3-Br, 5-Br	Et	Me	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	Q-1	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	Me	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CN	Me	Q-1	3-Br, 5-Br	CN	Me	Q-1
3-Cl, 5-Cl	H	Cl	Q-1	3-Br, 5-Br	H	Cl	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Me	Cl	Q-1	3-Br, 5-Br	Me	Cl	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Et	Cl	Q-1	3-Br, 5-Br	Et	Cl	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Cl	Q-1	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	Cl	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CN	Cl	Q-1	3-Br, 5-Br	CN	Cl	Q-1
3-Cl, 5-Cl	H	CF_3	Q-1	3-Br, 5-Br	H	CF_3	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Me	CF_3	Q-1	3-Br, 5-Br	Me	CF_3	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Et	CF_3	Q-1	3-Br, 5-Br	Et	CF_3	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CF_3	Q-1	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	CF_3	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CN	CF_3	Q-1	3-Br, 5-Br	CN	CF_3	Q-1
3-Cl, 5-Cl	H	CN	Q-1	3-Br, 5-Br	H	CN	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Me	CN	Q-1	3-Br, 5-Br	Me	CN	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Et	CN	Q-1	3-Br, 5-Br	Et	CN	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CN	Q-1	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	CN	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CN	CN	Q-1	3-Br, 5-Br	CN	CN	Q-1
3-Cl, 5-Cl	H	OMe	Q-1	3-Br, 5-Br	H	OMe	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Me	OMe	Q-1	3-Br, 5-Br	Me	OMe	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Et	OMe	Q-1	3-Br, 5-Br	Et	OMe	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	OMe	Q-1	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	OMe	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CN	OMe	Q-1	3-Br, 5-Br	CN	OMe	Q-1
3-Cl, 5-Cl	H	H	Q-2	3-Br, 5-Br	H	H	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Me	H	Q-2	3-Br, 5-Br	Me	H	Q-2

$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q	$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q
3-Cl, 5-Cl	Et	H	Q-2	3-Br, 5-Br	Et	H	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	H	Q-2	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	H	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CN	H	Q-2	3-Br, 5-Br	CN	H	Q-2
3-Cl, 5-Cl	H	NO_2	Q-2	3-Br, 5-Br	H	NO_2	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Me	NO_2	Q-2	3-Br, 5-Br	Me	NO_2	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Et	NO_2	Q-2	3-Br, 5-Br	Et	NO_2	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	NO_2	Q-2	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	NO_2	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CN	NO_2	Q-2	3-Br, 5-Br	CN	NO_2	Q-2
3-Cl, 5-Cl	H	Me	Q-2	3-Br, 5-Br	H	Me	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Me	Me	Q-2	3-Br, 5-Br	Me	Me	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Et	Me	Q-2	3-Br, 5-Br	Et	Me	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	Q-2	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	Me	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CN	Me	Q-2	3-Br, 5-Br	CN	Me	Q-2
3-Cl, 5-Cl	H	Cl	Q-2	3-Br, 5-Br	H	Cl	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Me	Cl	Q-2	3-Br, 5-Br	Me	Cl	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Et	Cl	Q-2	3-Br, 5-Br	Et	Cl	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Cl	Q-2	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	Cl	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CN	Cl	Q-2	3-Br, 5-Br	CN	Cl	Q-2
3-Cl, 5-Cl	H	CF_3	Q-2	3-Br, 5-Br	H	CF_3	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Me	CF_3	Q-2	3-Br, 5-Br	Me	CF_3	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Et	CF_3	Q-2	3-Br, 5-Br	Et	CF_3	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CF_3	Q-2	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	CF_3	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CN	CF_3	Q-2	3-Br, 5-Br	CN	CF_3	Q-2
3-Cl, 5-Cl	H	CN	Q-2	3-Br, 5-Br	H	CN	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Me	CN	Q-2	3-Br, 5-Br	Me	CN	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Et	CN	Q-2	3-Br, 5-Br	Et	CN	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CN	Q-2	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	CN	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CN	CN	Q-2	3-Br, 5-Br	CN	CN	Q-2
3-Cl, 5-Cl	H	OMe	Q-2	3-Br, 5-Br	H	OMe	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Me	OMe	Q-2	3-Br, 5-Br	Me	OMe	Q-2
3-Cl, 5-Cl	Et	OMe	Q-2	3-Br, 5-Br	Et	OMe	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	OMe	Q-2	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	OMe	Q-2
3-Cl, 5-Cl	CN	OMe	Q-2	3-Br, 5-Br	CN	OMe	Q-2
3-Cl, 5-Cl	H	H	Q-3	3-Br, 5-Br	H	H	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Me	H	Q-3	3-Br, 5-Br	Me	H	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Et	H	Q-3	3-Br, 5-Br	Et	H	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	H	Q-3	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	H	Q-3

$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q	$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q
3-Cl, 5-Cl	CN	H	Q-3	3-Br, 5-Br	CN	H	Q-3
3-Cl, 5-Cl	H	NO ₂	Q-3	3-Br, 5-Br	H	NO ₂	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Me	NO ₂	Q-3	3-Br, 5-Br	Me	NO ₂	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Et	NO ₂	Q-3	3-Br, 5-Br	Et	NO ₂	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-3	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CN	NO ₂	Q-3	3-Br, 5-Br	CN	NO ₂	Q-3
3-Cl, 5-Cl	H	Me	Q-3	3-Br, 5-Br	H	Me	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Me	Me	Q-3	3-Br, 5-Br	Me	Me	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Et	Me	Q-3	3-Br, 5-Br	Et	Me	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	Q-3	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	Me	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CN	Me	Q-3	3-Br, 5-Br	CN	Me	Q-3
3-Cl, 5-Cl	H	Cl	Q-3	3-Br, 5-Br	H	Cl	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Me	Cl	Q-3	3-Br, 5-Br	Me	Cl	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Et	Cl	Q-3	3-Br, 5-Br	Et	Cl	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Cl	Q-3	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	Cl	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CN	Cl	Q-3	3-Br, 5-Br	CN	Cl	Q-3
3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	Q-3	3-Br, 5-Br	H	CF ₃	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	Q-3	3-Br, 5-Br	Me	CF ₃	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Et	CF ₃	Q-3	3-Br, 5-Br	Et	CF ₃	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Q-3	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CN	CF ₃	Q-3	3-Br, 5-Br	CN	CF ₃	Q-3
3-Cl, 5-Cl	H	CN	Q-3	3-Br, 5-Br	H	CN	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Me	CN	Q-3	3-Br, 5-Br	Me	CN	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Et	CN	Q-3	3-Br, 5-Br	Et	CN	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CN	Q-3	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	CN	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CN	CN	Q-3	3-Br, 5-Br	CN	CN	Q-3
3-Cl, 5-Cl	H	OMe	Q-3	3-Br, 5-Br	H	OMe	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Me	OMe	Q-3	3-Br, 5-Br	Me	OMe	Q-3
3-Cl, 5-Cl	Et	OMe	Q-3	3-Br, 5-Br	Et	OMe	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-3	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-3
3-Cl, 5-Cl	CN	OMe	Q-3	3-Br, 5-Br	CN	OMe	Q-3
3-Cl	H	H	Q-4	3-Cl	H	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	H	Q-4	3-Cl, 4-Cl	H	NO ₂	Q-4
3-Cl, 5-Cl	H	H	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-F	H	H	Q-4	3-Cl, 4-F	H	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	H	H	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	H	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-Br	H	H	Q-4	3-Cl, 4-Br	H	NO ₂	Q-4

$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q	$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q
3-CF ₃	H	H	Q-4	3-CF ₃	H	NO ₂	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	NO ₂	Q-4
3-Br	H	H	Q-4	3-Br	H	NO ₂	Q-4
3-Br, 5-Br	H	H	Q-4	3-Br, 5-Br	H	NO ₂	Q-4
3-Cl	Me	H	Q-4	3-Cl	Me	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	H	Q-4	3-Cl, 4-Cl	Me	NO ₂	Q-4
3-Cl, 5-Cl	Me	H	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-F	Me	H	Q-4	3-Cl, 4-F	Me	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	Me	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-Br	Me	H	Q-4	3-Cl, 4-Br	Me	NO ₂	Q-4
3-CF ₃	Me	H	Q-4	3-CF ₃	Me	NO ₂	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	NO ₂	Q-4
3-Br	Me	H	Q-4	3-Br	Me	NO ₂	Q-4
3-Br, 5-Br	Me	H	Q-4	3-Br, 5-Br	Me	NO ₂	Q-4
3-Cl	Et	H	Q-4	3-Cl	Et	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Et	H	Q-4	3-Cl, 4-Cl	Et	NO ₂	Q-4
3-Cl, 5-Cl	Et	H	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Et	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-F	Et	H	Q-4	3-Cl, 4-F	Et	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	Et	H	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	Et	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-Br	Et	H	Q-4	3-Cl, 4-Br	Et	NO ₂	Q-4
3-CF ₃	Et	H	Q-4	3-CF ₃	Et	NO ₂	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	H	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	NO ₂	Q-4
3-Br	Et	H	Q-4	3-Br	Et	NO ₂	Q-4
3-Br, 5-Br	Et	H	Q-4	3-Br, 5-Br	Et	NO ₂	Q-4
3-Cl	CH ₂ CF ₃	H	Q-4	3-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	H	Q-4	3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-4
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	H	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	H	Q-4	3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	H	Q-4	3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-4
3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	Q-4	3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-4
3-Br	CH ₂ CF ₃	H	Q-4	3-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-4
3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	H	Q-4	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	NO ₂	Q-4
3-Cl	CN	H	Q-4	3-Cl	CN	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CN	H	Q-4	3-Cl, 4-Cl	CN	NO ₂	Q-4
3-Cl, 5-Cl	CN	H	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CN	NO ₂	Q-4

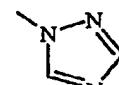
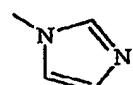
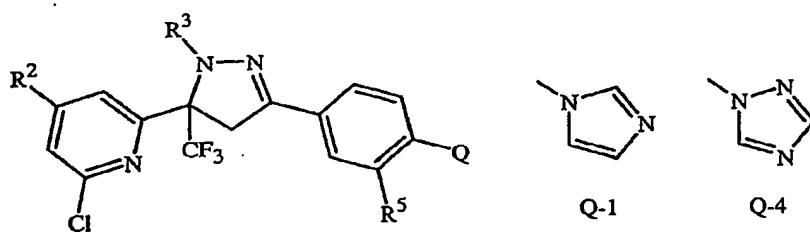
$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q	$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q
3-Cl, 4-F	CN	H	Q-4	3-Cl, 4-F	CN	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	CN	H	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	CN	NO ₂	Q-4
3-Cl, 4-Br	CN	H	Q-4	3-Cl, 4-Br	CN	NO ₂	Q-4
3-CF ₃	CN	H	Q-4	3-CF ₃	CN	NO ₂	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	H	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	NO ₂	Q-4
3-Br	CN	H	Q-4	3-Br	CN	NO ₂	Q-4
3-Br, 5-Br	CN	H	Q-4	3-Br, 5-Br	CN	NO ₂	Q-4
3-Cl	H	Me	Q-4	3-Cl	H	Cl	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	Me	Q-4	3-Cl, 4-Cl	H	Cl	Q-4
3-Cl, 5-Cl	H	Me	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	Cl	Q-4
3-Cl, 4-F	H	Me	Q-4	3-Cl, 4-F	H	Cl	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	H	Me	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	H	Cl	Q-4
3-Cl, 4-Br	H	Me	Q-4	3-Cl, 4-Br	H	Cl	Q-4
3-CF ₃	H	Me	Q-4	3-CF ₃	H	Cl	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	Me	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	Cl	Q-4
3-Br	H	Me	Q-4	3-Br	H	Cl	Q-4
3-Br, 5-Br	H	Me	Q-4	3-Br, 5-Br	H	Cl	Q-4
3-Cl	Me	Me	Q-4	3-Cl	Me	Cl	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	Q-4	3-Cl, 4-Cl	Me	Cl	Q-4
3-Cl, 5-Cl	Me	Me	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	Cl	Q-4
3-Cl, 4-F	Me	Me	Q-4	3-Cl, 4-F	Me	Cl	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	Me	Me	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	Me	Cl	Q-4
3-Cl, 4-Br	Me	Me	Q-4	3-Cl, 4-Br	Me	Cl	Q-4
3-CF ₃	Me	Me	Q-4	3-CF ₃	Me	Cl	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	Me	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	Cl	Q-4
3-Br	Me	Me	Q-4	3-Br	Me	Cl	Q-4
3-Br, 5-Br	Me	Me	Q-4	3-Br, 5-Br	Me	Cl	Q-4
3-Cl	Et	Me	Q-4	3-Cl	Et	Cl	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Et	Me	Q-4	3-Cl, 4-Cl	Et	Cl	Q-4
3-Cl, 5-Cl	Et	Me	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Et	Cl	Q-4
3-Cl, 4-F	Et	Me	Q-4	3-Cl, 4-F	Et	Cl	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	Et	Me	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	Et	Cl	Q-4
3-Cl, 4-Br	Et	Me	Q-4	3-Cl, 4-Br	Et	Cl	Q-4
3-CF ₃	Et	Me	Q-4	3-CF ₃	Et	Cl	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	Me	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	Cl	Q-4
3-Br	Et	Me	Q-4	3-Br	Et	Cl	Q-4
3-Br, 5-Br	Et	Me	Q-4	3-Br, 5-Br	Et	Cl	Q-4

$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q	$(R^2)_m$	R^3	R^5	Q
3-Cl	CH_2CF_3	Me	Q-4	3-Cl	CH_2CF_3	Cl	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	Me	Q-4	3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	Cl	Q-4
3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Cl	Q-4
3-Cl, 4-F	CH_2CF_3	Me	Q-4	3-Cl, 4-F	CH_2CF_3	Cl	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	CH_2CF_3	Me	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	CH_2CF_3	Cl	Q-4
3-Cl, 4-Br	CH_2CF_3	Me	Q-4	3-Cl, 4-Br	CH_2CF_3	Cl	Q-4
3-CF ₃	CH_2CF_3	Me	Q-4	3-CF ₃	CH_2CF_3	Cl	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH_2CF_3	Me	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH_2CF_3	Cl	Q-4
3-Br	CH_2CF_3	Me	Q-4	3-Br	CH_2CF_3	Cl	Q-4
3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	Me	Q-4	3-Br, 5-Br	CH_2CF_3	Cl	Q-4
3-Cl	CN	Me	Q-4	3-Cl	CN	Cl	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CN	Me	Q-4	3-Cl, 4-Cl	CN	Cl	Q-4
3-Cl, 5-Cl	CN	Me	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CN	Cl	Q-4
3-Cl, 4-F	CN	Me	Q-4	3-Cl, 4-F	CN	Cl	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	CN	Me	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	CN	Cl	Q-4
3-Cl, 4-Br	CN	Me	Q-4	3-Cl, 4-Br	CN	Cl	Q-4
3-CF ₃	CN	Me	Q-4	3-CF ₃	CN	Cl	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	Me	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	Cl	Q-4
3-Br	CN	Me	Q-4	3-Br	CN	Cl	Q-4
3-Br, 5-Br	CN	Me	Q-4	3-Br, 5-Br	CN	Cl	Q-4
3-Cl	H	CF ₃	Q-4	3-Cl	H	CN	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	Q-4	3-Cl, 4-Cl	H	CN	Q-4
3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	CN	Q-4
3-Cl, 4-F	H	CF ₃	Q-4	3-Cl, 4-F	H	CN	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	H	CF ₃	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	H	CN	Q-4
3-Cl, 4-Br	H	CF ₃	Q-4	3-Cl, 4-Br	H	CN	Q-4
3-CF ₃	H	CF ₃	Q-4	3-CF ₃	H	CN	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	CF ₃	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	CN	Q-4
3-Br	H	CF ₃	Q-4	3-Br	H	CN	Q-4
3-Br, 5-Br	H	CF ₃	Q-4	3-Br, 5-Br	H	CN	Q-4
3-Cl	Me	CF ₃	Q-4	3-Cl	Me	CN	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	Q-4	3-Cl, 4-Cl	Me	CN	Q-4
3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	CN	Q-4
3-Cl, 4-F	Me	CF ₃	Q-4	3-Cl, 4-F	Me	CN	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	Me	CF ₃	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	Me	CN	Q-4
3-Cl, 4-Br	Me	CF ₃	Q-4	3-Cl, 4-Br	Me	CN	Q-4
3-CF ₃	Me	CF ₃	Q-4	3-CF ₃	Me	CN	Q-4

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

<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>	<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>
3-Cl, 4-CF ₃	H	OMe	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	Et	OMe	Q-4
3-Cl, 4-Br	H	OMe	Q-4	3-Cl, 4-Br	Et	OMe	Q-4
3-CF ₃	H	OMe	Q-4	3-CF ₃	Et	OMe	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	OMe	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Et	OMe	Q-4
3-Br	H	OMe	Q-4	3-Br	Et	OMe	Q-4
3-Br, 5-Br	H	OMe	Q-4	3-Br, 5-Br	Et	OMe	Q-4
3-Cl	Me	OMe	Q-4	3-Cl	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	OMe	Q-4	3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-4
3-Cl, 5-Cl	Me	OMe	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-4
3-Cl, 4-F	Me	OMe	Q-4	3-Cl, 4-F	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	Me	OMe	Q-4	3-Cl, 4-CF ₃	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-4
3-Cl, 4-Br	Me	OMe	Q-4	3-Cl, 4-Br	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-4
3-CF ₃	Me	OMe	Q-4	3-CF ₃	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-4
3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	OMe	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-4
3-Br	Me	OMe	Q-4	3-Br	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-4
3-Br, 5-Br	Me	OMe	Q-4	3-Br, 5-Br	CH ₂ CF ₃	OMe	Q-4
3-Cl	CN	OMe	Q-4	3-Cl, 4-Br	CN	OMe	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CN	OMe	Q-4	3-CF ₃	CN	OMe	Q-4
3-Cl, 5-Cl	CN	OMe	Q-4	3-CF ₃ , 5-CF ₃	CN	OMe	Q-4
3-Cl, 4-F	CN	OMe	Q-4	3-Br	CN	OMe	Q-4
3-Cl, 4-CF ₃	CN	OMe	Q-4	3-Br, 5-Br	CN	OMe	Q-4

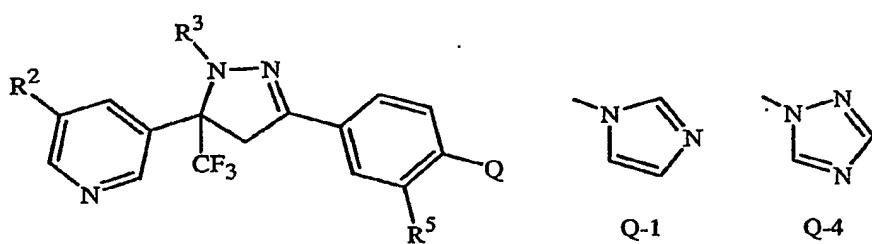
TABELA 3



<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>
Cl	H	H	Q-1	Cl	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₃	H	H	Q-1	CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	Me	H	Q-1	Cl	Me	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₃	Me	H	Q-1	CF ₃	Me	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	H	Me	Q-1	Cl	H	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Me	Q-1	CF ₃	H	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	Me	Me	Q-1	Cl	Me	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃

<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	Q	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	Q
CF ₃	Me	Me	Q-1	CF ₃	Me	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	H	Cl	Q-1	Cl	H	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Cl	Q-1	CF ₃	H	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	Me	Cl	Q-1	Cl	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₃	Me	Cl	Q-1	CF ₃	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	H	H	Q-4	Cl	H	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	H	H	Q-4	CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Cl	Me	H	Q-4	Cl	Me	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	Me	H	Q-4	CF ₃	Me	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Cl	H	Me	Q-4	Cl	H	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	H	Me	Q-4	CF ₃	H	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Cl	Me	Me	Q-4	Cl	Me	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	Me	Me	Q-4	CF ₃	Me	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Cl	H	Cl	Q-4	Cl	H	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	H	Cl	Q-4	CF ₃	H	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Cl	Me	Cl	Q-4	Cl	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	Me	Cl	Q-4	CF ₃	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl

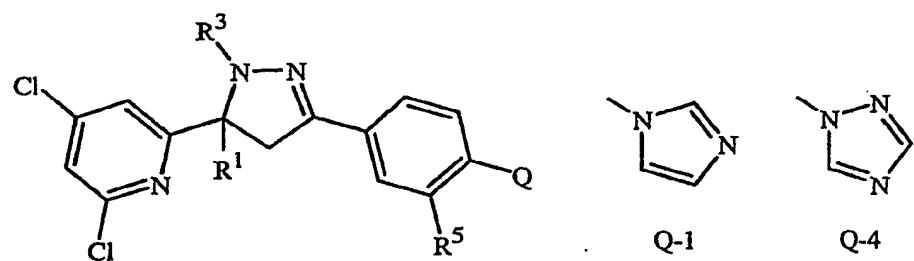
TABELA 4



<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	Q	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	Q
H	H	H	Q-1	H	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	H	H	Q-1	Cl	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Br	H	H	Q-1	Br	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₃	H	H	Q-1	CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
H	Me	H	Q-1	H	Me	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	Me	H	Q-1	Cl	Me	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Br	Me	H	Q-1	Br	Me	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₃	Me	H	Q-1	CF ₃	Me	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
H	H	Me	Q-1	H	H	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	H	Me	Q-1	Cl	H	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Br	H	Me	Q-1	Br	H	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃

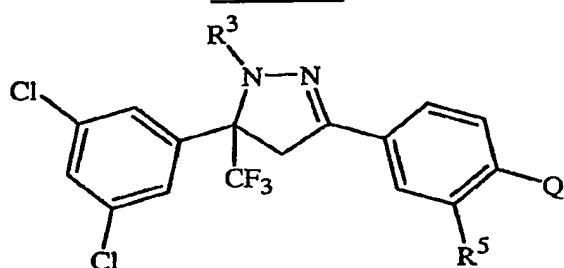
<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>
CF ₃	H	Me	Q-1	CF ₃	H	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
H	Me	Me	Q-1	H	Me	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	Me	Me	Q-1	Cl	Me	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Br	Me	Me	Q-1	Br	Me	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₃	Me	Me	Q-1	CF ₃	Me	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
H	H	Cl	Q-1	H	H	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	H	Cl	Q-1	Cl	H	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Br	H	Cl	Q-1	Br	H	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Cl	Q-1	CF ₃	H	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
H	Me	Cl	Q-1	H	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Cl	Me	Cl	Q-1	Cl	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
Br	Me	Cl	Q-1	Br	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₃	Me	Cl	Q-1	CF ₃	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
H	H	H	Q-4	H	H	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Cl	H	H	Q-4	Cl	H	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Br	H	H	Q-4	Br	H	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	H	H	Q-4	CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
H	Me	H	Q-4	H	Me	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Cl	Me	H	Q-4	Cl	Me	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Br	Me	H	Q-4	Br	Me	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	Me	H	Q-4	CF ₃	Me	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
H	H	Me	Q-4	H	H	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Cl	H	Me	Q-4	Cl	H	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Br	H	Me	Q-4	Br	H	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	H	Me	Q-4	CF ₃	H	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
H	Me	Me	Q-4	H	Me	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Cl	Me	Me	Q-4	Cl	Me	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Br	Me	Me	Q-4	Br	Me	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	Me	Me	Q-4	CF ₃	Me	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
H	H	Cl	Q-4	H	H	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Cl	H	Cl	Q-4	Cl	H	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Br	H	Cl	Q-4	Br	H	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	H	Cl	Q-4	CF ₃	H	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
H	Me	Cl	Q-4	H	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Cl	Me	Cl	Q-4	Cl	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
Br	Me	Cl	Q-4	Br	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₃	Me	Cl	Q-4	CF ₃	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl

TABELA 5



<u>R¹</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	Q	<u>R¹</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	Q
CF ₂ CF ₃	H	H	Q-1	CF ₂ CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	Me	H	Q-1	CF ₂ CF ₃	Me	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	H	Me	Q-1	CF ₂ CF ₃	H	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	Me	Me	Q-1	CF ₂ CF ₃	Me	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	H	Cl	Q-1	CF ₂ CF ₃	H	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	Me	Cl	Q-1	CF ₂ CF ₃	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	H	H	Q-4	CF ₂ CF ₃	H	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₂ CF ₃	Me	H	Q-4	CF ₂ CF ₃	Me	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₂ CF ₃	H	Me	Q-4	CF ₂ CF ₃	H	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₂ CF ₃	Me	Me	Q-4	CF ₂ CF ₃	Me	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₂ CF ₃	H	Cl	Q-4	CF ₂ CF ₃	H	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CF ₂ CF ₃	Me	Cl	Q-4	CF ₂ CF ₃	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
CHF ₂	H	H	Q-1	CHF ₂	H	H	Q-1
CHF ₂	Me	H	Q-1	CHF ₂	Me	H	Q-1
CHF ₂	H	Me	Q-1	CHF ₂	H	Me	Q-1
CHF ₂	Me	Me	Q-1	CHF ₂	Me	Me	Q-1
CHF ₂	H	Cl	Q-1	CHF ₂	H	Cl	Q-1
CHF ₂	Me	Cl	Q-1	CHF ₂	Me	Cl	Q-1
CHF ₂	H	H	Q-4	CHF ₂	H	H	Q-4
CHF ₂	Me	H	Q-4	CHF ₂	Me	H	Q-4
CHF ₂	H	Me	Q-4	CHF ₂	H	Me	Q-4
CHF ₂	Me	Me	Q-4	CHF ₂	Me	Me	Q-4
CHF ₂	H	Cl	Q-4	CHF ₂	H	Cl	Q-4
CHF ₂	Me	Cl	Q-4	CHF ₂	Me	Cl	Q-4
2,2-di-F-c-Pr	H	H	Q-1	2,2-di-F-c-Pr	H	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
2,2-di-F-c-Pr	Me	H	Q-1	2,2-di-F-c-Pr	Me	H	C(O)NHCH ₂ CF ₃
2,2-di-F-c-Pr	H	Me	Q-1	2,2-di-F-c-Pr	H	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
2,2-di-F-c-Pr	Me	Me	Q-1	2,2-di-F-c-Pr	Me	Me	C(O)NHCH ₂ CF ₃
2,2-di-F-c-Pr	H	Cl	Q-1	2,2-di-F-c-Pr	H	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃
2,2-di-F-c-Pr	Me	Cl	Q-1	2,2-di-F-c-Pr	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ CF ₃

<u>R¹</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>	<u>R¹</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>
2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	H	H	Q-4	2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	H	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	Me	H	Q-4	2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	Me	H	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	H	Me	Q-4	2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	H	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	Me	Me	Q-4	2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	Me	Me	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	H	Cl	Q-4	2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	H	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl
2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	Me	Cl	Q-4	2,2-di-F- <i>c</i> -Pr	Me	Cl	C(O)NHCH ₂ -2-pyridinyl

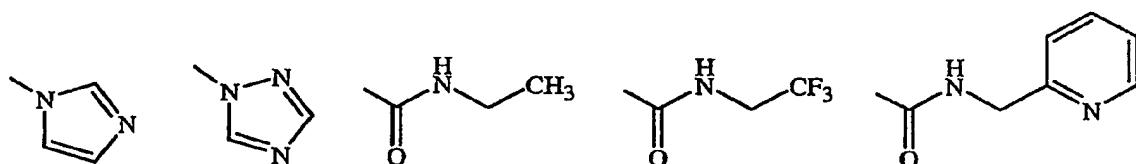
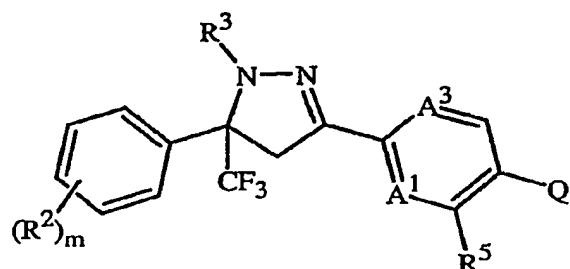
TABELA 6

<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>
H	Cl	SO ₂ NMe ₂	Me	Cl	SO ₂ NMe ₂
H	CN	SO ₂ NMe ₂	Me	CN	SO ₂ NMe ₂
H	Me	SO ₂ NMe ₂	Me	Me	SO ₂ NMe ₂
H	NO ₂	SO ₂ NMe ₂	Me	NO ₂	SO ₂ NMe ₂
H	Cl	SO ₂ NMe(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	Cl	SO ₂ NMe(CH ₂ CH=CH ₂)
H	CN	SO ₂ NMe(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	CN	SO ₂ NMe(CH ₂ CH=CH ₂)
H	Me	SO ₂ NMe(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	Me	SO ₂ NMe(CH ₂ CH=CH ₂)
H	NO ₂	SO ₂ NMe(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	NO ₂	SO ₂ NMe(CH ₂ CH=CH ₂)
H	Cl	SO ₂ NMe(CH ₂ CF ₃)	Me	Cl	SO ₂ NMe(CH ₂ CF ₃)
H	CN	SO ₂ NMe(CH ₂ CF ₃)	Me	CN	SO ₂ NMe(CH ₂ CF ₃)
H	Me	SO ₂ NMe(CH ₂ CF ₃)	Me	Me	SO ₂ NMe(CH ₂ CF ₃)
H	NO ₂	SO ₂ NMe(CH ₂ CF ₃)	Me	NO ₂	SO ₂ NMe(CH ₂ CF ₃)
H	Cl	SO ₂ NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	Cl	SO ₂ NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	CN	SO ₂ NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	CN	SO ₂ NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	Me	SO ₂ NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	Me	SO ₂ NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	NO ₂	SO ₂ NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	NO ₂	SO ₂ NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	Cl	SO ₂ NMe(CH ₂ C≡CH)	Me	Cl	SO ₂ NMe(CH ₂ C≡CH)
H	CN	SO ₂ NMe(CH ₂ C≡CH)	Me	CN	SO ₂ NMe(CH ₂ C≡CH)
H	Me	SO ₂ NMe(CH ₂ C≡CH)	Me	Me	SO ₂ NMe(CH ₂ C≡CH)
H	NO ₂	SO ₂ NMe(CH ₂ C≡CH)	Me	NO ₂	SO ₂ NMe(CH ₂ C≡CH)
H	Cl	SO ₂ NHMe	Me	Cl	SO ₂ NHMe
H	CN	SO ₂ NHMe	Me	CN	SO ₂ NHMe

<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Ω</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Ω</u>
H	Me	SO ₂ NHMe	Me	Me	SO ₂ NHMe
H	NO ₂	SO ₂ NHMe	Me	NO ₂	SO ₂ NHMe
H	Cl	SO ₂ NH(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	Cl	SO ₂ NH(CH ₂ CH=CH ₂)
H	CN	SO ₂ NH(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	CN	SO ₂ NH(CH ₂ CH=CH ₂)
H	Me	SO ₂ NH(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	Me	SO ₂ NH(CH ₂ CH=CH ₂)
H	NO ₂	SO ₂ NH(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	NO ₂	SO ₂ NH(CH ₂ CH=CH ₂)
H	Cl	SO ₂ NH(CH ₂ CF ₃)	Me	Cl	SO ₂ NH(CH ₂ CF ₃)
H	CN	SO ₂ NH(CH ₂ CF ₃)	Me	CN	SO ₂ NH(CH ₂ CF ₃)
H	Me	SO ₂ NH(CH ₂ CF ₃)	Me	Me	SO ₂ NH(CH ₂ CF ₃)
H	NO ₂	SO ₂ NH(CH ₂ CF ₃)	Me	NO ₂	SO ₂ NH(CH ₂ CF ₃)
H	Cl	SO ₂ NH(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	Cl	SO ₂ NH(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	CN	SO ₂ NH(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	CN	SO ₂ NH(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	Me	SO ₂ NH(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	Me	SO ₂ NH(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	NO ₂	SO ₂ NH(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	NO ₂	SO ₂ NH(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	Cl	SO ₂ NH(CH ₂ C≡CH)	Me	Cl	SO ₂ NH(CH ₂ C≡CH)
H	CN	SO ₂ NH(CH ₂ C≡CH)	Me	CN	SO ₂ NH(CH ₂ C≡CH)
H	Me	SO ₂ NH(CH ₂ C≡CH)	Me	Me	SO ₂ NH(CH ₂ C≡CH)
H	NO ₂	SO ₂ NH(CH ₂ C≡CH)	Me	NO ₂	SO ₂ NH(CH ₂ C≡CH)
H	Cl	NO ₂	Me	Cl	NO ₂
H	CN	NO ₂	Me	CN	NO ₂
H	Me	NO ₂	Me	Me	NO ₂
H	NO ₂	NO ₂	Me	NO ₂	NO ₂
H	Cl	4-morpholinyl	Me	Cl	4-morpholinyl
H	CN	4-morpholinyl	Me	CN	4-morpholinyl
H	Me	4-morpholinyl	Me	Me	4-morpholinyl
H	NO ₂	4-morpholinyl	Me	NO ₂	4-morpholinyl
H	Cl	F	Me	Cl	F
H	CN	F	Me	CN	F
H	Me	F	Me	Me	F
H	NO ₂	F	Me	NO ₂	F
H	Cl	CN	Me	Cl	CN
H	CN	CN	Me	CN	CN
H	Me	CN	Me	Me	CN
H	NO ₂	CN	Me	NO ₂	CN
H	Cl	Cl	Me	Cl	Cl
H	CN	Cl	Me	CN	Cl
H	Me	Cl	Me	Me	Cl

<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Ω</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Ω</u>
H	NO ₂	Cl	Me	NO ₂	Cl
H	Cl	C(S)NMe ₂	Me	Cl	C(S)NMe ₂
H	CN	C(S)NMe ₂	Me	CN	C(S)NMe ₂
H	Me	C(S)NMe ₂	Me	Me	C(S)NMe ₂
H	NO ₂	C(S)NMe ₂	Me	NO ₂	C(S)NMe ₂
H	Cl	C(S)NMe(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	Cl	C(S)NMe(CH ₂ CH=CH ₂)
H	CN	C(S)NMe(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	CN	C(S)NMe(CH ₂ CH=CH ₂)
H	Me	C(S)NMe(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	Me	C(S)NMe(CH ₂ CH=CH ₂)
H	NO ₂	C(S)NMe(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	NO ₂	C(S)NMe(CH ₂ CH=CH ₂)
H	Cl	C(S)NMe(CH ₂ CF ₃)	Me	Cl	C(S)NMe(CH ₂ CF ₃)
H	CN	C(S)NMe(CH ₂ CF ₃)	Me	CN	C(S)NMe(CH ₂ CF ₃)
H	Me	C(S)NMe(CH ₂ CF ₃)	Me	Me	C(S)NMe(CH ₂ CF ₃)
H	NO ₂	C(S)NMe(CH ₂ CF ₃)	Me	NO ₂	C(S)NMe(CH ₂ CF ₃)
H	Cl	C(S)NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	Cl	C(S)NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	CN	C(S)NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	CN	C(S)NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	Me	C(S)NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	Me	C(S)NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	NO ₂	C(S)NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	NO ₂	C(S)NMe(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	Cl	C(S)NMe(CH ₂ C≡CH)	Me	Cl	C(S)NMe(CH ₂ C≡CH)
H	CN	C(S)NMe(CH ₂ C≡CH)	Me	CN	C(S)NMe(CH ₂ C≡CH)
H	Me	C(S)NMe(CH ₂ C≡CH)	Me	Me	C(S)NMe(CH ₂ C≡CH)
H	NO ₂	C(S)NMe(CH ₂ C≡CH)	Me	NO ₂	C(S)NMe(CH ₂ C≡CH)
H	Cl	C(S)NHMe	Me	Cl	C(S)NHMe
H	CN	C(S)NHMe	Me	CN	C(S)NHMe
H	Me	C(S)NHMe	Me	Me	C(S)NHMe
H	NO ₂	C(S)NHMe	Me	NO ₂	C(S)NHMe
H	Cl	C(S)NH(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	Cl	C(S)NH(CH ₂ CH=CH ₂)
H	CN	C(S)NH(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	CN	C(S)NH(CH ₂ CH=CH ₂)
H	Me	C(S)NH(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	Me	C(S)NH(CH ₂ CH=CH ₂)
H	NO ₂	C(S)NH(CH ₂ CH=CH ₂)	Me	NO ₂	C(S)NH(CH ₂ CH=CH ₂)
H	Cl	C(S)NH(CH ₂ CF ₃)	Me	Cl	C(S)NH(CH ₂ CF ₃)
H	CN	C(S)NH(CH ₂ CF ₃)	Me	CN	C(S)NH(CH ₂ CF ₃)
H	Me	C(S)NH(CH ₂ CF ₃)	Me	Me	C(S)NH(CH ₂ CF ₃)
H	NO ₂	C(S)NH(CH ₂ CF ₃)	Me	NO ₂	C(S)NH(CH ₂ CF ₃)
H	Cl	C(S)NH(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	Cl	C(S)NH(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	CN	C(S)NH(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	CN	C(S)NH(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	Me	C(S)NH(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	Me	C(S)NH(CH ₂ -2-pyridinyl)
H	NO ₂	C(S)NH(CH ₂ -2-pyridinyl)	Me	NO ₂	C(S)NH(CH ₂ -2-pyridinyl)

<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>Q</u>
H	Cl	C(S)NH(CH ₂ C≡CH)	Me	Cl	C(S)NH(CH ₂ C≡CH)
H	CN	C(S)NH(CH ₂ C≡CH)	Me	CN	C(S)NH(CH ₂ C≡CH)
H	Me	C(S)NH(CH ₂ C≡CH)	Me	Me	C(S)NH(CH ₂ C≡CH)
H	NO ₂	C(S)NH(CH ₂ C≡CH)	Me	NO ₂	C(S)NH(CH ₂ C≡CH)

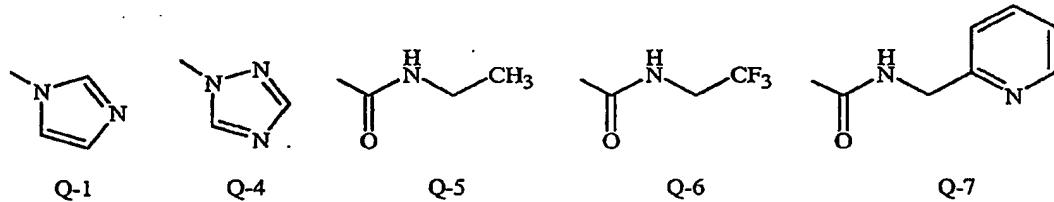
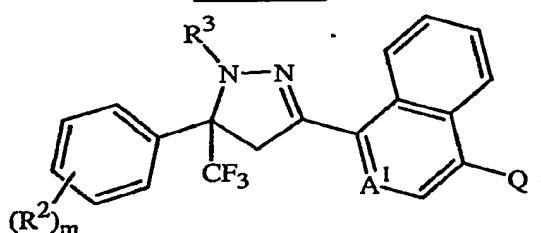
TABELA 7

<u>(R²)_m</u>	<u>Q-1</u>	<u>Q-4</u>	<u>Q-5</u>	<u>Q-6</u>	<u>Q-7</u>
<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>A¹</u>	<u>A³</u>	<u>Q</u>
3-Cl, 4-Cl	H	H	CH	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	H	CH	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	CH	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	CH	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	CH	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	H	Me	N	CH	Q-1
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	N	CH	Q-1
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	N	CH	Q-1
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	N	CH	Q-1
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	N	CH	Q-1
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	N	CH	Q-1
3-Cl, 4-Cl	H	Me	N	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	N	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	N	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	N	N	Q-1
3-Cl, 5-Cl					
3-Cl, 5-Cl	H	H	CH	N	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH	N	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	H	CH	N	Q-1
3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH	N	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH	N	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	CH	N	Q-1
3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	CH	N	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	CH	N	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH	N	Q-1
3-Cl, 5-Cl	H	Me	N	CH	Q-1
3-Cl, 5-Cl	Me	Me	N	CH	Q-1
3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	N	CH	Q-1
3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	N	CH	Q-1

$(R^2)_m$	R^3	R^5	A^1	A^3	Q	$(R^2)_m$	R^3	R^5	A^1	A^3	Q
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	N	N	Q-1	3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	N	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	N	N	Q-1	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	N	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	H	H	CH	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	H	CH	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	H	CH	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	CH	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	CH	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	CH	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	CH	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	CH	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	CH	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	Me	N	CH	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	Me	N	CH	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	N	CH	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	N	CH	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	N	CH	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	N	CH	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	N	CH	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	N	CH	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	N	CH	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	N	CH	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	N	CH	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	N	CH	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	Me	N	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	Me	N	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	N	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	N	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	N	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	N	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	N	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	N	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	N	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	N	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	N	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	N	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	H	CH	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	H	CH	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	H	CH	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	CH	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	CH	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	CH	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	CH	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	CH	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	CH	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	H	Me	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	H	Me	N	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	N	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	N	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	N	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	CH	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	H	Me	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	H	Me	N	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	N	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CH ₂ CF ₃	Me	N	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	H	CF ₃	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	H	CF ₃	N	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Me	CF ₃	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Me	CF ₃	N	CH	Q-5

$(R^2)_m$	R^3	R^5	A^1	A^3	Q	$(R^2)_m$	R^3	R^5	A^1	A^3	Q
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	H	Me	N	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	H	Me	N	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	N	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	N	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	Me	N	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	N	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	H	CF_3	N	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	H	CF_3	N	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Me	CF_3	N	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Me	CF_3	N	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	H	H	CH	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	H	CH	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	H	CH	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	Me	CH	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	CH	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	H	CF_3	CH	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	H	CF_3	CH	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	Me	CF_3	CH	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	Me	CF_3	CH	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CF_3	CH	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CF_3	CH	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	H	Me	N	CH	Q-6	3-Cl, 5-Cl	H	Me	N	CH	Q-6
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	N	CH	Q-6	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	N	CH	Q-6
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	Me	N	CH	Q-6	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	N	CH	Q-6
3-Cl, 4-Cl	H	CF_3	N	CH	Q-6	3-Cl, 5-Cl	H	CF_3	N	CH	Q-6
3-Cl, 4-Cl	Me	CF_3	N	CH	Q-6	3-Cl, 5-Cl	Me	CF_3	N	CH	Q-6
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	CH	Q-6	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	CH	Q-6
3-Cl, 4-Cl	H	Me	N	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	H	Me	N	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	N	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	N	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	Me	N	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	N	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	H	CF_3	N	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	H	CF_3	N	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	Me	CF_3	N	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	Me	CF_3	N	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	H	H	CH	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	H	CH	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	H	CH	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	Me	CH	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	CH	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	H	CF_3	CH	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	H	CF_3	CH	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	Me	CF_3	CH	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	Me	CF_3	CH	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CF_3	CH	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CF_3	CH	N	Q-7

$(R^2)_m$	R^3	R^5	A^1	A^3	Q	$(R^2)_m$	R^3	R^5	A^1	A^3	Q
3-Cl, 4-Cl	H	Me	N	CH	Q-7	3-Cl, 5-Cl	H	Me	N	CH	Q-7
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	N	CH	Q-7	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	N	CH	Q-7
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	Me	N	CH	Q-7	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	N	CH	Q-7
3-Cl, 4-Cl	H	CF_3	N	CH	Q-7	3-Cl, 5-Cl	H	CF_3	N	CH	Q-7
3-Cl, 4-Cl	Me	CF_3	N	CH	Q-7	3-Cl, 5-Cl	Me	CF_3	N	CH	Q-7
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	CH	Q-7	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	CH	Q-7
3-Cl, 4-Cl	H	Me	N	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	H	Me	N	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	Me	Me	N	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	N	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	Me	N	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	Me	N	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	H	CF_3	N	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	H	CF_3	N	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	Me	CF_3	N	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	Me	CF_3	N	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CF_3	N	N	Q-7

TABELA 8

$(R^2)_m$	R^3	A^1	Q	$(R^2)_m$	R^3	A^1	Q
3-Cl, 4-Cl	H	CH	Q-1	3-Cl, 5-Cl	H	CH	Q-1
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	Q-1	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	Q-1
3-Cl, 4-Cl	Et	CH	Q-1	3-Cl, 5-Cl	Et	CH	Q-1
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CH	Q-1	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CH	Q-1
3-Cl, 4-Cl	CN	CH	Q-1	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	Q-1
3-Cl, 4-Cl	H	N	Q-1	3-Cl, 5-Cl	H	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	Me	N	Q-1	3-Cl, 5-Cl	Me	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	Et	N	Q-1	3-Cl, 5-Cl	Et	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	N	Q-1	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	CN	N	Q-1	3-Cl, 5-Cl	CN	N	Q-1
3-Cl, 4-Cl	H	CH	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	CH	Q-4

$(R^2)_m$	R^3	A^1	Q	$(R^2)_m$	R^3	A^1	Q
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Et	CH	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Et	CH	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CH	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CH	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CN	CH	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	H	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Me	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Me	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	Et	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	Et	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	CN	N	Q-4	3-Cl, 5-Cl	CN	N	Q-4
3-Cl, 4-Cl	H	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	H	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Et	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Et	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CN	CH	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	Q-5
3-Cl, 4-Cl	H	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	H	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Me	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Me	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	Et	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	Et	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	CN	N	Q-5	3-Cl, 5-Cl	CN	N	Q-5
3-Cl, 4-Cl	H	CH	Q-6	3-Cl, 5-Cl	H	CH	Q-6
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	Q-6	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	Q-6
3-Cl, 4-Cl	Et	CH	Q-6	3-Cl, 5-Cl	Et	CH	Q-6
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CH	Q-6	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CH	Q-6
3-Cl, 4-Cl	CN	CH	Q-6	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	Q-6
3-Cl, 4-Cl	H	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	H	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	Me	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	Me	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	Et	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	Et	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	CN	N	Q-6	3-Cl, 5-Cl	CN	N	Q-6
3-Cl, 4-Cl	H	CH	Q-7	3-Cl, 5-Cl	H	CH	Q-7
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	Q-7	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	Q-7
3-Cl, 4-Cl	Et	CH	Q-7	3-Cl, 5-Cl	Et	CH	Q-7
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	CH	Q-7	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	CH	Q-7
3-Cl, 4-Cl	CN	CH	Q-7	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	Q-7
3-Cl, 4-Cl	H	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	H	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	Me	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	Me	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	Et	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	Et	N	Q-7

$(R^2)_m$	R^3	A ¹	Q	$(R^2)_m$	R^3	A ¹	Q
3-Cl, 4-Cl	CH_2CF_3	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	CH_2CF_3	N	Q-7
3-Cl, 4-Cl	CN	N	Q-7	3-Cl, 5-Cl	CN	N	Q-7

FORMULAÇÃO/UTILIDADE:

Os compostos de acordo com a presente invenção podem ser geralmente utilizados como ingrediente ativo para controle de pragas em uma composição, ou seja formulação, com um veículo apropriado para usos agronômicos ou não agronômicos que compreende pelo menos um dentre um 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 suspoemulsões) e similares, que podem ser opcionalmente espessados na forma de géis. Os tipos gerais de composições líquidas aquosas são concentrados solúveis, concentrados em suspensão, suspensão de cápsulas, emulsão concentrada, microemulsão e suspoemulsão. Os tipos gerais de composições líquidas não aquosas são concentrados emulsionáveis, concentrados microemulsionáveis, concentrados dispersíveis e dispersões em óleo.

Os tipos gerais de composições sólidas são poeiras, pós, grânulos, pelotas, pílulas, pastilhas, filmes preenchidos (incluindo revestimento de sementes) e similares, que podem ser dispersíveis em água ("molháveis") ou hidrossolúveis. Os filmes e revestimentos formados a partir de soluções formadoras de filme ou suspensões fluidas são particularmente úteis para o tratamento de sementes. 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. Grânulos emulsionáveis combinam as vantagens de uma formulação de concentrado emulsionável e uma formulação granular seca. Composições de alta resistência podem ser principalmente utilizadas como

5 intermediários para formulação adicional.

As formulações pulverizáveis são tipicamente estendidas em um meio apropriado antes da pulverização. Essas formulações líquidas e sólidas são elaboradas para que sejam facilmente diluídas no meio de pulverização, normalmente água. Os volumes de pulverização podem variar de cerca de um

10 a vários milhares de litros por hectare, mas encontram-se mais tipicamente na faixa de cerca de dez a várias centenas de litros por hectare. Formulações pulverizáveis podem ser misturadas em tanque com água ou um outro meio apropriado para tratamento foliar por meio de aplicação terrestre ou aérea, ou para aplicação ao meio de crescimento da planta. Formulações secas e

15 líquidas podem ser medidas diretamente em sistemas de irrigação por gotejamento ou medidas na cova durante o plantio. Formulações líquidas e sólidas podem ser aplicadas sobre sementes de safras e outra vegetação desejável como tratamentos de sementes antes do plantio para proteger raízes em desenvolvimento e outras partes de plantas subterrâneas e/ou folhagem

20 por meio de absorção sistêmica.

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

	Percentual em peso		
	Ingrediente ativo	Diluente	Tensoativo
Pós, pastilhas e grânulos dispersíveis em água e hidrossolúveis	0,001 - 90	0 - 99,999	0 - 15
Suspensões, emulsões, soluções (incluindo concentrados emulsionáveis)	1 - 50	40 - 99	0 - 50

	Percentual em peso		
	Ingrediente ativo	Diluente	Tensoativo
Poeiras	1 - 25	70 - 99	0 - 5
Grânulos e pelotas	0,001 - 99	5 - 99,999	0 - 15
Composições de alta resistência	90 - 99	0 - 10	0 - 2

Diluentes sólidos incluem, por exemplo, argilas tais como bentonita, montmorilonita, atapulgita e caulim, gesso, celulose, dióxido de titânio, óxido de zinco, amido, dextrina, açúcares (tais como lactose e sacarose), sílica, talco, mica, terra diatomácea, uréia, carbonato de cálcio, 5 carbonato e bicarbonato de sódio e sulfato de sódio. Diluentes sólidos típicos são descritos em Watkins et al, *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, segunda edição, Dorland Books, Caldwell, Nova Jérsei.

Diluentes líquidos incluem, por exemplo, água, N,N-dimetilalcanamidas (tais como N,N-dimetilformamida), limoneno, sulfóxido de dimetila, N-alquilpirrolidonas (tais como N-metilpirrolidinona), etíleno glicol, trietíleno glicol, propileno glicol, dipropileno glicol, polipropileno glicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (tais como óleos minerais brancos, parafinas normais, isoparafinas), alquilbenzenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, triacetina, hidrocarbonetos aromáticos, 15 alifáticos desaromatizados, alquilbenzenos, alquilnaftalenos, cetonas tais como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona e 4-hidróxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tais como acetato de isoamila, acetato de hexila, acetato de heptila, acetato de octila, acetato de nonila, acetato de tridecila e acetato de isobornila, outros ésteres tais como ésteres de lactato alquilados, ésteres dibásicos e γ -butirolactona, e alcoóis, que podem ser lineares, ramificados, saturados ou insaturados, tais como metanol, etanol, n-propanol, álcool isopropílico, n-butanol, álcool isobutílico, n-hexanol, 2-etyl hexanol, n-octanol, decanol, álcool isodecílico, isoocatadecanol, álcool cetílico, álcool laurílico, álcool tridecílico,

álcool oleílico, ciclohexanol, álcool tetraidrofurílico, álcool de diacetona e álcool benzílico. Diluentes líquidos também incluem glicerol ésteres de ácidos graxos saturados e insaturados (tipicamente C₆-C₂₂), tais como óleos de frutas e sementes de plantas (por exemplo, óleos de oliva, mamona, linhaça, 5 gergelim, milho, amendoim, girassol, semente de uva, açafrão, semente de algodão, soja, colza, coco e semente de palma), gorduras de fontes animais (tais como sebo de boi, sebo de porco, banha, óleo de fígado de bacalhau, óleo de peixe) e suas misturas. Diluentes líquidos também incluem ácidos graxos alquilados (tais como metilados, etilados e butilados), em que os ácidos graxos 10 podem ser obtidos por meio de hidrólise de glicerol ésteres de fontes vegetais e animais e podem ser purificados por meio de destilação. Diluentes líquidos típicos são descritos em Marsden, *Solvents Guide*, segunda edição, Interscience, Nova Iorque, 1950. *McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual*, Allured Publ. Corp., Ridgewood, Nova Jérsei, bem como Sisely e 15 Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., Nova Iorque, 1964, relacionam tensoativos e utilizações recomendadas.

As composições sólidas e líquidas de acordo com a presente invenção freqüentemente incluem um ou mais tensoativos. Quando adicionados a um líquido, tensoativos (também conhecidos como "agentes ativos na superfície") geralmente modificam, mas freqüentemente reduzem a tensão superficial do líquido. Dependendo da natureza dos grupos hidrofílicos e lipofílicos em uma molécula de tensoativo, os tensoativos podem ser úteis como agentes umectantes, dispersantes, emulsificantes ou agentes desespumantes.

25 Os tensoativos podem ser classificados como não iônicos, aniônicos ou catiônicos. Os tensoativos não iônicos úteis para as composições do presente incluem, mas sem limitar-se a: alcoxilados álcoois tais como alcoxilados álcoois baseados em álcoois naturais e sintéticos (que podem ser

lineares ou ramificados) e preparados a partir dos álcoois e óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou suas misturas; etoxilados amina, alanolamidas e alanolamidas etoxiladas; triglicérides alcoxilados, tais como óleos de soja, mamona e colza etoxilados; alcoxilados de alquilfenol, tais como 5 etoxilados de octilfenol, etoxilados de nonilfenol, etoxilados de dinonil fenol e etoxilados de dodecil fenol (preparados a partir dos fenóis e óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou suas misturas); polímeros de bloco preparados a partir de óxido de etileno ou óxido de propileno e polímeros de bloco reversos em que os blocos terminais são preparados a partir de óxido de 10 propileno; ácidos graxos etoxilados; óleos e ésteres graxos etoxilados; metil ésteres etoxilados; triestirilfenol etoxilado (incluindo os preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou suas misturas); ésteres de ácidos graxos, glicerol ésteres, derivados com base em lanolina, ésteres polietoxilados tais como ésteres de ácidos graxos de sorbitan 15 polietoxilado, ésteres de ácido graxo de sorbitol polietoxilado e ésteres de ácidos graxos de glicerol polietoxilado; outros derivados de sorbitan tais como ésteres de sorbitan; tensoativos poliméricos, tais como copolímeros aleatórios, copolímeros de bloco, resinas peguiladas alquiladas (polietileno glicol), polímeros de enxerto ou de pente e polímeros estrelados; polietileno glicóis 20 (pegs); ésteres de ácidos graxos de polietileno glicol; tensoativos com base em silicone; e derivados de açúcar, tais como ésteres de sacarose, alquil poliglicosídeos e alquil polissacarídeos.

Tensoativos aniônicos úteis incluem, mas sem limitar-se a: ácidos alquilaril sulfônicos e seus sais; álcool carboxilado ou etoxilados de alquilfenol; 25 derivados de sulfonato de difenila; lignina e derivados de lignina, tais como lignossulfonatos; ácidos maleico ou succínico ou seus anidridos; sulfonatos de olefina; ésteres de fosfato tais como fosfato ésteres de alcoxilados álcoois, fosfato ésteres de alcoxilados de alquilfenol e fosfato ésteres de etoxilados de

estiril fenol; tensoativos com base em proteína; derivados de sarcosina; éter sulfato de estiril fenol; sulfatos e sulfonatos de óleos e ácidos graxos; sulfatos e sulfonatos de alquilfenóis etoxilados; sulfatos de álcoois; sulfatos de álcoois etoxilados; sulfonatos de aminas e amidas tais como tauratos de *N,N*-alquila;

5 sulfonatos de benzeno, cumeno, tolueno, xileno e dodecil e tridecilbenzenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno e alquil naftaleno; sulfonatos de petróleo fracionado; sulfussuccinamatos; e sulfossuccinatos e seus derivados, tais como sais de sulfossuccinato de dialquila.

Tensoativos catiônicos úteis incluem, mas sem limitar-se a:

10 amidas e amidas etoxiladas; aminas, tais como *N*-alquil propanodiaminas, tripropilenotriaminas e dipropilenotetraminas, e aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas e aminas propoxiladas (preparadas a partir das aminas e óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou suas misturas); sais de amina, tais como acetatos de amina e sais de diamina; sais de amônio quaternário,

15 tais como sais quaternários, sais quaternários etoxilados e sais diquaternários; e óxidos de amina, tais como óxidos de alquildimetilamina e óxidos de bis-(2-hidroxietil)-alquilamina. Também são úteis para as composições do presente misturas de tensoativos aniônicos e não iônicos ou misturas de tensoativos não iônicos e catiônicos. Tensoativos não iônicos, aniônicos e catiônicos e seus

20 usos recomendados são descritos em uma série de referências publicadas que incluem *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, edições anuais norte-americanas e internacionais publicadas pela Divisão McCutcheon's, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely e Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., Nova Iorque, 1964; e A. S.

25 Davidson e B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, sétima edição, John Wiley and Sons, Nova Iorque, 1987.

As composições de acordo com a presente invenção podem também conter aditivos e auxiliares de formulação, conhecidos dos técnicos

no assunto como auxiliares de formulação (alguns dos quais podem ser considerados como também funcionando como diluentes sólidos, diluentes líquidos ou tensoativos). Esses aditivos e auxiliares de formulação podem controlar: pH (tampões), formação de espuma durante o processamento (antiespumantes tais como poliorganossiloxanos), sedimentação de ingredientes ativos (agentes formadores de suspensão), viscosidade (espessantes tixotrópicos), crescimento microbiano em recipientes (antimicrobianos), congelamento de produto (anticongelantes), cor (tinturas/dispersões de pigmento), lavagem (formadores de filme ou aglutinantes), evaporação (retardantes da evaporação) e outros atributos da formulação. Os formadores de filme incluem, por exemplo, acetatos de polivinila, copolímeros de acetato de polivinila, copolímero de acetato de vinila e polivinilpirrolidona, álcoois polivinílicos, copolímeros de álcool polivinílico e ceras. Exemplos de aditivos e auxiliares de formulação incluem os relacionados em *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, edições anuais internacionais e norte-americanas publicadas pela Divisão McCutcheon, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. e Patente PCT nº WO 03/024222.

O composto da Fórmula 1 e quaisquer outros ingredientes ativos são tipicamente incorporados às composições do presente por meio de dissolução do ingrediente ativo em um solvente ou por moagem em um diluente seco ou líquido. Soluções, que incluem concentrados emulsionáveis, podem ser preparadas por meio da simples mistura dos ingredientes. Caso o solvente de uma composição líquida destinado a uso como concentrado emulsionável seja imiscível em água, é tipicamente adicionado um emulsificante para emulsificar o solvente que contém ativo mediante diluição com água. Caldas de ingredientes ativos, com diâmetros de partículas de até 2000 µm, podem ser moídas úmidas utilizando moinhos de meios para obter partículas com diâmetros médios de

menos de 3 µm. Caldas aquosas podem ser elaboradas em concentrados de suspensão terminados (vide, por exemplo, a Patente Norte-Americana nº 3.060.084) ou processadas adicionalmente por meio de secagem por pulverização para formar grânulos dispersíveis em água. Formulações secas 5 normalmente necessitam de processos de moagem seca, que produzem diâmetros médios de partícula na faixa de 2 a 10 µm. Pós e pós secos podem ser preparados por meio de mistura e, normalmente, moagem (como em moinho martelo ou moinho de energia fluida). Grânulos e pelotas podem ser preparados por meio de pulverização do material ativo sobre veículos granulares formados 10 previamente ou por meio de métodos de aglomeração. Vide Browning, *Agglomeration, Chemical Engineering*, quatro de dezembro de 1967, págs. 147–48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, quarta edição, McGraw-Hill, Nova Iorque, 1963, págs. 8–57 e seguintes, e WO 91/13546. Pelotas podem ser 15 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 20 preparados conforme ensinado em GB 2.095.558 e US 3.299.566.

Para informações adicionais referentes ao método de formulação, 20 vide T. S. Woods, *The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture* em *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks e T. R. Roberts, Eds., *Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry*, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, págs. 120–133. Vide também US 3.235.361, Col. 6, linha 16 até Col. 7, 25 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.

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

EXEMPLO A

Concentrado de Alta Resistência

Composto 2	98,5%
Sílica aerogel	0,5%
Sílica fina amorfa sintética	1,0%

EXEMPLO B

Pó molhável

Composto 11	65,0%
Dodecilfenol polietileno glicol éter	2,0%
Ligninossulfonato de sódio	4,0%
Silicoaluminato de sódio	6,0%
Montmorilonita (calcinada)	23,0%

EXEMPLO C

Grânulos

Composto 12	10,0%
grânulos de atapulgita (matéria de baixa volatilidade, 0,71/0,30 mm; peneiras padrão norte-americano nº 25-50)	90,0%

EXEMPLO D**Pelotas extrudadas**

	Composto 19	25,0%
	Sulfato de sódio anidro	10,0%
5	Ligninossulfonato de cálcio bruto	5,0%
	Alquilnaftalenossulfonato de sódio	1,0%
	Bentonita de cálcio/magnésio	59,0%

EXEMPLO E**Concentrado emulsionável**

10	Composto 2	10,0%
	Hexoleato de polioxietileno sorbitol	20,0%
	Metil éster de ácido graxo C ₆ -C ₁₀	70,0%

EXEMPLO F**Microemulsão**

15	Composto 11	5,0%
	Copolímero de polivinilpirrolidona e acetato de vinila	30,0%
	Alquilpoliglicosídeo	30,0%
	Monooleato de glicerila	15,0%
20	Água	20,0%

EXEMPLO G**Tratamento de sementes**

	Composto 12	20,00%
	Copolímero de polivinilpirrolidona e acetato de vinila	5,00%
25	Cera ácida de Montana	5,00%
	Ligninossulfonato de cálcio	1,00%
	Copolímeros de bloco de polioxietileno e polioxipropileno	1,00%
	Álcool estearílico (POE 20)	2,00%

Poliorganossilano	0,20%
Tintura corante vermelha	0,05%
Água	65,75%

EXEMPLO H

5	<u>Bastão fertilizante</u>	
	Composto 19	2,5%
	Copolímero de pirrolidona e estireno	4,8%
	16-Etoxilato de triestirilfenila	2,3%
	Talco	0,8%
10	Amido de milho	5,0%
	Fertilizante de liberação lenta Nitrophoska®	
	Permanente 15-9-15 (BASF)	36,0%
	Caulim	38,0%
	Água	10,6%

15 Os compostos de acordo com a presente invenção exibem atividade contra um 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 agronômicas 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.

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, agronômicas e não agronômicas) 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

5 sinergicamente com a expressão fenotípica de proteínas ou outros produtos naturais tóxicos para pragas invertebradas para fornecer controle maior que o aditivo dessas pragas.

As composições de acordo com a presente invenção podem também compreender opcionalmente nutrientes vegetais, tais como uma

10 composição fertilizante que compreende pelo menos um nutriente vegetal selecionado a partir de nitrogênio, fósforo, potássio, enxofre, cálcio, magnésio, ferro, cobre, boro, manganês, zinco e molibdênio. Merecem observação composições que compreendem pelo menos uma composição fertilizante que compreende pelo menos um nutriente vegetal selecionado a partir de

15 nitrogênio, fósforo, potássio, enxofre, cálcio e magnésio. Composições de acordo com a presente invenção que compreendem adicionalmente pelo menos um nutriente vegetal podem apresentar-se na forma de líquidos ou sólidos. Merecem observação formulações sólidas na forma de grânulos pequenos bastões ou pastilhas. Formulações sólidas que compreendem uma

20 composição fertilizante podem ser preparadas por meio de mistura do composto ou composição de acordo com a presente invenção com a composição fertilizante junto com ingredientes de formulação e, em seguida, preparação da formulação por meio de métodos tais como granulação ou extrusão. Alternativamente, podem ser preparadas formulações sólidas por

25 meio de pulverização de uma solução ou suspensão de um composto ou composição de acordo com a presente invenção em um solvente volátil sobre uma composição fertilizante preparada anteriormente na forma de misturas com dimensões estáveis, tais como grânulos, pequenos bastões ou pastilhas e

evaporação do solvente em seguida.

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.

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 parasitas externas incluem, por exemplo, chiques, carapatos, piolhos, mosquitos, moscas, sarna, ácaros e pulgas. Parasitas internos incluem parasitas cardíacos, 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 particularmente apropriados para o combate a pragas transmissoras de doenças ou parasíticas externas. Os compostos e 5 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, tal como cães, gatos, pássaros de estimação e peixes de aquário; bem como 10 os chamados animais experimentais, tal 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 uma composição que compreende um composto de acordo com a presente invenção permite acasalamento de animais mais 15 simples e econômico.

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 gemmatalis*, 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 licarsialis*, 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 (*Hellula 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 (*Crocidolomia 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 pêssego (*Carposina nipponensis*, Walsingham), broca dos ramos de pêssego (*Anarsia lineatella*, Zeller), larva dos tubérculos da batata (*Phthorimaea operculella*, Zeller), lagarta teniforme manchada (*Lithocelletis blancardella*, Fabricius), lagarta das maçãs asiática (*Lithocelletis ringoniella*, Matsumura), cigarreiro do arroz (*Lerodea eufala*, Edwards), lagarta das maçãs (*Leucoptera scitella*, Zeller)); ovos, ninhas 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 (*Listronotus maculicollis*, Dietz), gorgulho da grama azul (*Sphenophorus parvulus*, Gyllenhal), gorgulho caçador (*Sphenophorus venatus vestitus*), gorgulho de Denver (*Sphenophorus cicatrifriatus*, 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 escaribeídeos (por exemplo, besouro japonês (*Popillia japonica*, Newman), besouro oriental (*Anomala orientalis*, Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse), Barraud), 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 escolítídeos 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 ninhas 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, medepalmos 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,

5 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, ninhas 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

10 animal, ou seja, ácaros da poeira da família dos epidermoptídeos, ácaros de folículos da família dos demodicídeos, ácaros dos cereais da família dos glicifagídeos, carapatos da ordem dos ixodídeos, conhecidos como carapatos duros (por exemplo, carapato dos cervos (*Ixodes scapularis*, Say), carapato de parálisia australiano (*Ixodes holocyclus*, Neumann), carapato dos cães

15 americano (*Dermacentor variabilis*, Say), carapato estrela solitário (*Amblyomma americanum*, Linnaeus) e carapatos da família dos argasídeos, comumente conhecidos como carapatos moles (tais como carapato da febre recorrente (*Ornithodoros turicata*), carapato das aves comum (*Argas radiatus*)); ácaros da crosta e de coceira das famílias dos psoroptídeos,

20 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 (tefritídeos), 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 moscoides, 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, imaturos e adultos 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 (5) (*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 10 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), 15 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 20 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 capitidis*, De Geer), piolho do corpo (*Pediculus humanus*, Linnaeus), piolho das 25 galinhas (*Menacanthus stramineus*, Nitszch), 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*, Nitzsch), 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 afigem 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.).

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 licarsialis* Walker (verme de teias do gramado), *Lobesia botrana* Denis e Schiffermüller (traça da uva), *Pectinophora gossypiella* Saunders (larva de mariposa rosa), *Phylloconistis 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)).

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), *Macrosiphum 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), *Theroaphis 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 vastatrix* 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 das plantas marrom menor), *Macrosteles quadrilineatus* Forbes (gafanhoto das folhas de áster), *Nephrotettix cinticeps* Uhler (gafanhoto verde das folhas), *Nephrotettix 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 oryzicola* Muir (delfacídeo de arroz), *Typhlocyba pomaria* McAtee (gafanhoto branco das folhas de maçã), *Erythroneura spp.* (gafanhotos das folhas de uva); *Magicicada septendecim* Linnaeus (cigarra de estação); *Icerya purchasi* Maskell (mede-palmos do algodão), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (mede-palmos 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).

Os compostos de acordo com a presente invenção também apresentam atividade sobre membros da ordem dos hemípteros, que incluem:

- 5 *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), *Corythucha gossypii* Fabricius (besouro de renda de algodão), *Cyrtopeltis modesta* Distant (besouro do tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (besouro do algodão),
- 10 *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*,
- 20 *Athous* ou *Limonius*).

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

Merce observação o uso de compostos de acordo com a presente invenção para o controle de traça das crucíferas (*Plutella xylostella*).

Merce observação o uso de compostos de acordo com a presente invenção para controlar lagarta dos cereais de outono (*Spodoptera frugiperda*). Merce observação o uso de compostos de acordo com a presente invenção para o controle de afídeo do melão e algodão (*Aphis gossypii*).

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, nematicidas, 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 um pesticida com múltiplos componentes, oferecendo espectro ainda mais amplo de utilidade agronômica e não agronômica. Desta forma, a presente invenção também se refere a uma composição que compreende uma quantidade biologicamente eficaz de um composto da Fórmula 1, seu N-óxido ou sal e uma quantidade eficaz de pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional e pode compreender ainda pelo menos um dentre tensoativos, diluentes sólidos ou diluentes líquidos. 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 uma 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 um tanque de pulverização) ou, alternativamente, aplicadas sucessivamente.

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 um modo de ação diferente ou uma classe química diferente, incluindo lactonas macrocíclicas, neonicotinóides, ligantes receptores de octopamina, ligantes receptores de rianodina, agonistas de ecdisona, moduladores de canais de sódio, inibidores da síntese de chitina, análogos de nereisotoxina, inibidores do transporte de elétrons mitocôndricos, inibidores da colinesterase, inseticidas de ciclodieno, inibidores de exúvio, bloqueadores de canais de cloreto regulados por GABA (ácido γ -aminobutírico), imitadores de hormônios juvenis, inibidores da biossíntese de lipídios e agentes biológicos que incluem nucleopoliedrovírus (NPV), membros de *Bacillus thuringiensis*, delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis*; e outros vírus inseticidas de ocorrência natural ou geneticamente modificados.

Merecem observação 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, um membro de *Bacillus thuringiensis*, uma delta-endotoxina de *Bacillus thuringiensis* e um inseticida de ocorrência natural ou geneticamente modificado.

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, acetamiprid, acetoprol, amidoflumet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfós-metil, bifentrina, bifenazato, bistrifluron, buprofezina, carbofuran, cartap, clorfenapir, clorfuaazuron, clorantraniliprol (DPX-E2Y45), clorpirimifós, clorpirimifós-metil, cromafenozida, clotianidina, cflumetofen, cflutrina, beta-cflutrina, cialotrina,

gama-cialotrina, lambda-cialotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuron, diazinon, dieldrina, diflubenzuron, dimeflutrina, dimetoato, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endossulfan, esfenvarelato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvarelato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim (UR-50701), flufenoxuron, fonofós, halofenozida, hexaflumuron, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, isofenfós, lufenuron, malation, metaflumizona, metaldeído, metamidofós, metidation, metomil, metoprene, metoxiclor, metoflutrina, monocrotofós, metoxifenozida, monocrotofós, nitenpiram, nitiazina, novaluron, noviflumuron (XDE-007), oxamil, paration, paration-metil, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofós, proflutrina, protrifenbuta, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridalil, pirifluquinazon, piriprol, piriproxifen, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofen, espiromesifen (BSN 2060), espirotetramat, sulprofós, tebufenozida, teflubenzuron, teflutrina, terbufós, tetraclorvinfós, tiacloprid, 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, blasticidina-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, 25 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, fenpiclonil,

fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferfurazoato, ferinzona, fluazinam, fludioxonil, flumetover, fluopicolida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetyl-alumínio, fuberidazol, furalaxil, furametapir, hexaconazol, himexazol,
5 guazatina, imazalil, imibenconazol, iminoctadina, iodicarb, ipconazol, iprobenfós, iprodiona, iprovalicarb, isoconazol, isoprotiolano, casugamicina, cresoxim-metil, mancozeb, mandipropamid, maneb, mapanipirina, mefenoxam, mepronil, metalaxil, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobina/fenominostrobina, mepanipirim, metrafenona, miconazol,
10 miclobutanol, neo-asozina (metanoarsonato férrico), nuarimol, octilinona, ofurace, orisastrobina, oxadixil, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, paclobutrazol, penconazol, pencicuron, pentiopirad, perfurazoato, ácido fosfônico, ftalida, picobenzamid, picoxistrobina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, cloridrato de propamocarb, propiconazol,
15 propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, priazofós, pirifeno, pirimetanil, pirifeno, pirolnitrina, piroquilon, quinconazol, quinoxifen, quintozeno, siltiofam, simeconazol, espiroxamina, estreptomicina, enxofre, tebuconazol, tecrazene, tecloftalam, tecnazene, tecaconazol, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato, tiofanato-metil, tiram, tiadinil, tolclofós-metil, tolifluanid,
20 triadimefon, triadimenol, triarimol, triazóxido, tridemorf, trimorfamida, triciclavol, trifloxistrobina, 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,
25 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 Celcap, 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 5 *Anagatha falcifera* (AfNPV); e vírus granulose (GV) tal como vírus granulose de *Cydia pomonella* (CpGV).

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.

As referências gerais para estes protetores agrícolas (ou seja, inseticidas, fungicidas, nematicidas, acaricidas, herbicidas e agentes 15 biológicos) incluem *The Pesticide Manual*, 13^a 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.

Merce observação uma composição de acordo com a presente 20 invenção em que pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é selecionado a partir do grupo que consiste de abamectina, acefato, acetamiprid, acetoprol, aldicarb, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfós-metil, bifentrina, bifenazato, bistrifluron, buprofezina, carbofuran, cartap, chinometionat, clorfenapir, clorfluazuron, clorantraniliprol, 25 clorpirimifós, clorpirimifós-metil, clorobenzilato, cromafenozida, clotianidina, ciflumetofen, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, gama-cialotrina, lambda-cialotrina, cihexatrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafenturon, diazinon, dicofol, dieldrina, dienoclor, diflubenzuron, dimeflutrina, dimetoato,

dinotefuran, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvarelato, etiprol, etoxazol, fenamifós, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvarelato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim, flufenoxuron, fonofós, halofenozida,
 5 hexaflumuron, hexitiazox, hidrametilnon, imiciafós, imidacloprid, indoxacarb, isofenfós, lufenuron, malation, metaflumizona, metaldeído, metamidofós, metidation, metomil, metoprene, metoxiclor, metoxifenoza, metoflutrina, monocrotofós, nitenpiram, nitiazina, novaluron, noviflumuron, oxamil, paration, paration-metil, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb,
 10 profenofós, proflutrina, propargita, protrifenbute, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridaben, piridalil, pirifluquinazon, piriprol, piriproxifen, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiridiclofen, espiromesifen, espirotetramat, sulprofós, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzuron, teflutrina, terbufós, tetraclorvinfós, tiacloprid, tiametoxam, tiocarb, tiosultap-sódio,
 15 tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfon, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopoliedrovírus, delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*, bacilovírus, bactérias entomopatogênicas, vírus entomopatogênicos e fungos entomopatogênicos.

Mercece observação específica uma composição de acordo com a
 20 presente invenção em que pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é selecionado a partir do grupo que consiste de abamectina, acefato, acetamiprid, acetoprol, amidoflumet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfós-metil, bifentrina, bifenazato, bistrifluron, buprofezina, carbofuran, cartap, clorfenapir, clorfluazuron, clorpirimifós, clorpirimifós-metil, cromafenoza, clotianidina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, gama-cialotrina, lambda-cialotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuron, diazinon, dieldrina, diflubenzuron, dimetoato, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvarelato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb,

fenpropatrina, fenvarelato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim (UR-50701), flufenoxuron, halofenozida, hexaflumuron, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, isofenfós, lufenuron, malation, metaflumizona, metaldeído, metamidofós, metidation, metomil, metoprene,
 5 metoxiclor, metoxifenoza, metoflutrina, monocrotofós, nitenpiram, nitiazina, novaluron, noviflumuron (XDE-007), oxamil, paration, paration-metil, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofós, proflutrina, protrifenbute, pimetrozina, piretrina, piridalil, piriproxifen, rotenona, rianodina, S1812 (Valent), espinosad, espiridiclofen, espiromesifen (BSN 2060),
 10 sulprofós, tebufenoza, teflubenzuron, teflutrina, terbufós, tetraclorvinfós, tiacloprid, tiame toxam, tiocarb, tiosultap-sódio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfon, triflumuron, aldicarb, fenamifós, amitraz, chinometionat, clorobenzilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, feniproximato, hexitiazox, propargita, piridaben, tebufenpirad,
 15 *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, delta-endotoxina de *Bacillus thuringiensis*, bacilovírus, bactérias entomopatogênicas, vírus entomopatogênicos e fungos entomopatogênicos.

Também merece observação uma 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, acetamiprid, amitraz, avermectina, azadiractina, bifentrina, buprofezina, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifós, clotianidina, cflutrina, beta-cflutrina, cialotrina, lambda-cialotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvarelato, etiprol,
 20 fenotiocarb, fenoxicarb, fenvarelato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flufenoxuron, hexaflumuron, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizona, metomil, metoprene, metoxifenoza, nitenpiram, nitiazina, novaluron, oxamil, pimetrozina, piretrina, piridaben, piridalil, piriproxifen,
 25

rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofen, espiromesifen, tebufenozida, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sódio, tralometrina, triazamato, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopoliedrovírus e delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*.

Merece observação adicional uma 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 e beta-ciflutrina, esfenvarelato, fenvarelato, tralometrina, fenotiocarb, metomil, oxamil, tiodicarb, acetamiprid, clotianidina, imidaclorpid, tiametoxam, tiacloprid, indoxacarb, espinosad, abamectina, avermectina, emamectina, endossulfan, etiprol, fipronil, flufenoxuron, triflumuron, diofenolan, piriproxifen, pimetrozina, amitraz, *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, delta endotoxina de *Bacillus thuringiensis* e fungos entomófagos.

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.

Em certos casos, combinações de um composto de acordo com a presente invenção com outros agentes ou compostos (ou seja, ingredientes

ativos) biologicamente ativos (particularmente no controle de pragas invertebradas) podem resultar em um 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 5 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.

10 Merece observação uma combinação de um composto da Fórmula 1 com pelo menos um outro ingrediente ativo de controle de pragas invertebradas. Merece observação específica uma combinação em que o outro ingrediente ativo de controle de pragas invertebradas possui um local de ação diferente do composto da Fórmula 1. Em certos casos, uma combinação com 15 pelo menos um outro ingrediente ativo de controle de pragas invertebradas que possui um espectro de controle similar mas local de ação diferente será particularmente vantajosa para administração de resistência. Desta forma, uma composição de acordo com a presente invenção pode compreender adicionalmente uma quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um 20 ingrediente ativo de controle de pragas invertebradas adicional que possui um espectro de controle similar mas local de ação diferente. O contato de uma planta geneticamente modificada para que expresse um composto de praga invertebrada (tal como proteína) ou o local da planta com uma quantidade biologicamente eficaz de um composto de acordo com a presente invenção 25 pode também fornecer um espectro mais amplo de proteção às plantas e ser vantajoso para a administração de resistência.

A Tabela A relaciona combinações específicas de um 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 um composto da Fórmula 1, seu N-óxido ou sal (tal como "50:1 a 1:50" de abamectina com relação a um composto da Fórmula 1 em peso).

5 Desta forma, por exemplo, a primeira linha da Tabela A descreve especificamente que a combinação de um composto da Fórmula 1 com abamectina pode ser aplicada em uma 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 um

10 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.

15

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
Acetamiprid	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

Agente de controle de pragas invertebradas	Modo de ação ou classes químicas	Razão em peso típica
Buprofezina	Inibidores da síntese de chitina	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
Clorpirimifós	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 chitina	400:1 a 1:50
Deltametrina	Moduladores de canais de sódio	50:1 a 1:400
Dieldrina	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
Endossulfan	Inseticidas de ciclodieno	200:1 a 1:100
Esfenvarelato	Moduladores de canais de sódio	100:1 a 1:400
Etiproli	Bloqueadores de canais de cloreto regulados por GABA	200:1 a 1:100
Fenotiocarb		150:1 a 1:200
Fenoxicarb	Imitadores de hormônios juvenis	500:1 a 1:100
Fenvarelato	Moduladores de canais de sódio	150:1 a 1:200
Fipronil	Bloqueadores de canais de cloreto regulados por GABA	150:1 a 1:100
Flonicamid		200:1 a 1:100

Agente de controle de pragas invertebradas	Modo de ação ou classes químicas	Razão em peso típica
Flubendiamida	Ligantes receptores de rianodina	100:1 a 1:120
Flufenoxuron	Inibidores da síntese de chitin	200:1 a 1:100
Hexaflumuron	Inibidores da síntese de chitin	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 chitina	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
Metoxifenozida	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 chitina	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
Piralalil		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

Agente de controle de pragas invertebradas	Modo de ação ou classes químicas	Razão em peso típica
Espirodiclofen	Inibidores da biossíntese de lipídios	200:1 a 1:200
Espiromesifen	Inibidores da biossíntese de lipídios	200:1 a 1:200
Tebufenozida	Agonistas de ecdisona	500:1 a 1:250
Tiacloprid	Neonicotinóides	100:1 a 1:200
Tiametoxam	Neonicotinóides	1250:1 a 1:1000
Tiodicarb	Inibidores da colinesterase	500:1 a 1:400
Tiosultap-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 chitina	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

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, cifultrina, beta-cifultrina, 5 deltametrina, dimeflutrina, esfenvarelato, fenvarelato, indoxacarb, metoflutrina, proflutrina, piretrina e tralometrina; inibidores da colinesterase, tais como clorpirifós, metomil, oxamil, tiocicarb e triazamato; neonicotinóides, tais como acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, imidaclorpid, nitempiram, nitiazina, tiacloprid e tiametoxam; lactonas 10 macrocíclicas inseticidas, tais como espinetoram, espinosad, abamectina, avermectina e emamectina; bloqueadores de canais de cloreto regulados

por GABA (ácido γ -aminobutírico), tais como endossufan, etiprol e fipronil; inibidores da síntese de chitina, tais como buprofezina, ciromazina, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron e triflumuron; imitadores de hormônios juvenis, tais como diofenolan, 5 fenoxicarb, metoprene e piriproxifen; ligantes receptores de octopamina, tais como amitraz; agonistas de ecdisona, tais como azadiractina, metoxifenozida e tebufenozida; 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 10 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 espirodiclofen e espiromesifen; inseticidas de ciclodieno tais como dieldrina; ciflumetofen; 15 fenotiocarb; flonicamid; metaflumizona; pirafluprol; piridalil; piriprol; pimetrozina; espirotetramat e tiosultap-sódio. Uma realização de agentes biológicos para mistura com compostos de acordo com a presente invenção inclui nucleopoliedrovírus tais 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 20 dos Agentes de Controle de Pragas Invertebradas relacionados na Tabela A acima.

As razões em peso entre um composto, incluindo um 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.

Encontram-se relacionadas abaixo na Tabela B realizações de 5 composições específicas que compreendem composto da Fórmula 1 (os números de compostos designam compostos na Tabela Índice A) 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	2	and Abamectin	B-1	19	and Abamectin
A-2	2	and Acetamiprid	B-2	19	and Acetamiprid
A-3	2	and Amitraz	B-3	19	and Amitraz
A-4	2	and Avermectin	B-4	19	and Avermectin
A-5	2	and Azadirachtin	B-5	19	and Azadirachtin
A-6	2	and Beta-cyfluthrin	B-6	19	and Beta-cyfluthrin
A-7	2	and Bifenthrin	B-7	19	and Bifenthrin
A-8	2	and Buprofezin	B-8	19	and Buprofezin
A-9	2	and Cartap	B-9	19	and Cartap
A-10	2	and Chlorantraniliprole	B-10	19	and Chlorantraniliprole
A-11	2	and Chlорfenапyr	B-11	19	and Chlорfenапyr
A-12	2	and Chlorpyrifos	B-12	19	and Chlorpyrifos
A-13	2	and Clothianidin	B-13	19	and Clothianidin
A-14	2	and Cyfluthrin	B-14	19	and Cyfluthrin
A-15	2	and Cyhalothrin	B-15	19	and Cyhalothrin
A-16	2	and Cypermethrin	B-16	19	and Cypermethrin
A-17	2	and Cyromazine	B-17	19	and Cyromazine
A-18	2	and Deltamethrin	B-18	19	and Deltamethrin
A-19	2	and Dieldrin	B-19	19	and Dieldrin
A-20	2	and Dinotefuran	B-20	19	and Dinotefuran
A-21	2	and Diofenolan	B-21	19	and Diofenolan
A-22	2	and Emamectin	B-22	19	and Emamectin
A-23	2	and Endosulfan	B-23	19	and Endosulfan
A-24	2	and Esfenvalerate	B-24	19	and Esfenvalerate
A-25	2	and Ethiprole	B-25	19	and Ethiprole
A-26	2	and Fenothiocarb	B-26	19	and Fenothiocarb
A-27	2	and Fenoxy carb	B-27	19	and Fenoxy carb
A-28	2	and Fenvalerate	B-28	19	and Fenvalerate

Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent	Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent
A-29	2	and	Fipronil	B-29	19	and	Fipronil
A-30	2	and	Flonicamid	B-30	19	and	Flonicamid
A-31	2	and	Flubendiamide	B-31	19	and	Flubendiamide
A-32	2	and	Flufenoxuron	B-32	19	and	Flufenoxuron
A-33	2	and	Hexaflumuron	B-33	19	and	Hexaflumuron
A-34	2	and	Hydramethylnon	B-34	19	and	Hydramethylnon
A-35	2	and	Imidacloprid	B-35	19	and	Imidacloprid
A-36	2	and	Indoxacarb	B-36	19	and	Indoxacarb
A-37	2	and	Lambda-cyhalothrin	B-37	19	and	Lambda-cyhalothrin
A-38	2	and	Lufenuron	B-38	19	and	Lufenuron
A-39	2	and	Metaflumizone	B-39	19	and	Metaflumizone
A-40	2	and	Methomyl	B-40	19	and	Methomyl
A-41	2	and	Methoprene	B-41	19	and	Methoprene
A-42	2	and	Methoxyfenozide	B-42	19	and	Methoxyfenozide
A-43	2	and	Nitenpyram	B-43	19	and	Nitenpyram
A-44	2	and	Nithiazine	B-44	19	and	Nithiazine
A-45	2	and	Novaluron	B-45	19	and	Novaluron
A-46	2	and	Oxamyl	B-46	19	and	Oxamyl
A-47	2	and	Pymetrozine	B-47	19	and	Pymetrozine
A-48	2	and	Pyrethrin	B-48	19	and	Pyrethrin
A-49	2	and	Pyridaben	B-49	19	and	Pyridaben
A-50	2	and	Pyridalyl	B-50	19	and	Pyridalyl
A-51	2	and	Pyriproxyfen	B-51	19	and	Pyriproxyfen
A-52	2	and	Ryanodine	B-52	19	and	Ryanodine
A-53	2	and	Spinetoram	B-53	19	and	Spinetoram
A-54	2	and	Spinosad	B-54	19	and	Spinosad
A-55	2	and	Spirodiclofen	B-55	19	and	Spirodiclofen
A-56	2	and	Spiromesifen	B-56	19	and	Spiromesifen
A-57	2	and	Tebufenozide	B-57	19	and	Tebufenozide
A-58	2	and	Thiacloprid	B-58	19	and	Thiacloprid
A-59	2	and	Thiamethoxam	B-59	19	and	Thiamethoxam
A-60	2	and	Thiodicarb	B-60	19	and	Thiodicarb
A-61	2	and	Thiosultap-sodium	B-61	19	and	Thiosultap-sodium
A-62	2	and	Tralomethrin	B-62	19	and	Tralomethrin
A-63	2	and	Triazamate	B-63	19	and	Triazamate
A-64	2	and	Triflumuron	B-64	19	and	Triflumuron

Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent	Mixture No.	Comp. No.	and	Invertebrate Pest Control Agent
A-65	2	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>	B-65	19	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>
A-66	2	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>	B-66	19	and	<i>Bacillus thuringiensis</i>
			delta-endotoxin				delta-endotoxin
A-67	2	and	NPV (e.g., Gemstar)	B-67	19	and	NPV (e.g., Gemstar)

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.

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 uma 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.

Desta forma, a presente invenção compreende um método de controle de pragas invertebradas em aplicações agronômicas e/ou não agronômicas, que compreende o contato da praga invertebrada ou seu ambiente com uma quantidade biologicamente eficaz de um ou mais dos compostos de acordo com a presente invenção, ou com uma composição que compreende pelo menos um desses compostos ou uma composição que compreende pelo menos um desses compostos e uma quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional. Exemplos de composições apropriadas que compreendem um composto de acordo com a presente invenção e uma 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.

Para atingir contato com um composto ou composição de acordo com a presente invenção para proteger uma 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.

Uma realização de um método de contato é por meio de pulverização. Alternativamente, uma composição granular que compreende 5 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 uma composição que compreende um composto de acordo com a presente invenção aplicado na forma de encharcamento de solo com uma 10 formulação líquida, uma formulação granular ao solo, tratamento de uma caixa de mudas ou mergulhamento de transplantes. Merece observação uma composição de acordo com a presente invenção na forma de formulação líquida para encharcamento de solo. Também merece observação um método de controle de pragas invertebradas que compreende o contato da praga 15 invertebrada ou seu ambiente com uma quantidade biologicamente eficaz de um composto de acordo com a presente invenção ou com uma composição que compreende uma quantidade biologicamente eficaz de um composto de acordo com a presente invenção. Merece observação adicional é o método em que o ambiente é solo e a composição é aplicada ao solo na forma de formulação de 20 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 um composto ou composição de acordo com a presente invenção por meio de pulverizações diretas e residuais, pulverizações aéreas, géis, revestimentos de 25 sementes, microencapsulações, absorção sistêmica, iscas, marcas de orelhas, misturas, nebulizadores, fumigantes, aerossóis, pós e muitos outros. Uma realização de método de contato é um grânulo, bastão ou pastilha fertilizante com dimensões estáveis que compreende um 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).

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 uma 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 que se desenvolve 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.

Um método de tratamento de sementes é por meio de pulverização ou polvilhamento da semente com um 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 um agente adesivo ou formador de filme. Portanto, uma composição de revestimento de sementes de acordo com a presente invenção compreende tipicamente uma quantidade biologicamente

- eficaz de um composto da Fórmula 1, seu N-óxido ou sal e um formador de filme ou agente adesivo. As sementes podem ser revestidas por meio de pulverização de um concentrado em suspensão fluida diretamente para um leito de tombamento de sementes e secagem das sementes em seguida.
- 5 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.
- 10 Processos apropriados incluem os relacionados em P. Kosters et al, *Seed Treatment: Progress and Prospects*, Monografia BCPC 1994 nº 57, e referências ali relacionadas.

A semente tratada compreende tipicamente um composto de acordo com a presente invenção em quantidade de cerca de 0,1 g a 1 kg por 15 100 kg de sementes (ou seja, cerca de 0,0001 a 1% em peso da semente antes do tratamento). Uma 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 um adesivo formador de filme, cerca de 0,5 a cerca de 20% de um agente dispersante, 0 a cerca de 5% de um 20 espessante, 0 a cerca de 5% de pigmento e/ou tinta, 0 a cerca de 2% de um agente antiespumante, 0 a cerca de 1% de um conservante e 0 a cerca de 75% de um diluente líquido volátil.

Os compostos de acordo com a presente invenção podem ser incorporados a uma composição de isca que é consumida por pragas 25 invertebradas ou utilizados em um dispositivo tal como uma armadilha, estação de isca e similares. Essa composição de isca pode apresentar-se na forma de grânulos que compreendem (a) ingredientes ativos, nomeadamente uma quantidade biologicamente eficaz de um 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, 5 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.

10 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 15 seja, agentes retentores de umidade, são glicóis e outros polióis, glicerina e sorbitol. Merece observação uma composição de isca (e um 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. Um dispositivo de controle de pragas invertebradas pode compreender a composição 20 de isca do presente e um 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 ter acesso à composição de isca a partir de um local fora do abrigo e em que o abrigo é adicionalmente adaptado para colocação em um local de atividade 25 conhecida ou potencial para a praga invertebrada.

Os compostos de acordo com a presente invenção podem ser aplicados sem outros adjuvantes, mas mais freqüentemente a aplicação será de uma formulação que compreende um ou mais ingredientes ativos com

veículos, diluentes e tensoativos apropriados e, possivelmente, em combinação com um alimento, dependendo do uso final contemplado. Um método de aplicação envolve a pulverização de uma dispersão em água ou solução em óleo refinado de um composto de acordo com a presente invenção.

5 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 uma lata, garrafa ou

10 outro recipiente, seja por meio de uma bomba ou de sua liberação de um recipiente pressurizado, tal como uma 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,

15 propelentes, agentes espumantes etc., conforme venha a ser o caso. Merece observação uma composição de pulverização que compreende uma quantidade biologicamente eficaz de um composto ou composição de acordo com a presente invenção e um veículo. Uma realização dessa composição de pulverização compreende uma quantidade biologicamente eficaz de um composto ou composição de acordo com a presente invenção e um propelente.

20 Os propelentes representativos incluem, mas sem limitar-se a metano, etano, propano, butano, isobutano, buteno, pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrofluorocarbonos, clorofluorocarbonos, dimetil éter e misturas dos acima. Merece observação uma composição de pulverização (e um método

25 que utiliza essa composição de pulverização liberada de um 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, carapatos, aranhas, formigas, mosquitos e similares, incluindo individualmente ou em combinações.

Aplicações não agronômicas incluem a proteção de animais, particularmente vertebrados, mais particularmente vertebrados homeotérmicos 5 (tais como mamíferos ou pássaros) e, ainda mais particularmente, mamíferos, contra pragas parasíticas invertebradas por meio da administração de uma quantidade eficaz como parasiticida (ou seja, biologicamente eficaz) de um composto de acordo com a presente invenção, tipicamente na forma de uma composição formulada para uso veterinário, ao animal a ser protegido. Merece 10 observação, portanto, um método de proteção de animais que compreende a administração ao animal de uma 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 15 parasiticida" indicam efeitos observáveis sobre pragas parasitas invertebradas para fornecer proteção de um 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 20 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 uma quantidade eficaz como parasiticida de um composto de acordo com a presente invenção a 25 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), 5 *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 10 (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 scabei*, *Chorioptes bovis*, *Demodex equi*, *Cheyletiella spp*, *Notoedres cati*, *Trombicula spp* e *Otodectes cyanotis* (ácaros dos ouvidos); percevejos, tais como *Ixodes 15 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).

Aplicações não agronômicas no setor veterinário têm lugar por meios convencionais, tais como por meio de administração enteral na forma de, 20 por exemplo, pastilhas, cápsulas, bebidas, preparações de encharcamento, granulados, pastas, misturas, procedimentos de alimentação, 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, 25 pulverização, lavagem, revestimento com pó ou aplicação a uma 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.

Tipicamente, uma composição parasiticida de acordo com a presente invenção compreende uma mistura de um 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 5 relação à via de administração pretendida (tal como administração oral, local ou parenteral como injeção) e de acordo com a prática padrão. Além disso, um 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, 10 portanto, uma composição de proteção de animais contra pragas parasitas invertebradas que compreende uma quantidade eficaz como parasiticida de um composto de acordo com a presente invenção e pelo menos um veículo.

Para administração parenteral, incluindo injeção intravenosa, intramuscular e subcutânea, um composto de acordo com a presente invenção 15 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 um sal de um composto ativo), preferencialmente em tampões fisiologicamente 20 compatíveis que contêm outros excipientes ou auxiliares, conforme conhecido na técnica de formulação farmacêutica.

Para administração oral na forma de soluções (a forma mais facilmente disponível de absorção), emulsões, suspensões, pastas, géis, 25 cápsulas, pastilhas, misturas, pós, grânulos, blocos de retenção no rume e blocos de alimentação/água/lambadura, um 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 zeina 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 que seja facilmente ejetada.

Caso as composições parasiticidas 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 parasiticidas, aditivos que promovam a saúde ou crescimento animal, melhorando a qualidade da carne de animais para abate, ou úteis de outra forma para a criação de animais. Estes aditivos podem incluir, por exemplo, vitaminas, antibióticos, quimioterapêuticos, bactericidas, fungicidas, coccidiocidas e hormônios.

Descobriu-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 parasiticidas de compostos de acordo com a presente invenção no fluxo sanguíneo protegem o animal tratado contra pragas sugadoras de sangue, tais como pulgas, camundongos e piolhos. Merece observação, portanto, uma composição de proteção de animais contra pragas parasitas invertebradas em uma forma para administração oral (ou seja, que

compreendem, além de uma quantidade eficaz como parasiticida de um 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).

5 Formulações para administração local encontram-se tipicamente na forma de pó, creme, suspensão, pulverização, emulsão, espuma, pasta, aerossol, ungüento, pomada ou gel. Mais tipicamente, uma formulação local é uma solução hidrossolúvel, que pode apresentar-se na forma de um concentrado que é diluído antes do uso. As composições parasiticidas 10 apropriadas para administração local compreendem tipicamente um composto de acordo com a presente invenção e um ou mais veículos apropriados para uso local. Em aplicações de uma composição parasiticida 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, 15 no todo ou em sua maior parte, a sua extensão externa. Como resultado, o animal tratado é particularmente protegido contra pragas invertebradas que se alimentam da epiderme do animal, tais como percevejos, pulgas e piolhos. Formulações para administração localizada compreendem freqüentemente, portanto, pelo menos um solvente orgânico para facilitar o transporte do 20 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.

A taxa de aplicação necessária para controle efetivo (ou seja, 25 "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,

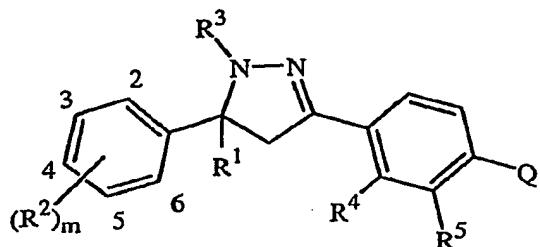
temperatura e similares. Sob circunstâncias normais, taxas de aplicação de cerca de 0,01 a 2 kg de ingrediente ativo por hectare são suficientes para controlar pragas em ecossistemas agronômicos, mas até 0,0001 kg/hectare podem ser suficientes ou até 8 kg/hectare podem ser necessários. Para 5 aplicações 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.

10 Geralmente, para uso veterinário, um composto da Fórmula 1, seu N-óxido ou sal é administrado em uma quantidade eficaz como parasiticida a um animal a ser protegido contra pragas parasitas invertebradas. Uma quantidade eficaz como parasiticida é a quantidade de ingrediente ativo necessária para atingir um efeito observável de redução da ocorrência ou 15 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 20 necessária para atingir um resultado específico pode ser determinada por meio de simples experimentação.

Para administração oral a animais homeotérmicos, a dosagem diária de um 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 25 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 um composto de acordo com a presente invenção.

As abreviações a seguir são utilizadas nas Tabelas Índice A e B que se seguem: Me é metila e CF_3 indica trifluorometila. A abreviação "Ex." representa "Exemplo" e é seguida por um número que indica em qual exemplo é preparado o composto. Na Tabela Índice A, $(\text{R}^2)_m$ indica a combinação de $(\text{R}^2)_n$ conforme exibido no caso em que Z é CR^2 conforme especificado para a Fórmula 1.

TABELA ÍNDICE A



Compound	$(\text{R}^2)_m$	R^1	R^3	R^4	R^5	Q	m.p. (°C)
1	3-Cl, 5-Cl	CF_3	H	Me	H	Br	*
2 (Ex. 1)	3-Cl, 5-Cl	CF_3	Me	H	Me	$\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2\text{-2-pyridinyl})$	**
3	3-Cl, 5-Cl	CF_3	CH_2CF_3	H	Me	$\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2\text{-2-pyridinyl})$	*
4	3-Cl, 5-Cl	CF_3	H	H	Me	Br	*
5	H	CF_3	CH_2CF_3	H	H	$\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2\text{-2-pyridinyl})$	*
6	H	CF_3	phenyl	H	H	$\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2\text{-2-pyridinyl})$	*
7	3-Cl, 5-Cl	CF_3	phenyl	H	H	$\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CF}_3$	*
8	3-Cl, 5-Cl	CF_3	CH_2CF_3	H	H	$\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CF}_3$	*
9	3-Cl, 5-Cl	CF_3	Me	H	H	$\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2\text{-2-pyridinyl})$	*
10	3-Cl, 5-Cl	CF_3	phenyl	H	H	$\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2\text{-2-pyridinyl})$	*
11	3-Cl, 5-Cl	CF_3	CH_2CF_3	H	H	$\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2\text{-2-pyridinyl})$	*
12 (Ex. 2)	3-Cl, 5-Cl	CF_3	Me	H	H	$\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CF}_3$	**
13	3-Cl, 5-Cl	CF_3	phenyl	H	Me	$\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2\text{-2-pyridinyl})$	*
14	3-Cl, 5-Cl	CF_3	H	H	H	F	*
15	4-Cl	CF_3	H	H	H	$1H\text{-1,2,4-triazol-1-yl}$	*
16	4-Cl	CF_3	Me	H	H	$1H\text{-1,2,4-triazol-1-yl}$	*
17	H	CF_3	Me	H	H	$\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2\text{-2-pyridinyl})$	*
18	3-Cl, 5-Cl	CF_3	H	H	H	$1H\text{-1,2,4-triazol-1-yl}$	*
19	3-Cl, 5-Cl	CF_3	Me	H	H	$1H\text{-1,2,4-triazol-1-yl}$	*
20	3-Cl, 5-Cl	CF_3	CH_2CF_3	H	H	$1H\text{-1,2,4-triazol-1-yl}$	*

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

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

TABELA ÍNDICE B

Comp. nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
1	δ 7,43 (s, 2H), 7,40 (m, 1H), 7,37 (m, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,11 (m, 1H), 6,54 (s, 1H), 3,83 (m, 1H), 3,45 (m, 1H), 2,51 (s, 3H).
3	δ 8,55 (m, 1H), 7,74 (m, 1H), 7,53 (m, 1H), 7,40 (m, 4H), 7,35 (m, 1H), 7,23 (m, 2H), 5,54 (s, 1H), 5,16 (s, 1H), 4,77 (m, 2H), 3,42 (m, 2H), 2,51 (s, 3H).
4	δ 7,53 (m, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,40 (s, 2H), 7,37 (s, 1H), 7,29 (m, 1H), 6,36 (s, 1H), 3,81 (m, 1H), 3,38 (m, 1H), 2,39 (s, 3H).
5	δ 8,59 (d, 1H), 7,92 (d, 2H), 7,74 (d, 2H), 7,74-7,62 (m, 2H), 7,42 (s aparente, 4H), 7,38-7,32 (m, 2H), 7,26-7,22 (m, 1H), 4,79 (d, 2H), 3,91 (d, 1H), 3,78-3,62 (m, 1H), 3,57 (d, 1H), 3,49-3,32 (m, 1H).
6	δ 8,59 (d, 1H), 7,93 (d, 2H), 7,81 (d, 2H), 7,8-7,6 (m, 2H), 7,51 (br d, 2H), 7,41-7,33 (m, 4H), 7,20-7,02 (m, 4H), 6,85 (br t, 1H), 4,79 (d, 2H), 4,18 (d, 1H), 3,60 (d, 1H).
7	δ 7,83 (d, 2H), 7,78 (d, 2H), 7,40 (s aparente, 3H), 7,19 (t, 2H), 7,05 (d, 2H), 6,97 (t, 1H), 6,37 (br t, 1H), 4,22-4,10 (m, 3H), 3,57 (d, 2H).
8	(DMSO- d_6) δ 8,00 (d, 2H), 7,80 (s, 1H), 7,72 (d, 2H), 7,38 (s, 2H), 7,03 (br s, 1H), 4,21-3,65 (m, 6H).
9	δ 8,58 (d, 1H), 7,89 (d, 2H), 7,77-7,60 (m, 4H), 7,41-7,32 (m, 4H), 7,25-7,20 (m, 1H), 4,78 (d, 2H), 3,92 (d, 1H), 3,39 (d, 1H), 3,10 (s, 3H).
10	δ 8,56 (d, 1H), 7,93 (d, 2H), 7,77 (d, 2H), 7,71 (dt, 1H), 7,68 (br t, 1H), 7,41 (br s, 2H), 7,39-7,34 (m, 2H), 7,26-7,15 (m, 3H), 7,05 (d, 2H), 6,94 (t, 1H), 4,77 (d, 2H), 4,14 (d, 1H), 3,54 (d, 1H).
11	(DMSO- d_6) δ 9,21 (t, 1H), 8,52 (d, 1H), 7,98 (d, 2H), 7,79-7,74 (m, 4H), 7,38 (s, 1H), 7,37-7,22 (m, 3H), 4,59 (d, 2H), 4,22-4,03 (m, 2H), 3,92 (d, 1H), 3,82-3,69 (m, 1H).
13	δ 8,57 (m, 1H), 6,74-7,72 (m, 14H), 6,12 (m, 1H), 4,79 (m, 2H), 3,79 (m, 1H), 3,39 (m, 1H), 2,48 (s, 3H).

Comp. nº	Dados de NMR ^1H (solução de CDCl_3 a menos que indicado em contrário) ^a
14	δ 7,98 (m, 1H), 7,61 (m, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,42 (s, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,08 (m, 2H), 6,47 (s, 1H), 3,83 (m, 1H), 3,40 (m, 1H).
15	δ 8,56 (s, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,70 (m, 4H), 7,34 (m, 4H), 3,82 (m, 1H), 3,42 (m, 1H).
16	δ 8,59 (s, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,71 (m, 4H), 7,40 (m, 4H), 3,89 (m, 1H), 3,45 (m, 1H), 3,04 (s, 3H).
17	δ 8,58 (m, 1H), 7,89 (m, 2H), 7,77 (m, 2H), 7,64 (m, 2H), 7,46 (m, 2H), 7,37 (m, 4H), 4,78 (m, 2H), 3,92 (d, 1H), 3,44 (d, 1H), 3,03 (s, 3H).
18	δ 8,61 (s, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,76 (m, 4H), 7,45 (s, 2H), 7,40 (m, 1H), 6,68 (s, 1H), 3,91 (d, 1H), 3,45 (d, 1H).
19	δ 8,61 (s, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,71 (m, 4H), 7,46 (m, 1H), 7,42 (m, 2H), 3,93 (d, 1H), 3,40 (d, 1H), 3,12 (m, 3H).
20	δ 8,63 (s, 1H), 8,14 (s, 1H), 7,80 (m, 2H), 7,71 (m, 2H), 7,41 (m, 2H), 7,05 (m, 1H), 5,60 (s, 1H), 5,23 (s, 1H), 3,46 (m, 2H).

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

EXEMPLOS BIOLÓGICOS DA INVENÇÃO

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 alimentação significativamente reduzida. A proteção de controle de pragas oferecida pelos compostos não se limita, entretanto, a essas espécies. Vide as Tabelas Índice A e B para descrições de compostos.

TESTE A

Para avaliar o controle de traça das crucíferas (*Plutella xylostella*),

a unidade de teste consistiu de um pequeno recipiente aberto com uma planta de rabanete com doze a quatorze dias de idade no seu interior. Esta foi previamente infestada com dez a quinze larvas neonatais sobre um pedaço de alimento para insetos, utilizando um amostrador central para remover um batoque de uma folha de alimento para insetos endurecido que contém várias larvas crescendo sobre ela e transferir o batoque que contém larvas e alimento para a unidade de teste. As larvas moveram-se para a planta de teste à medida que o batoque de alimento secou.

Compostos de teste foram formulados utilizando uma solução contendo 10% de acetona, 90% de água e 300 ppm de tensoativo não iônico Fórmula X-77® Spreader Lo-Foam contendo alquilarilpolioxietíleno, 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 um 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 50 ppm, o que 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, uma tampa com tela preta foi colocada sobre o topo. As unidades de teste foram mantidas por seis dias em uma câmara de crescimento a 25 °C e umidade relativa de 70%. O nível de eficácia de controle do composto de teste foi determinado visualmente em seguida com base nos danos por alimentação da folhagem e na mortalidade das larvas de cada unidade de teste.

Dos compostos da Fórmula 1 testados, os seguintes forneceram níveis muito bons a excelentes de proteção das plantas (30% ou menos de danos por alimentação ou 70% ou mais de mortalidade): 2, 11, 12 e 19.

TESTE B

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

Dos compostos da Fórmula 1 testados, os seguintes forneceram níveis muito bons a excelentes de proteção das plantas (20% ou menos de danos por alimentação ou 80% ou mais de mortalidade): 2.

15

TESTE C

Para avaliação do controle de afídeo do melão e algodão (*Aphis gossypii*) por meio de contato e/ou meios sistêmicos, a unidade de teste consistiu de um pequeno recipiente aberto com uma planta de algodão com seis a sete dias de idade no seu interior. Esta foi previamente infestada com trinta a quarenta afídeos sobre um pedaço de folha extirpado de uma planta de cultivo (método de folha cortada). As larvas moveram-se para a planta de teste à medida que o pedaço de folha era dissecado. Após a infestação prévia, o solo da unidade de teste foi coberto com uma camada de areia.

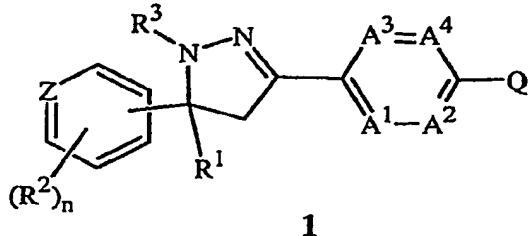
Os compostos de teste foram formulados e pulverizados a 250 ppm conforme descrito para o Teste A. As aplicações foram repetidas por três vezes. Após a pulverização do composto de teste formulado, cada unidade de teste foi mantida para secar por uma hora e, em seguida, foi colocada uma tampa com tela preta sobre ela. As unidades de teste foram mantidas por seis

dias em uma câmara de crescimento a 19-21 °C e umidade relativa de 50 a 70%. Cada unidade de teste foi avaliada visualmente em seguida para determinar a mortalidade dos insetos.

Dos compostos da Fórmula 1 testados, os seguintes resultaram
5 em 80% ou mais de mortalidade: 2.

REIVINDICAÇÕES

1. COMPOSTO, da Fórmula 1, seu *N*-óxido ou sal:



em que:

- Z é N ou CR²;
- A¹ é CR⁴ ou N;
- A² é CR⁵ ou N;
- A³ é CR⁶ ou N;
- A⁴ é CR⁷ ou N;
- Q é um heterociclo saturado ou insaturado com cinco ou

10 seis membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de 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, 15 alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₈, ciano, nitro, C(O)NR⁸R⁹, C(O)OR¹⁰, fenila e piridinila, em que cada fenila ou piridinila é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹¹; ou

- Q é C(O)NR¹²R¹³, C(S)NR¹²R¹³, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵ ou R¹⁶;
- R¹ é ciano; ou alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquicicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹⁷;
- 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-C₈, alcoxicarbonila C₂-C₄, alquilaminocarbonila C₂-C₄, dialquilaminocarbonila C₃-C₉,

5 ciano ou nitro;

- R³ é H, ciano ou -CHO; ou alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, fenila, alquilcarbonila C₁-C₆, alcoxicarbonila C₁-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆ ou dialquilaminocarbonila C₃-C₉, cada qual opcionalmente substituído com

10 um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹⁸;

- R⁴, R⁵, R⁶ e R⁷ são selecionados independentemente a partir de 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-C₈, ciano e nitro; ou

- R⁶ e R⁷ são tomados em conjunto para formar um anel aromático fundido, em que o anel aromático fundido contém como membros de anéis, além dos átomos de cabeça de ponte A³ e A⁴, três átomos selecionados a partir de um a dois átomos de carbono, zero a dois átomos de nitrogênio, zero a um átomo de oxigênio e zero a um átomo de enxofre ou quatro átomos selecionados a partir de dois a quatro átomos de carbono e zero a dois átomos de nitrogênio;

- cada R⁸, R¹² e R¹⁴ é independentemente H, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, alquilcarbonila C₂-C₇, alcoxialquila C₂-C₆ ou alcoxicarbonila C₂-C₇;

- cada R⁹, R¹⁰, R¹³ e R¹⁵ é independentemente H, alquila C₁-

C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquicicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹⁹:

- cada R¹¹, R²³ e R²⁴ é independentemente halogênio, alquila

5 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, alquilaminossulfonila C₁-C₆, alquilamino C₁-C₈, dialquilamino C₂-C₈, alcoxcarbonila C₂-C₄, ciano ou nitro;

- R¹⁶ é halogênio, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆,

10 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-C₈, ciano ou nitro;

- cada R¹⁷ e R¹⁸ é independentemente halogênio, alquila C₁-

15 C₆, alcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, ciano ou nitro;

- cada R¹⁹ é independentemente halogênio, alquila C₁-C₆, alcóxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₆, alcoxcarbonila C₂-C₆, trimetilsílica, ciano, nitro ou Q¹;

20 - cada Q¹ é independentemente um fenila ou um heterociclo saturado ou insaturado com cinco ou seis membros, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de 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-C₈, ciano, nitro, C(O)NR²⁰R²¹, C(O)OR²², fenila ou piridinila, em que cada fenila ou piridinila é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes

selecionados independentemente a partir de R²³;

- cada R²⁰ é independentemente H, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, alquilcarbonila C₂-C₇ ou aloxicarbonila C₂-C₇;

5 - cada R²¹ e R²² é independentemente H, alquila C₁-C₆, haloalquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, fenila ou piridinila; em que cada fenila ou piridinila é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R²⁴; e

10 - n é 1, 2, 3 ou 4.

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

- Q é um heterociclo insaturado com cinco ou seis membros selecionado a partir de piridinila, pirimidinila, triazinila, pirazolila, triazolila, imidazolila, oxazolila, isoxazolila, tiazolila e isotiazolila, em que cada heterociclo é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de 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 20 C₂-C₈, ciano, nitro, C(O)NR⁸R⁹, C(O)OR¹⁰, fenila e piridinila, em que cada fenila ou piridinila é opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹¹; ou Q é C(O)NR¹²R¹³, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵ ou R¹⁶;

- Z é CR²;

25 - no máximo um dentre A¹, A², A³ e A⁴ é N;

- R¹ é alquila C₁-C₃ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹⁷;

- cada R² é selecionado independentemente a partir de H,

halogênio ou haloalquila C₁-C₂;

- R³ é H ou ciano; ou alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de halogênio;
 - R⁴ e R⁵ são selecionados independentemente a partir de
- 5 halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, ciano e nitro;
- R⁶ e R⁷ são selecionados independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, ciano e nitro; ou R⁶ e R⁷ são tomados em conjunto para formar um anel aromático fundido, em que o anel aromático fundido contém como membros de anéis, além dos átomos de
- 10 cabeça de ponte A³ e A⁴, quatro átomos selecionados a partir de três a quatro átomos de carbono e zero a um átomo de nitrogênio;
- cada R⁸ é independentemente H, alquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcoxicarbonila C₂-C₇;
 - cada R⁹ e R¹⁰ é independentemente H, alquila C₁-C₄,
- 15 alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, alquicicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹;
- R¹² e R¹⁴ são independentemente H, alquila C₁-C₆, alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcoxicarbonila C₂-C₇;
 - R¹³ e R¹⁵ é independentemente H, alquila C₁-C₄, alquenila
- 20 C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, alquicicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹;
- R¹⁶ é halogênio, haloalquila C₁-C₆, dialquilamino C₂-C₄,
- 25 ciano ou nitro;
- cada R¹⁹ é selecionado independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₄, ciano, nitro e

Q¹;

- cada Q¹ é selecionado independentemente a partir de fenila, piridinila e tiazolila, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de halogênio,

5 alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, ciano, fenila e piridinila; e

- n é 1 ou 2.

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

- R¹ é alquila C₁-C₃ substituído com halogênio.

4. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 3, em que:

10 - Q é um heterociclo insaturado com cinco membros selecionado a partir de pirazolila, triazolila e imidazolila, em que cada heterociclo é ligado ao restante da Fórmula 1 por meio de nitrogênio e opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, 15 alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, ciano, nitro, C(O)NR⁸R⁹ e C(O)OR¹⁰; ou Q é C(O)NR¹²R¹³;

- R¹ é CF₃;

20 - R⁶ e R⁷ são selecionados independentemente a partir de H, halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, ciano e nitro; ou R⁶ e R⁷ são tomados em conjunto para formar um anel aromático fundido, em que o anel aromático fundido contém quatro átomos de carbono como membros de anéis além dos átomos de cabeça de ponte A³ e A⁴;

- R⁸ é H;

25 - cada R⁹ e R¹⁰ é independentemente alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de halogênio, alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, ciano e, no máximo, um Q¹; e

- cada R¹² e R¹⁴ é independentemente H;

- cada R¹³ e R¹⁵ é independentemente H; ou alquila C₁-C₄ opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados a partir de R¹⁹; e

5 - cada R¹⁹ é selecionado independentemente a partir de halogênio e Q¹.

5. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 4, em que R³ é metila, etila ou CH₂CF₃.

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

10 - 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]-2-metil-N-(2-piridinilmelil)benzamida;

- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]-N-(2,2,2-trifluoroetil)benzamida;

15 - 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-(2,2,2-trifluoroetil)-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]-N-(2-piridinilmelil)benzamida; e

- 1-[4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-di-hidro-1-metil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-3-il]fenil]-1H-1,2,4-triazol.

20 7. COMPOSIÇÃO, que compreende um composto de acordo com 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 compreende ainda opcionalmente pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional.

25 8. COMPOSIÇÃO DE CONTROLE, de pragas invertebradas que compreende uma quantidade biologicamente eficaz de um composto de acordo com 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 compreende ainda opcionalmente uma quantidade biologicamente eficaz de pelo menos um

agente ou composto biologicamente ativo adicional.

9. COMPOSIÇÃO, de acordo com a reivindicação 8, em que pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é um inseticida selecionado a partir do grupo que consiste de lactonas macrocíclicas, 5 neonicotinóides, ligantes receptores de octopamina, ligantes receptores de rianodina, agonistas de ecdisona, moduladores de canais de sódio, inibidores da síntese de chitina, análogos de nereisotoxina, inibidores do transporte de elétrons mitocôndricos, inibidores da colinesterase, inseticidas de ciclodieno, inibidores de exúvio, bloqueadores de canais de cloreto regulados por ácido γ -aminobutírico, imitadores de hormônios juvenis, inibidores da biossíntese de lipídios e agentes biológicos que incluem nucleopoliedrovírus, membros de *Bacillus thuringiensis*, delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* e outros vírus inseticidas de ocorrência natural ou geneticamente modificados.

10. COMPOSIÇÃO, de acordo com a reivindicação 8, em que o pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é selecionado a partir do grupo que consiste de abamectina, acefato, acetamiprid, acetoprol, aldicarb, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfós-metil, bifentrina, bifenazato, bistrifluron, buprofezina, carbofuran, cartap, chinometionat, clorfenapir, clorfluazuron, clorantraniliprol, 15 clorpirimifós, clorpirimifós-metil, clorobenzilato, cromafenozida, clotianidina, cflumetofen, cflutrina, beta-cflutrina, cialotrina, gama-cialotrina, lambda-cialotrina, cihexatrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafenturon, diazinon, dicofol, dieldrina, dienoclor, diflubenzuron, dimeflutrina, dimetoato, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvarelato, etiprol, 20 etoxazol, fenamifós, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvarelato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim, flufenoxuron, fonofós, halofenozida, hexaflumuron, hexitiazox, hidrametilnon, imiciafós, imidacloprid, indoxacarb,

isofenfós, lufenuron, malation, metaflumizona, metaldeído, metamidofós, metidation, metomil, metoprene, metoxiclor, metoxifenozida, metoflutrina, monocrotofós, nitenpiram, nitiazina, novaluron, noviflumuron, oxamil, paration, paration-metil, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb,
5 profenofós, proflutrina, propargita, protrifenbute, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridaben, piridalil, pirifluquinazon, piriprol, piriproxifen, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiridiclofen, espiromesifen, espirotetramat, sulprofós, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzuron, teflutrina, terbufós, tetraclorvinfós, tiacloprid, tiametoxam, tiocarb, tiosultap-sódio,
10 tolfenpirad, tralométrina, triazamato, triclorfon, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopoliedrovírus, delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*, bacilovírus, bactérias entomopatogênicas, vírus entomopatogênicos e fungos entomopatogênicos.

11. COMPOSIÇÃO, de acordo com a reivindicação 10, em que
15 o pelo menos um agente ou composto biologicamente ativo adicional é selecionado a partir do grupo que consiste de abamectina, acetamiprid, amitraz, avermectina, azadiractina, bifentrina, buprofezina, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifós, clotianidina, cifultrina, beta-cifultrina, cialotrina, lambda-cialotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina,
20 dinotefuran, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvarelato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvarelato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flufenoxuron, hexaflumuron, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizona, metomil, metoprene, metoxifenozida, nitenpiram, nitiazina, novaluron, oxamil, pimetrozina, piretrina, piridaben, piridalil, piriproxifen,
25 rianodina, espinetoram, espinosad, espiridiclofen, espiromesifen, tebufenozida, tiacloprid, tiametoxam, tiocarb, tiosultap-sódio, tralométrina, triazamato, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopoliedrovírus e delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus*

thuringiensis.

12. COMPOSIÇÃO, de acordo com a reivindicação 8, na forma de formulação líquida para encharcamento de solo.

13. COMPOSIÇÃO DE PULVERIZAÇÃO, para controle de
5 pragas invertebradas, que compreende:

(a) uma quantidade biologicamente eficaz do composto de acordo com a reivindicação 1 ou da composição de acordo com a reivindicação 8; e

(b) um propelente.

10 14. COMPOSIÇÃO DE ISCA, para controle de pragas invertebradas, que compreende:

(a) uma quantidade biologicamente eficaz do composto de acordo com a reivindicação 1 ou da composição de acordo com a reivindicação 8;

15 (b) um ou mais materiais alimentícios;

(c) opcionalmente um atrativo; e

(d) opcionalmente um umectante.

15. DISPOSITIVO DE ARMADILHA, para controle de pragas invertebradas, que compreende:

20 (a) a composição de isca de acordo com a reivindicação 14; 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 um local de atividade conhecida ou potencial da praga invertebrada ou perto dele.

25 16. MÉTODO DE CONTROLE, de pragas invertebradas, que

compreende o contato da praga invertebrada ou seu ambiente com uma quantidade biologicamente eficaz de um composto de acordo com a reivindicação 1.

17. MÉTODO DE CONTROLE, de pragas invertebradas, que
5 comprehende o contato da praga invertebrada ou seu ambiente com uma composição de acordo com a reivindicação 8.

18. MÉTODO, de acordo com a reivindicação 17, em que o ambiente é solo e a composição é aplicada ao solo na forma de formulação de encharcamento do solo.

10 19. MÉTODO DE CONTROLE, de baratas, formigas ou cupins, que comprehende o contato da barata, formiga ou cupim com a composição de isca em um dispositivo de armadilha de acordo com a reivindicação 15.

20. MÉTODO DE CONTROLE, de mosquitos, moscas pretas, moscas dos estábulos, moscas dos cervos, moscas dos cavalos, vespas, 15 vespas americanas, vespões, carrapatos, aranhas, formigas ou mosquitos que comprehende 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 de acordo com a reivindicação 13 liberada a partir de um 20 recipiente de pulverização.

21. MÉTODO DE PROTEÇÃO, de sementes contra pragas invertebradas, que comprehende o contato da semente com uma quantidade biologicamente eficaz de um composto de acordo com a reivindicação 1.

22. MÉTODO, de acordo com a reivindicação 21, em que a 25 semente é revestida com o composto de acordo com a reivindicação 1 formulado como uma composição que comprehende um formador de filme ou agente adesivo.

23. SEMENTE TRATADA, que comprehende um composto de

acordo com a reivindicação 1 em uma quantidade de cerca de 0,0001 a 1% em peso da semente antes do tratamento.

24. COMPOSIÇÃO DE PROTEÇÃO, de animais contra pragas parasitas invertebradas, que compreende uma quantidade eficaz como parasiticida de um composto de acordo com a reivindicação 1 e pelo menos um veículo.

25. COMPOSIÇÃO, de acordo com a reivindicação 24 em uma forma para administração oral.

26. MÉTODO DE PROTEÇÃO, de animais contra pragas parasitas invertebradas que compreende a administração ao animal de uma quantidade eficaz como parasiticida de um composto de acordo com a reivindicação 1.

RESUMO**"COMPOSTO, COMPOSIÇÃO, COMPOSIÇÃO DE CONTROLE, DE
PULVERIZAÇÃO, DE ISCA, DISPOSITIVO DE ARMADILHA, MÉTODOS DE
CONTROLE, MÉTODOS DE PROTEÇÃO, SEMENTE TRATADA,
COMPOSIÇÃO DE PROTEÇÃO"**

5

São descritos compostos da Fórmula 1, incluindo todos os seus isômeros geométricos e estereoisômeros, N-óxidos e sais, em que Z é N ou CR²; R¹ é ciano; ou alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇ ou cicloalquilalquila C₄-C₇, cada qual 10 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹⁷; R³ é H, ciano ou -CHO; ou alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, alquilcicloalquila C₄-C₇, cicloalquilalquila C₄-C₇, fenila, alquilcarbonila C₂-C₆, alcoxcarbonila C₂-C₆, 15 alquilaminocarbonila C₂-C₆ ou dialquilaminocarbonila C₃-C₉, cada qual opcionalmente substituído com um ou mais substituintes selecionados independentemente a partir de R¹⁸; Q é um heterociclo saturado ou insaturado com cinco ou seis membros opcionalmente substituído; ou Q é C(O)NR¹²R¹³, C(S)NR¹²R¹³, S(O)₂NR¹⁴R¹⁵ ou R¹⁶; e R², R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, A¹, 20 A², A³, A⁴ e n são conforme definido no relatório descritivo. Também são descritas composições que contêm os compostos da Fórmula 1 e métodos de controle de pragas invertebradas que compreendem o contato da praga invertebrada ou seu ambiente com uma quantidade biologicamente eficaz de um composto ou composição de acordo com a presente invenção.