



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

(11) PI 0810936-2 B1

(22) Data do Depósito: 20/06/2008

(45) Data de Concessão: 13/03/2018



(54) Título: COMPOSTO, MÉTODO PARA CONTROLE DE UMA PRAGA INVERTEBRADA E USO DE UM COMPOSTO DE FÓRMULA 1

(51) Int.Cl.: C07D 261/04; A01N 43/80

(30) Prioridade Unionista: 26/06/2007 US 60/937,285

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

(72) Inventor(es): GEORGE PHILIP LAHM; JEFFREY KEITH LONG; MING XU

**“COMPOSTO, MÉTODO PARA CONTROLE DE UMA PRAGA
INVERTEBRADA E USO DE UM COMPOSTO DE FÓRMULA 1”**

CAMPO DA INVENÇÃO

[001] A presente invenção diz respeito a certas isoxazolininas e suas composições adequadas para uso agronômico, não agronômico e saúde animal, métodos de seu uso para controle de pragas invertebradas tais como artrópodes, tanto em meio ambiente agronômico quanto não agronômico, e para tratamento de infecções de parasita em animais ou infestações no ambiente geral.

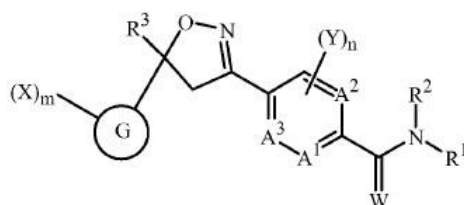
ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

[002] O controle de pragas invertebradas é extremamente importante na obtenção de alta eficiência em plantações. Danos por pragas invertebradas em plantações agronômicas em crescimento e armazenadas podem causar redução significativa na produtividade e resultar, dessa forma, em maiores custos para o consumidor. O controle de pragas invertebradas em silvicultura, plantas de estufa, plantas ornamentais, sementeiras, fibra e produtos alimentícios armazenados, animais de fazenda, domésticos, produtos de grama, madeira, e saúde pública é também importante. Muitos produtos estão disponíveis comercialmente com estes propósitos, mas continua a necessidade de compostos inéditos que sejam mais efetivos, mais baratos, menos tóxicos, ambientalmente mais seguros ou tenham diferentes sítios de ação.

[003] O controle de parasitas em saúde animal é essencial, especialmente nas áreas de produção alimentícia e animais de companhia.

[004] Os métodos de tratamento e controle de parasitas existentes estão sendo comprometidos por causa do aumento da resistência a muitos parasiticidas comerciais atuais. A descoberta de meios mais efetivos para controlar parasitas de animais é, portanto, imperativa.

[005] A publicação de patente PCT WO 05/0852 16 revela derivados de isoxazolina da Fórmula I como inseticidas



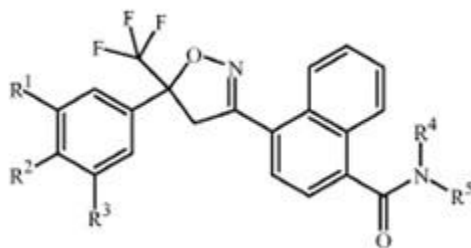
I

em que, *inter alia*, cada um de 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.

[006] As isoxazolininas da presente invenção não são reveladas nesta publicação.

DESCRIÇÃO RESUMIDA DA INVENÇÃO

[007] A presente invenção diz respeito a compostos da Fórmula 1 (incluindo todos os estereoisômeros), e composições contendo-os e seu uso para controle de pragas invertebradas:



1

onde:

R¹ é halogênio, haloalquila C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂;

R² é H, halogênio ou ciano;

R³ é H, halogênio ou CF₃;

R⁴ é H, alquilcarbonila C₂-C₇ ou alcoxicarbonila C₂-C₇; e

R⁵ é alquila C₁-C₆ ou haloalquila C₁-C₆, cada qual substituído com um substituinte independentemente selecionado de hidróxi, alcóxi C₁-C₆,

alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₇, dialquilaminocarbonila C₃-C₉, haloalquilaminocarbonila C₂-C₇ e halodialquilaminocarbonila C₃-C₉.

[008] A presente invenção também diz respeito a tais compostos da Fórmula 1 (incluindo todos os estereoisômeros) e composições contendo-os e seu uso para controle de pragas invertebradas da maneira descrita anteriormente, e adicionalmente aqui, desde que quando R¹ e R³ forem Cl, e R² e R⁴ forem H, então R⁵ é diferente de CH₂C(O)NHCH₂CF₃, CH₂CH₂OH ou CH₂CH₂OCH₃.

[009] A presente invenção também diz respeito a uma composição compreendendo um composto da Fórmula 1 e, pelo menos, um componente adicional selecionado do grupo que consiste em agentes tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos. Em uma modalidade, esta invenção também diz respeito a uma composição para controlar pragas invertebradas compreendendo um composto da Fórmula 1 (isto é, em uma quantidade biologicamente efetiva) e pelo menos um componente adicional selecionado do grupo que consiste em agentes tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos, a dita composição compreendendo ainda, opcionalmente, pelo menos um composto biologicamente ativo ou agente (isto é, em uma quantidade biologicamente efetiva).

[0010] A presente invenção diz respeito adicionalmente a uma composição de aspersão para controlar pragas invertebradas compreendendo um composto da Fórmula 1 (em uma quantidade biologicamente efetiva) ou a composição supradescrita, e um propelente. Esta invenção também diz respeito a uma composição de isca para controlar pragas invertebradas compreendendo um composto da Fórmula 1 (isto é, uma quantidade biologicamente efetiva), ou as composições descritas nas modalidades acima, um ou mais materiais alimentícios, opcionalmente um agente de atração, e

opcionalmente um umectante.

[0011] A presente invenção diz respeito adicionalmente a um dispositivo de armadilha para controlar pragas invertebradas compreendendo a dita composição de isca e um alojamento adaptado para receber a dita composição de isca, em que o alojamento tenha, pelo menos, uma abertura dimensionada para permitir que as pragas invertebradas passem pela abertura, de forma que as mesmas possam ter acesso à dita composição de isca a partir de um local fora do alojamento, e em que o alojamento é adicionalmente adaptado para ser colocado em um local de atividade potencial ou conhecida das pragas invertebradas, ou próximo a ele.

[0012] A presente invenção diz respeito a um método para controle de pragas invertebradas compreendendo colocar em contato as pragas invertebradas ou seu ambiente com uma quantidade biologicamente efetiva de um composto da Fórmula 1, (por exemplo, como uma composição aqui descrita).

[0013] A presente invenção também diz respeito a tal método em que as pragas invertebradas ou seu ambiente são colocados em contato com uma composição compreendendo uma quantidade biologicamente efetiva de um composto da Fórmula 1 e ,pelo menos, um componente adicional selecionado do grupo que consiste em agentes tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos, a dita composição compreendendo ainda, mais opcionalmente, uma quantidade biologicamente efetiva de pelo menos um composto ou agente biologicamente ativo adicional.

[0014] A presente invenção também diz respeito a um método para proteger uma semente de pragas invertebradas compreendendo colocar em contato a semente com uma quantidade biologicamente efetiva de um composto da Fórmula 1, (por exemplo, como uma composição aqui descrita). Esta invenção também diz respeito à semente tratada.

[0015] A presente invenção diz respeito adicionalmente a um método para tratar, prevenir, inibir e/ou matar ecto e/ou endoparasitas compreendendo administrar ao animal uma quantidade parasiticida efetiva de um composto da Fórmula 1 (por exemplo, como uma composição aqui descrita). A presente invenção também diz respeito a tal método em que uma quantidade parasiticida efetiva de um composto da Fórmula 1 (por exemplo, como uma composição aqui descrita) é administrada ao ambiente (por exemplo, um estábulo ou cobertura) no qual um animal reside.

DESCRIÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO

[0016] Da maneira aqui usada, os termos "compreende", "compreendendo", "inclui", "incluindo", "tem", "tendo", "contém" ou "contendo", ou qualquer outra variação destes, devem cobrir uma inclusão não exclusiva. Por exemplo, uma composição, uma mistura, processo, método, artigo ou aparelho que compreenda uma lista de elementos não é necessariamente limitado apenas aos elementos, mas pode incluir outros elementos não listados expressamente ou inerentes a tal composição, mistura, processo, método, artigo ou aparelho. Adicionalmente, a menos que expressamente declarado ao contrário, "ou" refere-se a um ou inclusivo e não a um ou exclusivo. Por exemplo, uma condição A ou B é satisfeita por qualquer um do seguinte: A é verdadeiro (ou presente) e B é falso (ou não presente), A é falso (ou não presente) e B é verdadeiro (ou presente), e tanto A quanto B forem verdadeiros (ou estiverem presentes).

[0017] Também, os artigos indefinidos "um" e "uma" que precedem um elemento ou componente da invenção não devem ser restritivos com relação ao número de casos (isto é, ocorrências) do elemento ou componente. Portanto "um" ou "uma" deve ser lido de forma a incluir um ou pelo menos uma, e a forma da palavra singular do elemento ou componente também inclui o plural, a menos que o número obviamente queira dizer no

singular.

[0018] Conforme referido nesta revelação, o termo "praga invertebradas" inclui artrópodes, gastrópodes e nemátodes de importância econômica como pragas. O termo "artrópode" inclui insetos, acarinos, aranhas, escorpiões, centopéias, diplóides, tatuzinhos e sinfilas. O termo "gastrópode" inclui caracóis, lesmas e outros representantes Stylommatophora. O termo "nemátode" inclui todos os helmintos, tais como nematelmintos, filarídeos e fitófagos nemátodes (Nematoda), vermes trematóides (Tematoda), Acanthocephala e tênias (Cestoda).

[0019] No contexto desta revelação "controle de pragas invertebradas" significa inibição do desenvolvimento de pragas invertebradas (incluindo mortalidade, redução de alimentação e/ou cessação de acasalamento), e expressões relacionadas são definidas analogamente.

[0020] O termo "agronômico" refere-se à produção de plantações de campo tais como para alimento e fibra e inclui o crescimento de milho, soja e outros legumes, arroz, cereal (por exemplo, trigo, aveia, cevada, centeio, arroz, milho), vegetais folhosos (por exemplo, alface, repolho e outras plantações de coleóptilos), vegetais frutíferos (por exemplo, tomates, pimenta, beringela, crucíferas e curcubitáceas), batatas, batatas doces, uvas, algodão, frutas em árvore (por exemplo, romã, de caroço e cítricos), pequenas frutas (morangos, cerejas) e plantações de outras especialidades (por exemplo, canola, girassol, olivas).

[0021] O termo "não agrônômico" refere-se a aplicações sem ser plantações em campo, tais como plantações de horticultura (por exemplo, plantas de estufa, sementeira ou ornamentais que não crescem em um campo), estruturas residenciais, agrícolas, comerciais e industriais, grama (por exemplo, fazenda de grama, pastagem, campo de golfe, gramado, campo de esporte, etc.), produtos de madeira, produto armazenado, controle de

agrofloresta e vegetação, saúde pública (isto é, humano) e aplicação em saúde animal (por exemplo, animais domesticados tais como animais de estimação, animais de fazenda e aves domésticas, animais não domesticados tais como animais selvagens).

[0022] Aplicações não agronômicas incluem proteger um animal de uma praga parasítica invertebrada administrando-se uma quantidade parasiticida efetiva (isto é, biologicamente efetiva) de um composto da invenção, tipicamente na forma de uma composição formulada para uso veterinário, no animal a ser protegido. Da maneira referida na presente revelação e reivindicações, o termo "parasiticida" refere-se a efeitos observáveis em uma praga parasítica invertebrada para fornecer proteção a um animal contra a praga. Efeitos parasiticidas tipicamente dizem respeito a diminuir a ocorrência ou atividade da praga parasítica invertebrada-alvo. Tais efeitos na praga incluem necrose, morte, crescimento retardado, menor mobilidade ou menor capacidade de permanecer no animal hospedeiro, alimentação reduzida e inibição de reprodução. Estes efeitos na praga parasita invertebrada permitem o controle (incluindo prevenção, redução ou eliminação) de infestação ou infecção parasítica do animal.

[0023] Uma "infestação" de parasita refere-se à presença de parasitas em números que apresentam um risco a humanos ou animais. A infestação pode ser no ambiente (por exemplo, em alojamento de humanos ou animais, roupa de cama, e propriedade ou estruturas ao redor), nas plantações agrícolas ou outros tipos de plantas, ou na pele ou pelo de um animal. Quando a infestação é em um animal (por exemplo, no sangue ou outros tecidos internos), o termo infestação deve também ser sinônimo do termo "infecção", uma vez que o termo é no geral assim entendido na tecnologia, a menos que de outra forma declarada.

[0024] Nas citações anteriores, o termo "alquila", usado tanto

sozinho quanto nas palavras compostas tais como "alquiltio" ou "haloalquila", inclui alquila de cadeia reta ou ramificada, tais como metila, etila, *n*-propila, *i*-propila, ou os diferentes isômeros de butila, pentila ou hexila. "Alquenila" inclui alcenos de cadeia reta ou ramificada tais como etenila, 1-propenila, 2-propenila, e os diferentes isômeros de butenila, pentenila e hexenila.

[0025] "Alcóxi" inclui, por exemplo, isômeros de metóxi, etóxi, *n*-propilóxi, isopropilóxi e os diferentes butóxi, pentóxi e hexilóxi. "Alquiltio" inclui frações de alquiltio de cadeia reta ou ramificada tais como metiltio, etiltio, e os diferentes isômeros de propiltio, butiltio, pentiltio e hexiltio. "Alquilsulfinila" inclui ambos enantiômeros de um grupo alquilsulfinila. Exemplos de "alquilsulfinila" incluem $S(O)CH_3$, $S(O)CH_2CH_3$, $S(O)CH_2CH_2CH_3$, $S(O)CH(CH_3)_2$, e os diferentes isômeros butilsulfinila, pentilsulfinila e hexilsulfinila. "Alquilamino" e "dialquilamino" são analogamente definidos com os exemplos anteriores. O termo "halogênio", tanto sozinho quanto em palavras compostas tal como "haloalquila", ou quando usado em descrições tal como "alquila substituído com halogênio" inclui flúor, cloro, bromo ou iodo. Adicionalmente, quando usado em palavras compostas, tais como "haloalquila", ou quando usado em descrições tais como "alquila substituído com halogênio" o dito alquila pode ser parcial ou totalmente substituído com átomos de halogênio que podem ser os mesmos ou diferentes. Exemplos de "haloalquila" ou "alquila substituído com halogênio" incluem CF_3 , CH_2Cl , CH_2CF_3 e CCl_2CF_3 .

[0026] O termo "haloalcóxi" é definido analogamente ao termo "haloalquila". Exemplos de "haloalcóxi" incluem OCF_3 , OCH_2CCl_3 , $OCH_2CH_2CHF_2$ e OCH_2CF_3 .

[0027] "Alquilcarbonila" denota a fração alquila de cadeia reta ou ramificada ligada à fração $C(O)$. As abreviações químicas $C(O)$ e $C(=O)$ da maneira aqui usada representam uma fração carbonila. Exemplos de "alquilcarbonila" incluem $C(O)CH_3$, $C(O)CH_2CH_2CH_3$ e $C(O)CH(CH_3)_2$.

[0028] "Alcoxicarbonila" denota uma fração alquila de cadeia reta ou ramificada ligada a uma fração CO_2 . As abreviações químicas CO_2 e C(=O)O da maneira aqui usada representam uma fração éster. Exemplos de "alcoxicarbonila" incluem CO_2CH_3 , $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ e os diferentes isômeros butóxi ou pentoxicarbonila.

[0029] "Alquilaminocarbonila" denota uma fração alquila de cadeia reta ou ramificada ligada a um fração C(O)NH . As abreviações químicas C(O)NH , C(=O)NH , C(O)N e C(=O)N da maneira aqui usada representam uma fração amida (isto é, um grupo aminocarbonila). Exemplos de "alquilaminocarbonila" incluem C(O)NHCH_3 , $\text{C(O)NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ e $\text{C(O)NHCH}(\text{CH}_3)_2$. "Dialquilamino carbonila" denota duas frações alquila cadeia reta ou ramificada independentes ligadas a uma fração C(O)N . Exemplos de "dialquilaminocarbonila" incluem $\text{C(O)N}(\text{CH}_3)_2$ e $\text{C(O)N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$.

[0030] "Haloalquilaminocarbonila" denota uma fração haloalquila de cadeia reta ou ramificada ligada a uma fração C(O)NH , em que "haloalquila" é da maneira definida anteriormente. Exemplos de "haloalquilaminocarbonila" incluem $\text{C(O)NHCH}_2\text{CF}_3$ e $\text{C(O)NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$. "Halodialquilaminocarbonila" denota uma fração alquila de cadeia reta ou ramificada e uma fração haloalquila de cadeia reta ou ramificada ligada a uma fração C(O)N , ou duas frações haloalquila de cadeia reta ou ramificada independentes ligadas a uma fração C(O)N , em que "haloalquila" é da maneira definida anteriormente. Exemplos de "halodialquilaminocarbonila" incluem $\text{C(O)N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl})$ e $\text{C(O)N}(\text{CF}_2\text{CF}_3)_2$. Exemplos de "alquila C_2 substituído com alquilaminocarbonila C_1 " incluem $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C(O)NHCH}_3$ e $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C(O)NHCH}_3$.

[0031] Quando R^5 é alquila $\text{C}_1\text{-C}_6$ ou haloalquila $\text{C}_1\text{-C}_6$, cada qual adicionalmente substituído com um grupo da maneira definida no Sumário da Invenção, o átomo de carbono através do qual o dito grupo alquila ou

haloalquila é ligado ao restante da Fórmula 1 é projetado na posição 1. Um exemplo de um grupo alquila C₂ substituído com um grupo haloalquilaminocarbonila C₃ anexado na posição 1 do grupo alquila C₂ é *CH(CH₃)C(O)NHCH₂CF₃, em que o asterisco denota a posição 1.

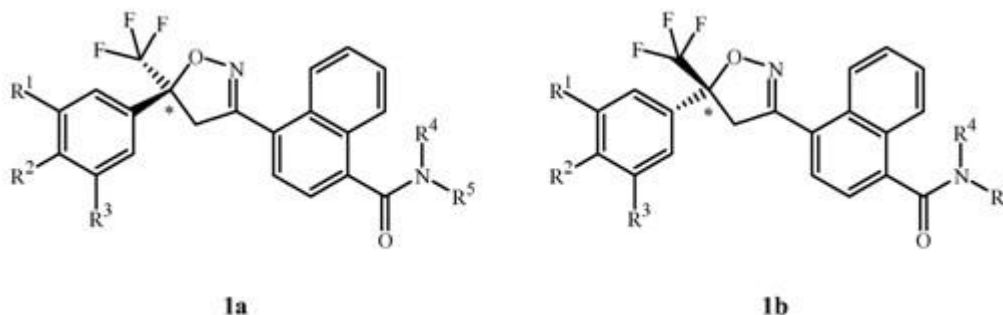
[0032] O número total de átomos de carbono em um grupo substituinte é indicado pelo prefixo "Ci-Cj" onde i e j são números de 1 a 9. Por exemplo, alquilsulfonila C₁-C₆ designa metilsulfonila através de hexilsulfonila.

[0033] Quando um grupo contém um substituinte que pode ser hidrogênio, por exemplo, R⁴, então quando este substituinte é tomado como hidrogênio, observa-se que isto é equivalente ao dito grupo sendo insubstituído.

[0034] Uma ampla variedade de métodos sintéticos é conhecida na tecnologia para permitir a preparação de anéis heterocíclicos aromáticos e não aromáticos e sistemas anel; para revisões extensivas ver o grupo do volume oito de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 e o grupo do volume doze de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

[0035] Compostos desta invenção podem existir como um ou mais estereoisômeros. Os vários estereoisômeros incluem enantiômeros, diaestereômeros e atropisômeros. Versados na tecnologia perceberão que um estereoisômero pode ser mais ativo e/ou pode exibir efeitos benéficos quando enriquecidos com relação a(s) outro(s) estereoisômero(s) ou quando separados do(s) outro(s) estereoisômero(s). Adicionalmente, os versados na tecnologia sabem agora separar, enriquecer e/ou preparar seletivamente os ditos estereoisômeros. Os compostos da invenção podem estar presentes como uma mistura de estereoisômeros, estereoisômeros individuais ou como uma forma opticamente ativa. Por exemplo, dois possíveis enantiômeros da Fórmula

1 são descritos como Fórmula **1a** e Fórmula **1b** envolvendo o centro quiral de isoxazolina identificado com um asterisco (*). Analogamente, outros centros quirais são possíveis, por exemplo, em R⁵.



[0036] Representações moleculares aqui desenhadas seguem convenções padrões para representar estereoquímica. Para indicar estereoconfiguração, ligações que surgem do plano dos desenhos e na direção de quem olha são denotados por setas cheias em que as pontas de trás da seta são anexadas ao átomo que surge do plano do desenho na direção de quem olha. Ligações que vão abaixo do plano do desenho e para for a de quem olha são denotadas por setas tracejadas em que a ponta fina da seta é anexada ao átomo anda mais afastada de quem olha. Linhas largas constantes indicam ligações com uma direção oposta ou neutra com relação a ligações mostradas com setas cheias ou tracejadas; linhas largas constantes também representam ligações em moléculas ou partes de moléculas no qual nenhuma estereoconfiguração particular deve ser especificada.

[0037] Acredita-se que o enantiômero mais biologicamente ativo seja Fórmula **1a**. A Fórmula **1a** tem a configuração (S) no carbono quiral e Fórmula **1b** tem a configuração (R) no carbono quiral.

[0038] Esta invenção compreende misturas racêmicas, por exemplo, quantidades iguais dos enantiômeros de Fórmulas **1a** e **1b**. Além do mais, esta invenção inclui compostos que são enriquecidos comparados com a mistura racêmica em um enantiômero da Fórmula **1**. São também incluídos os

enantiômeros essencialmente puros dos compostos da Fórmula 1, por exemplo, Fórmula **1a** e Fórmula **1b**.

[0039] Quando enantiomericamente enriquecido, um enantiômero está presente em maiores quantidades do que o outro e a extensão de enriquecimento pode ser definida por uma expressão de excesso enantiomérico ("ee"), que é definido como $(2x - 1) \cdot 100\%$, onde x é a razão molar do enantiômero dominante na mistura (por exemplo, um ee de 20% corresponde a um razão de enantiômeros 60:40).

[0040] Preferivelmente as composições desta invenção têm pelo menos um excesso enantiomérico de 50%; mais preferivelmente pelo menos um excesso enantiomérico de 75%; ainda mais preferivelmente pelo menos um excesso enantiomérico de 90%; e acima de tudo preferivelmente pelo menos um excesso enantiomérico de 94% do isômero mais ativo. De nota particular são modalidades enantiomericamente puras do isômero mais ativo.

[0041] Compostos da Fórmula 1 podem compreender centros quirais adicionais. Por exemplo, substituintes e outros constituintes moleculares tais como R^5 podem conter entre si centros quirais. Enantiômeros mais biologicamente ativos de compostos em que R^5 contém a fração $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{O})\text{N}$ (por exemplo, compostos 94 e 106 da Tabela A de Índice) acredita-se que contenham a configuração (*R*) no carbono quiral. Esta invenção compreende misturas racêmicas bem como estereoconfigurações enriquecidas e essencialmente puras nestes centros quirais adicionais.

[0042] Compostos desta invenção podem existir como um ou mais isômeros conformacionais por causa da rotação restrita em torno do ligante de ligação de amida na Fórmula 1. Esta invenção compreende misturas de isômeros conformacionais. Além disso, esta invenção inclui compostos que são enriquecidos em um conformero com relação a outros.

[0043] Compostos desta invenção podem existir como um ou

mais polimorfos cristalinos. Esta invenção compreende tanto polimorfos individuais quanto misturas de polimorfos, incluindo misturas enriquecidas em um polimorfo com relação a outro.

[0044] As modalidades da presente invenção, como descritas no Sumário da Invenção, incluem as descritas abaixo. Nas seguintes modalidades, a referência a “compostos da Fórmula 1” inclui as definições de substituintes específicos no Sumário da Invenção, exceto quando melhor definido nas modalidades.

[0045] Modalidade 1. Um composto da Fórmula 1 em que quando R^1 e R^3 forem Cl, e R^2 e R^4 forem H, então R^5 é outro sem ser $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CF}_3$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ ou $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$.

[0046] Modalidade 2. Um composto da Fórmula 1 em que R^1 é Cl, Br ou CF_3 .

[0047] Modalidade 3. Um composto da Modalidade 2 em que R^1 é Cl.

[0048] Modalidade 4. Um composto da Modalidade 2 em que R^1 é Br.

[0049] Modalidade 5. Um composto da Modalidade 2 em que R^1 é CF_3 .

[0050] Modalidade 6. Um composto da Fórmula 1 em que R^2 é H, F ou Cl.

[0051] Modalidade 7. Um composto da Modalidade 6 em que R^2 é H.

[0052] Modalidade 8. Um composto da Modalidade 6 em que R^2 é F.

[0053] Modalidade 9. Um composto da Modalidade 6 em que R^2 é Cl.

[0054] Modalidade 10. Um composto da Fórmula 1 em que R^3 é

H, Cl, Br ou CF₃.

[0055] Modalidade 11. Um composto da Modalidade 10 em que R³ é H.

[0056] Modalidade 12. Um composto da Modalidade 10 em que R³ é Cl.

[0057] Modalidade 13. Um composto da Modalidade 10 em que R³ é Br.

[0058] Modalidade 14. Um composto da Modalidade 10 em que R³ é CF₃.

[0059] Modalidade 15. Um composto da Fórmula 1 em que R⁴ é H.

[0060] Modalidade 16. Um composto da Fórmula 1 em que R⁵ é alquila C₁-C₆ ou haloalquila C₁-C₆, cada qual substituído com um hidróxi ou alcóxi C₁-C₆.

[0061] Modalidade 17. Um composto da Fórmula 1 em que R⁵ é alquila C₁-C₆ ou haloalquila C₁-C₆, cada qual substituído com um alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆ ou alquilsulfonila C₁-C₆.

[0062] Modalidade 18. Um composto da Fórmula 1 em que R⁵ é alquila C₁-C₆ ou haloalquila C₁-C₆, cada qual substituído com um alquilaminocarbonila C₂-C₇, dialquilaminocarbonila C₃-C₉, haloalquilaminocarbonila C₂-C₇ ou halodialquilaminocarbonila C₃-C₉.

[0063] Modalidade 19. Um composto da Modalidade 18 em que R⁵ é alquila C₁-C₆ substituído com haloalquilaminocarbonila C₂-C₇.

[0064] Modalidade 20. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1 em que R¹ é F, Br, I, haloalquila C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂.

[0065] Modalidade 21. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1 em que R¹ é halogênio.

[0066] Modalidade 22. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade

1 em que R¹ é haloalquila C₁-C₂.

[0067] Modalidade 23. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade em que R¹ é haloalcóxi C₁-C₂.

[0068] Modalidade 24. Um composto da Modalidade 23 em que R¹ é OCF₃.

[0069] Modalidade 25. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1 em que R² é halogênio.

[0070] Modalidade 26. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1 em que R² é ciano.

[0071] Modalidade 27. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1 em que R² é H ou F.

[0072] Modalidade 28. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1 em que R³ é halogênio

[0073] Modalidade 29. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1 em que R³ é H, F, Cl, Br ou CF₃.

[0074] Modalidade 30. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1 em que R³ é Cl, Br ou CF₃.

[0075] Modalidade 31. Um composto da Modalidade 28 em que R³ é F.

[0076] Modalidade 32. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1 em que R⁴ é alquilcarbonila C₂-C₇.

[0077] Modalidade 33. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1 em que R⁴ é alcoxicarbonila C₂-C₇.

[0078] Modalidade 34. Um composto da Modalidade 32 em que R⁴ é C(O)Me.

[0079] Modalidade 35. Um composto da Modalidade 33 em que R⁴ é CO₂Me.

[0080] Modalidade 36. Um composto da Modalidade 33 em que

R⁴ é CO₂(*t*-Bu).

[0081] Modalidade 37. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1 em que R⁵ é alquila C₁-C₆ substituído com um substituinte independentemente selecionado de alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinila C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₇ e haloalquilaminocarbonila C₂-C₇.

[0082] Modalidade 38. Um composto da Modalidade 37 em que R⁵ é alquila C₁-C₄ substituído com um alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄ ou alquilsulfonila C₁-C₄.

[0083] Modalidade 39. Um composto da Modalidade 38 em que R⁵ é alquila C₂-C₃ substituído com um alquiltio C₁-C₂, alquilsulfinila C₁-C₂ ou alquilsulfonila C₁-C₂.

[0084] Modalidade 40. Um composto da Modalidade 39 em que R⁵ é CH₂CH₂SCH₃, CH₂CH₂S(O)CH₃ ou CH₂CH₂SO₂CH₃.

[0085] Modalidade 41. Um composto da Modalidade 37 em que R⁵ é alquila C₁-C₆ substituído com um alquilaminocarbonila C₂-C₇ ou haloalquilaminocarbonila C₃-C₇.

[0086] Modalidade 42. Um composto da Modalidade 41 em que o substituinte alquilaminocarbonila C₂-C₇ ou haloalquilaminocarbonila C₃-C₇ é anexado ao grupo alquila C₁-C₆ na posição 1.

[0087] Modalidade 43. Um composto da Modalidade 42 em que R⁵ é alquila C₁-C₄ substituído com alquilaminocarbonila C₂-C₄.

[0088] Modalidade 44. Um composto da Modalidade 42 em que R⁵ é alquila C₁-C₄ substituído com haloalquilaminocarbonila C₃-C₄.

[0089] Modalidade 45. Um composto da Modalidade 44 em que R⁵ é alquila C₁-C₂ substituído com C(O)NHCH₂CF₃.

[0090] As Modalidades desta invenção, incluindo Modalidades 1 a 45 anteriores bem como quaisquer outras modalidades aqui descritas, podem

ser combinadas de qualquer maneira, e as descrições de variáveis nas modalidades dizem respeito não apenas aos compostos da Fórmula 1 mas também aos compostos de partida e compostos intermediários usados para preparar os compostos da Fórmula 1. Além disso, modalidades desta invenção, incluindo Modalidades 1 a 45 anteriores bem como quaisquer outras modalidades aqui descritas, e qualquer combinação destas, diz respeito às composições e métodos da presente invenção.

[0091] As combinações das Modalidades 1 a 45 são ilustradas por:

Modalidade A. Um composto da Fórmula 1 em que

R^4 é H; e

R^5 é alquila C_1 - C_6 substituído com um haloalquilaminocarbonila C_3 - C_7 ; desde que quando R^1 e R^3 forem Cl, e R^2 e R^4 forem H, então R^5 seja outro sem ser $CH_2C(O)NHCH_2CF_3$, CH_2CH_2OH ou $CH_2CH_2OCH_3$.

Modalidade B. Um composto da Modalidade A em que

R^1 é Cl, Br ou CF_3 ;

R^2 é H, F ou Cl; e

R^3 é H, Cl, Br ou CF_3 .

Modalidade C. Um composto da Modalidade B em que

R^2 é H.

Modalidade D. Um composto da Modalidade C em que

R^1 e R^3 são Cl.

Modalidade E. Um composto da Modalidade C em que

R^1 e R^3 são Br.

Modalidade F. Um composto da Modalidade B em que

R^1 e R^3 são Cl; e

R^2 é F.

Modalidade G. Um composto da Modalidade B em que

R¹, R² e R³ são Cl.

Modalidade H. Um composto da Modalidade C em que

R¹ é CF₃; e

R³ é H.

Modalidade I. Um composto da Modalidade C em que

R¹ e R³ são CF₃.

Modalidade K. Um composto da Fórmula 1 ou Modalidade 1

em que

R⁴ é H; e

R⁵ é alquila C₁-C₆ substituído com um substituinte independentemente selecionado de alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinil C₁-C₆, alquilsulfonila C₁-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₇ e haloalquilaminocarbonila C₂-C₇.

Modalidade L. Uma Modalidade do composto K em que

R¹ é Cl, Br ou CF₃;

R² é H; e

R³ é H, F, Cl, Br ou CF₃.

Modalidade M. Uma Modalidade do composto L em que

R¹ é CF₃.

Modalidade N. Uma Modalidade do composto M em que

R³ é Cl, Br ou CF₃.

Modalidade O. Uma Modalidade do composto N em que R⁵ é alquila C₁-C₆ substituído com um alquilaminocarbonila C₂-C₇ ou haloalquilaminocarbonila C₃-C₇.

[0092] Modalidades específicas incluem compostos da Fórmula 1 selecionados do grupo que consiste em:

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-(2-hidroxietil)-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-(2-

metoxietil)-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-

oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-

[1,1-dimetil-2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-

[(1-metiletil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-

[(2-metilpropil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-

(etilmetilamino)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-

(etilamino)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,

N-[2-[(2-cloroetil)amino]-2-oxoetil]-4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-

5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-

[(2-fluoretil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-

oxo-2-[(2,2,3,3,3-pentafluorpropil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[4,5-diidro-5-(3,4,5-triclorofenil)-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-

[2-(metiltio)etil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-

(metiltio)etil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-

(metilsulfinil)etil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[4,5-diidro-5-(3,4,5-triclorofenil)-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-

[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-

(metilsulfonil)etil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-(3,5-dibromofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-(metiltio)etil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-(3,5-dibromofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[(1*R*)-1-metil-2-(metiltio)etil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[1-metil-3-(metiltio)propil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[3-(metiltio)propil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-[(1,1-dimetiletil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-[(1-etilpropil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[1,1-dimetil-2-(metiltio)etil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[(1*R*)-1-metil-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[4,5-diidro-5-(trifluormetil)-5-[3-(trifluormetil)fenil]-3-isoxazolil]-N-[2-(metiltio)etil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[4,5-diidro-5-(trifluormetil)-5-[3-(trifluormetil)fenil]-3-isoxazolil]-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[4,5-diidro-5-(trifluormetil)-5-[3-(trifluormetil)fenil]-3-isoxazolil]-N-2-(hidroxipropil)-1-naftalenocarboxamida,
4-[(5*S*)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[(1*R*)-1-metil-2-(metiltio)etil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-

isoxazolil]-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida,
 4-[4,5-diidro-5-(trifluormetil)-5-[3-(trifluormetil)fenil]-3-isoxazolil]-N-[2-[(1-metiletil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
 4-[4,5-diidro-5-(trifluormetil)-5-[3-(trifluormetil)fenil]-3-isoxazolil]-N-[2-(metilsulfonil)etil]-1-naftalenocarboxamida,
 4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-[(1-metiletil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
 4-[4,5-diidro-5-(trifluormetil)-5-[3-(trifluormetil)fenil]-3-isoxazolil]-N-(3-hidroxipropil)-1-naftalenocarboxamida, e
 4-[(5S)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida.

[0093] Modalidades específicas adicionais incluem compostos da Fórmula 1 selecionados do grupo que consiste em:

4-[5-[3-cloro-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-(metilsulfonil)etil]-1-naftalenocarboxamida,
 4-[5-[3-bromo-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-(metilsulfonil)etil]-1-naftalenocarboxamida,
 4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-(metilsulfonil)etil]-1-naftalenocarboxamida,
 4-[5-[3-cloro-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-(metilamino)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
 4-[5-[3-cloro-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-(etilamino)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
 4-[5-[3-cloro-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-[(1-metiletil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
 4-[5-[3-cloro-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida,
 4-[5-[3-bromo-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-

isoxazolil]-N-[2-(metilamino)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-[3-bromo-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[2-(etilamino)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-[3-bromo-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[2-[(1-metiletil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-[3-bromo-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[2-(metilamino)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[2-(etilamino)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[2-[(1-metiletil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-[3-cloro-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[1-metil-2-(metilamino)-2-oxoetil]-1 naftalenocarboxamida,
4-[5-[3-cloro-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[-1-naftalenocarboxamida],
4-[5-[3-cloro-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[1-metil-2-[(1-metiletil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-[3-cloro-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[1-metil-2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-
naftalenocarboxamida,
4-[5-[3-bromo-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[1-metil-2-(metilamino)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,
4-[5-[3-bromo-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
[isoxazolil]-N-[2-(etilamino)-1-metil-2-oxoetil]-1 naftalenocarboxamida,

4-[5-[3-bromo-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[1-metil-2-[(1-metiletil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-[3-bromo-5-(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[1-metil-2-oxo-2-[(2,2,2-(trifluormetil)amino)etil]-1-
naftalenocarboxamida,

4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[1-metil-2-(metilamino)-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[2-(etilamino)-1-metil-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,

4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[1-metil-2-[(1-metiletil)amino]-2-oxoetil]-1-naftalenocarboxamida,

e 4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-
isoxazolil]-N-[1-metil-2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino)etil]-1-
naftalenocarboxamida.

[0094] Nota-se que os compostos desta invenção são caracterizados por padrões residuais metabólicos e/ou solo favorável e apresentam atividade de controlar um espectro de pragas invertebradas agronômicas e não agronômicas.

[0095] Modalidades da invenção são de nota particular, por motivos de controle de espectro de pragas invertebradas e importância econômica, proteção de plantações agronômicas de dano ou lesão causado por pragas invertebradas controlando-se as pragas invertebradas. Os compostos desta invenção em virtude de suas propriedades de translocação favoráveis ou sistemicidade em plantas também protegem o sistema foliar ou outras partes da planta que não são diretamente colocadas em contato com um composto da Fórmula 1 ou uma composição compreendendo o composto.

[0096] Vale a pena notar também que as modalidades da presente invenção são composições compreendendo um composto de

quaisquer das Modalidades anteriores, bem como quaisquer outras modalidades aqui descritas, e quaisquer combinações destas e, pelo menos, um componente adicional selecionado do grupo que consiste em um agente tensoativo, um diluente sólido e um diluente líquido, as ditas composições compreendendo ainda, opcionalmente, pelo menos um composto ou agente biologicamente ativo adicional.

[0097] Vale a pena notar ainda que as modalidades da presente invenção são compostos de quaisquer das Modalidades anteriores, (isto é, em uma quantidade biologicamente efetiva) bem como quaisquer outras modalidades aqui descritas, e quaisquer combinações destas, e pelo menos um componente adicional selecionado do grupo que consiste em um agente tensoativo, um diluente sólido e um diluente líquido, as ditas composições compreendendo ainda, opcionalmente, pelo menos um composto ou agente biologicamente ativo adicional.

[0098] Modalidades adicionais da presente invenção incluem:

Modalidade A1. Uma composição para proteger um animal de uma praga parasítica invertebrada compreendendo um composto da Fórmula 1 e pelo menos um veículo veterinariamente aceitável, a dita composição compreendendo ainda opcionalmente pelo menos um composto parasiticida ativo adicional.

Modalidade A2. A composição de Modalidade A1 em que pelo menos um composto parasiticida ativo adicional é um anti-helmíntico.

Modalidade A3. A composição de Modalidade A1 em que, pelo menos, um composto parasiticida ativo adicional é selecionado do grupo que consiste em lactonas macrocíclicas, benzimidazóis, salicilamidas, fenóis substituídos, pirimidinas, depsipeptídeos cíclicos, sais de piperazina, nitroscanato, praziquantel e imidazotiazóis.

Modalidade A4. A composição de Modalidade A3 em que pelo

menos um composto parasiticida ativo adicional é selecionado do grupo que consiste em avermectinas, milbemicinas e espinosinas.

Modalidade A5. A composição de Modalidade A1 em que, pelo menos, um composto parasiticida ativo adicional é selecionado do grupo que consiste em abamectina, doramectina, emamectina, eprinomectina, ivermectina, selamectina, milbemicina, moxidectina e pirantel.

Modalidade A6. A composição de Modalidade A1 em uma forma para administração oral.

Modalidade A7. A composição de Modalidade A1 em uma forma para administração tópica.

Modalidade A8. A composição de Modalidade A1 em uma forma para administração parenteral.

[0099] As modalidades da invenção incluem adicionalmente métodos para controlar pragas invertebradas compreendendo colocar em contato a praga invertebrada – ou seu ambiente – com uma quantidade biologicamente efetiva de um composto de qualquer das Modalidades anteriores (por exemplo, como uma composição aqui descrita). De particular nota é um método para proteger um animal compreendendo administrar ao animal uma quantidade parasiticida efetiva de um composto de qualquer das Modalidades anteriores (por exemplo, como uma composição aqui descrita).

[00100] Modalidades adicionais da presente invenção incluem:

Modalidade B1. O método para proteger um animal de uma praga parasítica invertebrada compreendendo administrar ao animal uma quantidade parasiticida efetiva de um composto da Fórmula 1 da maneira descrita no sumário da invenção.

Modalidade B2. O método da Modalidade B1 desde que, quando o animal for um camundongo, a praga parasítica invertebrada seja uma pulga e a quantidade parasiticida efetiva de um composto da Fórmula 1 seja

administrado oralmente, então o composto da Fórmula 1 seja outro sem ser 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoretil)amino]etil]-1-naftalenocarboxamida.

Modalidade B3. O método da Modalidade B1 em que a quantidade parasiticida efetiva do composto da Fórmula 1 é administrada oralmente.

Modalidade B4. O método da Modalidade B1 em que a quantidade parasiticida efetiva do composto da Fórmula 1 é administrada parenteralmente.

Modalidade B5. O método da Modalidade B1 em que a quantidade parasiticida efetiva do composto da Fórmula 1 é administrada por injeção.

Modalidade B6. O método da Modalidade B1 em que a quantidade parasiticida efetiva do composto da Fórmula 1 é administrada topicamente.

Modalidade B7. O método da Modalidade B 1 em que o animal a ser protegido é um vertebrado.

Modalidade B8. O método da Modalidade B7 em que o animal a ser protegido é um mamífero, ave ou peixe.

Modalidade B9. O método da Modalidade B8 em que o animal a ser protegido é um humano.

Modalidade B10. O método da Modalidade B8 em que o animal a ser protegido é animal de fazenda.

Modalidade B11. O método da Modalidade B8 em que o a ser animal protegido é um canino.

Modalidade B11a. O método da Modalidade B8 em que o animal a ser protegido é um cão.

Modalidade B12. O método da Modalidade B8 em que o animal a

ser em que a protegido é um felino.

Modalidade B12a. O método da Modalidade B8 em que animal a ser protegido é um gato.

Modalidade B13. O método da Modalidade B1 em que a praga parasítica invertebrada é um ectoparasita.

Modalidade B14. O método da Modalidade B1 em que a praga parasítica invertebrada é um endoparasita ou helminto.

Modalidade B15. O método da Modalidade B1 em que a praga parasítica invertebrada é um artrópode.

Modalidade B16. O método da Modalidade B1 em que a praga parasítica invertebrada é uma mosca, mosquito, ácaro, carrapato, piolho, pulga, vareja, percevejo ou conenose.

Modalidade B17. O método da Modalidade B16 em que a praga parasítica invertebrada é um mosquito.

Modalidade B18. O método da Modalidade B16 em que a praga parasítica invertebrada é um carrapato ou ácaro.

Modalidade B19. O método da Modalidade B16 em que a praga parasítica invertebrada é um piolho.

Modalidade B20. O método da Modalidade B16 em que a praga parasítica invertebrada é uma pulga.

Modalidade B21. O método da Modalidade B16 em que a praga parasítica invertebrada é um percevejo ou conenose.

Modalidade B22. O método da Modalidade B16 em que o animal é um gato ou cão e a praga parasítica invertebrada é uma pulga, carrapato ou ácaro.

Modalidade B23. O método da Modalidade B1 em que a quantidade parasiticida efetiva de um composto da Fórmula 1 é administrada mensalmente ou em um intervalo maior.

Modalidade B24. O método da Modalidade B23 em que a quantidade parasiticida efetiva de um composto da Fórmula 1 é administrada uma vez ao mês.

Modalidade B25. O método da Modalidade B23 em que a quantidade parasiticida efetiva de um composto da Fórmula 1 é administrada uma vez a cada seis meses.

[00101] Os compostos da Fórmula 1 ou qualquer das Modalidades 1 a 45 ou Modalidades A-O podem ser usados para a proteção de um animal de uma praga parasítica invertebrada por administração oral, tópica ou parenteral do composto.

[00102] Portanto, a invenção deve incluir os compostos da Fórmula 1 ou qualquer das Modalidades 1 a 45 ou Modalidades A-O (e composições contendo-as) para uso como um medicamento animal, ou mais particularmente um medicamento animal parasiticida.

[00103] Os animais a ser protegidos são da maneira definida em qualquer das Modalidades B7-B 12a. A praga parasítica invertebrada é da maneira definida em qualquer das Modalidades B13 -B21. O medicamento pode ser nas formas de dosagem oral, tópica ou parenteral.

[00104] A invenção deve também incluir o uso de compostos da Fórmula 1 ou qualquer das Modalidades 1 a 45 ou Modalidades A-O na fabricação de medicamentos para a proteção de um animal de uma praga parasítica invertebrada. Os animais a ser protegidos são da maneira definida em qualquer das Modalidades B7-B12a. A praga parasítica invertebrada é da maneira definida em qualquer das Modalidades B13-B21. O medicamento pode ser em formas de dosagem oral, tópica ou parenteral.

[00105] A invenção deve também incluir compostos da Fórmula 1 ou qualquer das Modalidades 1 a 45 ou Modalidades A-O para uso na fabricação de medicamentos para a proteção de um animal de uma praga

parasítica invertebrada. Os animais a ser protegidos são da maneira definida em qualquer das Modalidades B7-B12a. A praga parasítica invertebrada é da maneira definida em qualquer das Modalidades B13-B21. O medicamento pode ser em formas de dosagem oral, tópica ou parenteral.

[00106] A invenção deve também incluir compostos da Fórmula 1 ou qualquer das Modalidades 1 a 45 ou Modalidades A-O embalada e apresentada para a proteção de um animal de uma praga parasítica invertebrada. Os animais a ser protegidos são da maneira definida em qualquer das Modalidades B7-B12a. A praga parasítica de invertebrados é da maneira definida em qualquer das Modalidades B13-B21. Os compostos da invenção podem ser embalados e apresentados como formas de dosagem oral, tópica ou parenteral.

[00107] A invenção deve também incluir um processo para fabricar uma composição para proteger um animal de uma praga parasítica invertebrada caracterizada por conter um composto da Reivindicação 1 misturado com pelo menos um veículo farmacologicamente ou veterinariamente aceitável. Os animais a ser protegidos são da maneira definida em qualquer das Modalidades B7-B12a. A praga parasítica invertebrada é da maneira definida em qualquer das Modalidades B13-B21. As composições da invenção podem ser embaladas e apresentadas como formas de dosagem oral, tópica ou parenteral.

[00108] Modalidades da invenção incluem um método para proteger uma semente de uma praga parasítica invertebrada compreendendo colocar em contato a semente com uma quantidade biologicamente efetiva de um composto de qualquer das Modalidades anteriores (por exemplo, como uma composição aqui descrita).

[00109] As modalidades da invenção também incluem uma composição compreendendo um composto de qualquer das Modalidades

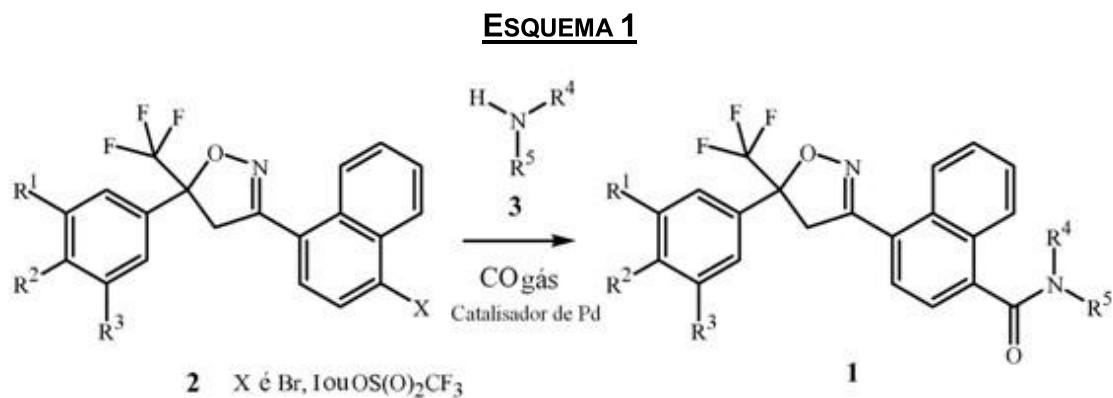
anteriores, na forma de uma formulação líquida de esguicho no solo. Modalidades da invenção incluem adicionalmente métodos para controlar pragas invertebradas compreendendo colocar em contato o solo com uma composição líquida como um esguicho no solo compreendendo uma quantidade biologicamente efetiva de um composto de qualquer das Modalidades anteriores.

[00110] As modalidades da invenção também incluem uma composição de aspersão para controlar pragas invertebradas compreendendo um composto de qualquer das Modalidades anteriores (isto é, em uma quantidade biologicamente efetiva) e um propelente. Modalidades da invenção incluem adicionalmente uma composição de isca para controlar pragas invertebradas compreendendo um composto de qualquer das Modalidades anteriores (isto é, em uma quantidade biologicamente efetiva) um ou mais materiais alimentícios, opcionalmente um agente de atração, e opcionalmente um umectante. As modalidades da invenção também incluem um dispositivo para controlar pragas invertebradas compreendendo a dita composição de isca e um alojamento adaptado para receber a dita composição de isca, em que o alojamento tem pelo menos uma abertura dimensionada para permitir que a praga de invertebrados passe pela abertura de maneira que possa ter acesso à dita composição de isca de um local fora do alojamento, e em que o alojamento seja adicionalmente adaptado para ser colocado em um local de atividade potencial ou conhecida ou próximo a ele para a praga de invertebrado.

[00111] Um ou mais dos métodos e variações seguintes da maneira descrita nos Esquemas 1 a 10 pode ser usado para preparar os compostos da Fórmula 1. As definições de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 no composto das Fórmulas 1 a 15 a seguir são da maneira definida anteriormente no Sumário da Invenção a menos que de outra forma declarada.

[00112] Os compostos da Fórmula 1 podem ser preparados por

aminocarbonilação de brometos de arila, iodetos ou triflatos da Fórmula 2 em que X é Br, I ou OS(O)₂CF₃, com compostos amino apropriadamente substituídos da Fórmula 3 da maneira mostrada no Esquema 1.

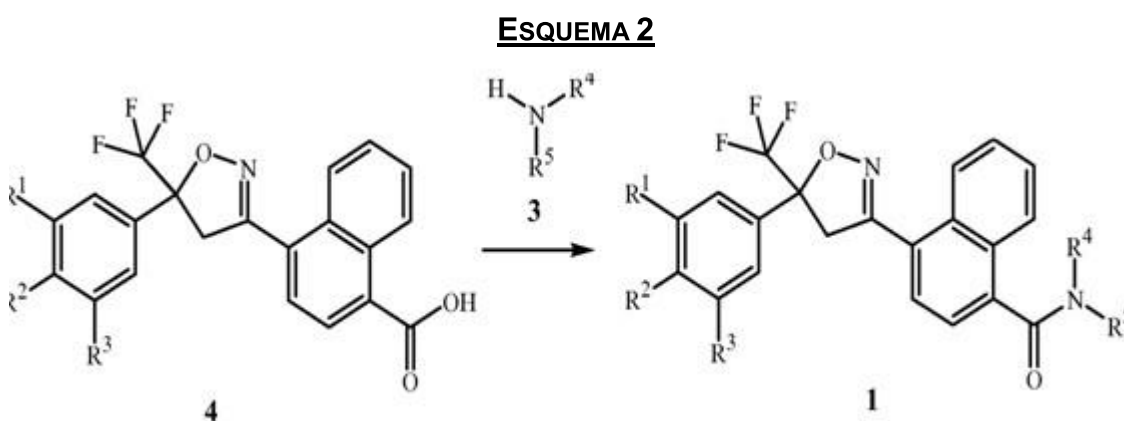


[00113] Esta reação é tipicamente realizada com um brometo de arila da Fórmula 2 em que X é Br na presença de um catalisador de paládio sob uma atmosfera de CO. Os catalisadores de paládio usados para o presente método compreendem tipicamente paládio em um estado de oxidação formal tanto de 0 (isto é, Pd(0)) ou 2 (isto é, Pd(II)). Uma ampla variedade de tais compostos e complexos contendo paládio são usados como catalisadores para o presente método. Exemplos de compostos contendo e complexos paládio usados como catalisadores no método do esquema 1 incluem PdCl₂(PPH₃)₂(bis(trifenilfosfina)dicloreto de paládio(II)), Pd(PPH₃)₄(tetraquis(trifenilfosfina)paládio(0)), Pd(C₅H₇O₂)₂(acetil-acetonato de paládio(II)), Pd₂(dba)₃(tris(dibenzilidenoacetona)dipaládio(0)), e PdCl₂(dppf)[1,1'-bis-(difenilfosfina)ferroceno]dicloropaládio(II). O método do esquema 1 é geralmente conduzido em uma fase líquida, e portanto, para ser mais efetivo o catalisador de paládio preferivelmente tem boa solubilidade na fase líquida. Os solventes usados incluem, por exemplo, éteres tais como 1,2-dimetoxietano, amidas tais como *N-N*-dimetilacetamida, e hidrocarbonetos aromáticos não halogenados tal como tolueno.

[00114] O método do esquema 1 pode ser conduzido por uma

ampla faixa de temperaturas, variando de cerca de 25 a cerca de 150 °C. De nota são temperaturas de cerca de 60 a cerca de 110 °C, que tipicamente fornecem taxas de reação rápidas e rendimentos mais altos do produto. Os métodos e procedimentos gerais para aminocarbonilação com um brometo de arila e uma amina são bem conhecidos na literatura; ver, por exemplo, H. Horino et al, *Synthesis* **1989**, 715; and J. J. Li, G. W. Gribble, editors, *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist*, **2000**.

[00115] Compostos da Fórmula 1 podem também ser preparados acoplando-se ácidos carboxílicos da Fórmula 4 com compostos amina apropriadamente substituídos da Fórmula 3 da maneira mostrada no Esquema 2.



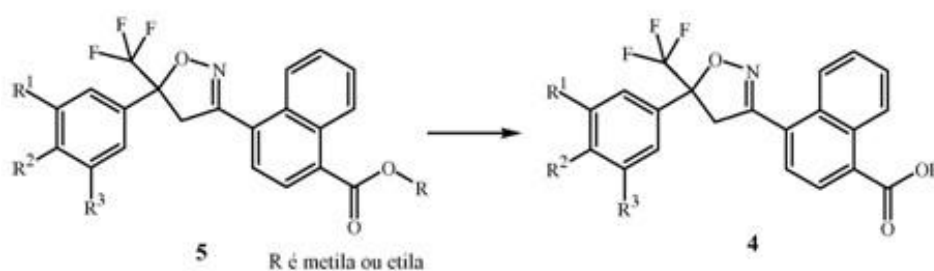
[00116] Esta reação é geralmente realizada na presença de um reagente de acoplamento desidratante tais como dicicloexilcarbodiimida, 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida, anidrido de ácido cíclico 1-propanofosfônico ou carbonila diimidazólica na presença de uma base tais como trietilamina, piridina, 4-(dimetilamino)piridina ou N-N-diisopropiletilamina em um solvente aprótico anidro tais como diclorometano ou tetraidrofurano a uma temperatura tipicamente entre 25 e 70 °C.

[00117] Compostos da Fórmula 1 em que R⁵ é alquila C₁-C₆ ou haloalquila C₁-C₆ substituído com alquilaminocarbonila C₂-C₇, dialquilaminocarbonila C₃-C₉, haloalquilaminocarbonila C₂-C₇ ou halodialquilaminocarbonila C₃-C₉ podem também ser preparados em uma

maneira em etapas pelo método seguinte. Acoplamento dos compostos da Fórmula 2 ou dos ácidos carboxílicos da Fórmula 4 com ésteres amino pelos métodos gerais descritos para os Esquemas 1 e 2 produz intermediários de éster. Estes intermediários de éster são hidrolisados com os ácidos carboxílicos correspondentes, que são então acoplados com as aminas apropriadas para formar os compostos supramencionados da Fórmula 1. Por exemplo, ver Síntese do Exemplo 4 (Etapas C, D e E), Síntese do Exemplo 5 (Etapas B, C e D) e Síntese do Exemplo 6.

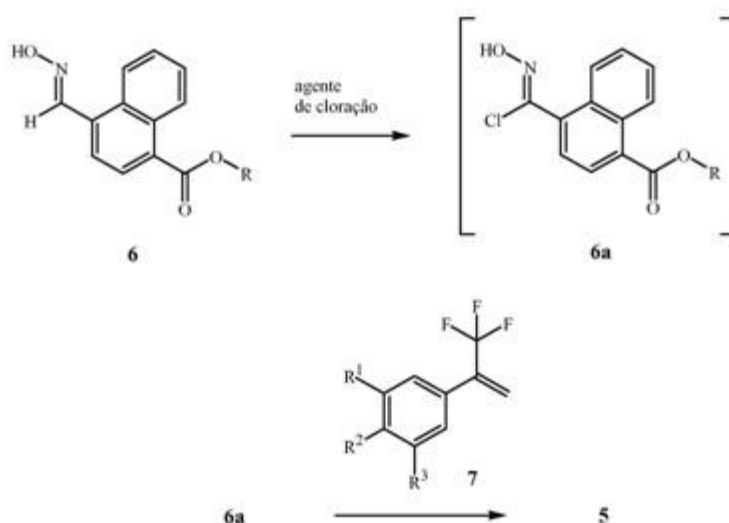
[00118] Compostos da Fórmula 4 podem ser preparados por hidrólise de ésteres da Fórmula 5, em que R é metila ou etila, da maneira mostrada no Esquema 3

ESQUEMA 3



[00119] No método do esquema 3, o éster da Fórmula 5 é convertido no ácido carboxílico correspondente da Fórmula 4 por procedimentos gerais bem conhecidos na tecnologia. Por exemplo, tratamento de um éster metílico ou etílico da Fórmula 5 com hidróxido de lítio aquoso em tetraidrofurano, seguido por acidificação produz o ácido carboxílico correspondente da Fórmula 4.

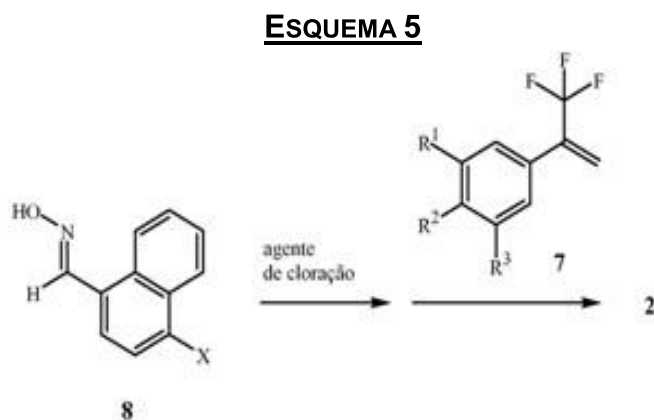
[00120] Ésteres da Fórmula 5 podem ser preparados a partir dos compostos da Fórmula 2 por um método análogo ao método do esquema 1 em que um álcool, como metanol ou etanol é substituído pela amina. Alternativamente, compostos da Fórmula 5 podem ser preparados pela reação de estirenos da Fórmula 7 com oximas da Fórmula 6 da maneira mostrada no Esquema 4.

ESQUEMA 4

[00121] O método do esquema 4 tipicamente envolve a cloração de oximas da Fórmula 6 para formar os cloretos de hidroximoíla da Fórmula 6a. Os intermediários da Fórmula 6a são deidroclorados em condições básicas para formar óxidos de nitrila, que então passam por cicloadição 1,3-dipolar com estirenos da Fórmula 7 para disponibilizar compostos da Fórmula 5. Em um procedimento típico, reagentes de cloração tais como hipoclorito de sódio, *N*-clorosuccinimida, ou cloramina-T são combinados com a oxima na presença de estireno. Dependendo das condições de reação, bases de amina tais como piridina ou trietilamina podem ser necessárias para facilitar a reação de deidrocloração. A reação pode correr em uma ampla variedade de solventes incluindo tetraidrofurano, éter dietílico, cloreto de metileno, dioxano, e tolueno com temperaturas variando de temperatura ambiente à temperatura de refluxo do solvente. Procedimentos gerais para cicloadição de óxidos de nitrila com olefinas são bem documentados na literatura química; por exemplo, ver Lee, *Synthesis*, 1982, 6, 508-509; Kanemasa et al, *Tetrahedron*, **2000**, 56, 1057-1064; EP 1,538,138-AI, bem como referências citadas nele.

[00122] Compostos da Fórmula 2 podem ser preparados pela cicloadição 1,3-dipolar de estirenos da Fórmula 7 com óxidos de nitrila

derivados de oximas da Fórmula 8 da maneira mostrada no Esquema 5.

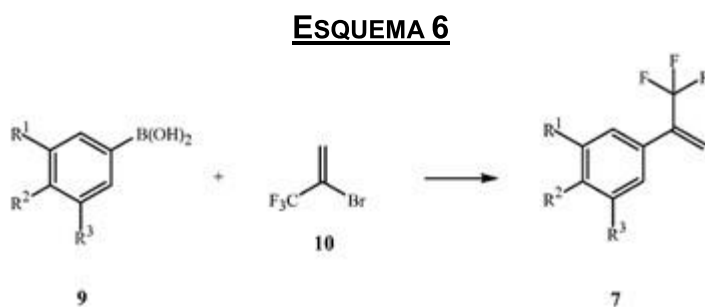


[00123] No método do esquema 5, os compostos da Fórmula 2, em que X é da maneira definida previamente, são gerados colocando-se em contato o composto da Fórmula 8 com um reagente de cloração seguido pela adição de um estireno da Fórmula 7.

[00124] O método do esquema 5 é conduzido analogamente com o método do esquema 4 previamente descrito.

[00125] Os estirenos da Fórmula 7 podem ser preparados pelo acoplamento catalisado por paládio de ácidos aril borônicos da Fórmula 9 com o 2-bromo-3,3,3-trifluorpropeno comercialmente disponível (Fórmula 10). Procedimentos gerais para este método da maneira mostrada no Esquema 6 são documentados na literatura química; ver Pan et al., *J. Fluorine Chemistry*, **1999**, 95, 167-170.

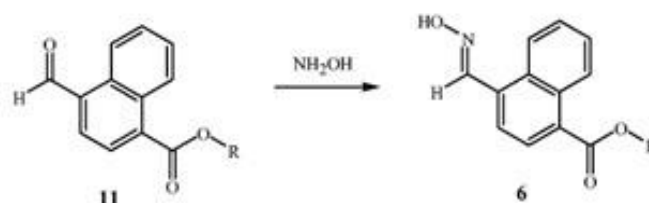
[00126] Outros métodos para preparar estirenos da Fórmula 7 são bem conhecidos na tecnologia.



[00127] As oximas da Fórmula 6 podem ser preparados pela

reação de aldeídos da Fórmula 11, em que R é da maneira definida previamente, com hidroxilamina da maneira mostrada no Esquema 7. Por exemplo, ver, H. K. Jung et al. *Bioorg. Med. Chem.* **2004**, 12, 3965. Os aldeídos da Fórmula 11 podem ser preparados por uma ampla variedade de métodos conhecidos na tecnologia; alguns dos aldeídos são compostos conhecidos.

ESQUEMA 7



[00128] Da maneira mostrada no Esquema 8, os oximas da Fórmula 8, em que X é da maneira definida previamente podem ser preparados a partir dos aldeídos correspondentes da Fórmula 12 análogo ao método do esquema 7.

ESQUEMA 8



[00129] Compostos da Fórmula 12 são comercialmente disponíveis ou compostos conhecidos, ou eles podem ser preparados por uma ampla variedade de métodos conhecidos na tecnologia.

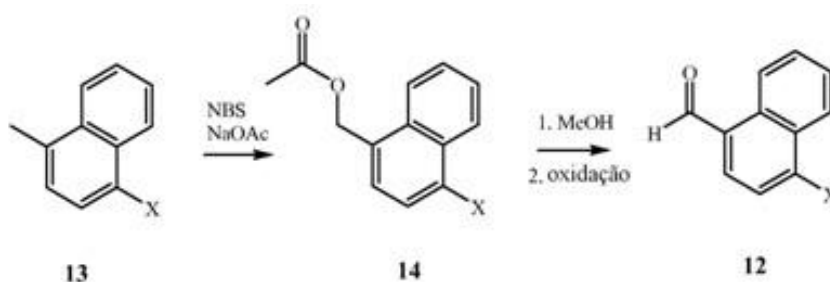
Por exemplo, compostos da Fórmula 12 podem ser preparados por formilação direta dos haletos de arila correspondentes; ver G. E. Boswell et al. *J. Org. Chem.* **1995**, 65, 6592; ou por redução dos ésteres de arila correspondente, ver referências P. R. Bernstein et al. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2001, 2769 and L. W. Deady et al. *Aust. J. Chem.* **1989**, 42, 1029.

[00130] O Esquema 9 ilustra a preparação de acetatos

intermediários da Fórmula 14 a partir de compostos substituídos por metila correspondentes da Fórmula 13 (em que X é da maneira definida previamente) pela reação com *N*-bromosuccinimida (NBS) na presença de 2,2'-azobis(2-metilpropionitrila) (AIBN) e acetato de sódio.

[00131] Os acetatos intermediários da Fórmula 14 são então convertidos nos aldeídos da Fórmula 12 por hidrólise de éster e oxidação.

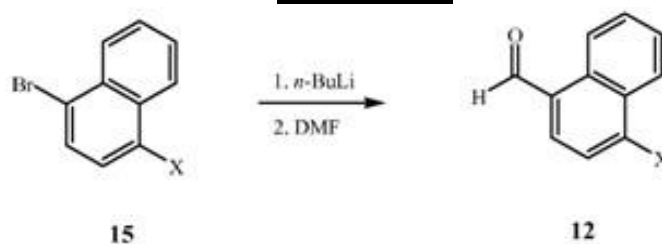
ESQUEMA 9



[00132] Os compostos da Fórmula 13 são comercialmente disponíveis ou compostos conhecidos, ou eles podem ser preparados por uma ampla variedade de métodos conhecidos na tecnologia.

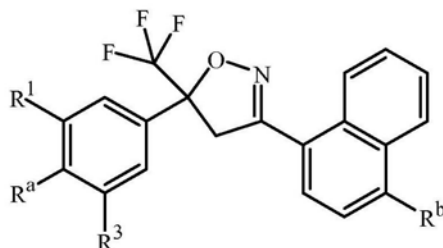
[00133] Um método alternativo para preparar aldeídos da Fórmula 12 (em que X é da maneira definida previamente) é mostrado no Esquema 10. O grupo formila da Fórmula 12 pode ser introduzido no sistema de anel de naftaleno por metalação do brometo da Fórmula 15 seguido por reação de o intermediário de lítio com N,N-dimetilformamida (DMF). Para referências deste método geral, ver *Synthesis*, **2006**, 293 and *Bioorg. Med. Chem.* **2004**, 12, 715.

ESQUEMA 10



[00134] Exemplos de intermediários usados na preparação dos compostos desta invenção são conhecidos nas Tabelas 1-1 até 1-6. As abreviações

seguintes são usadas nas Tabelas que se segue: Me significa metila, Et significa etila, t-Bu significa $-c(CH_3)_3$, S(O) significa sulfinila, S(O)₂ significa sulfonila, Ph significa fenila, C(O) significa carbonila e CHO significa formila.

TABELA I-1

R¹ é Cl, R^a é H, R³ é Cl

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
CO ₂ H	CO ₂ Me	CO ₂ Et	CO ₂ t-Bu	CO ₂ CH ₂ Ph	Br	I
OH	OMe	OS(O) ₂ CF ₃	nitro	NH ₂	ciano	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	CH ₂ OH	CH ₂ OC(O)Me	CHO	C(O)CH ₃	

R¹ é Cl, R^a é F e R³ é Cl

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
CO ₂ H	CO ₂ Me	CO ₂ Et	CO ₂ t-Bu	CO ₂ CH ₂ Ph	Br	I
OH	OMe	OS(O) ₂ CF ₃	nitro	NH ₂	ciano	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	CH ₂ OH	CH ₂ OC(O)Me	CHO	C(O)CH ₃	

R¹ é Cl, R^a é Cl e R³ é Cl

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
CO ₂ H	CO ₂ Me	CO ₂ Et	CO ₂ t-Bu	CO ₂ CH ₂ Ph	Br	I
OH	OMe	OS(O) ₂ CF ₃	nitro	NH ₂	ciano	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	CH ₂ OH	CH ₂ OC(O)Me	CHO	C(O)CH ₃	

R¹ é Br, R^a é H e R³ é Br

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
CO ₂ H	CO ₂ Me	CO ₂ Et	CO ₂ t-Bu	CO ₂ CH ₂ Ph	Br	I
OH	OMe	OS(O) ₂ CF ₃	nitro	NH ₂	ciano	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	CH ₂ OH	CH ₂ OC(O)Me	CHO	C(O)CH ₃	

R¹ é CF₃, R^a é H e R³ é F

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
CO ₂ H	CO ₂ Me	CO ₂ Et	CO ₂ t-Bu	CO ₂ CH ₂ Ph	Br	I
OH	OMe	OS(O) ₂ CF ₃	nitro	NH ₂	ciano	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	CH ₂ OH	CH ₂ OC(O)Me	CHO	C(O)CH ₃	

R^1 é CF_3 , R^a é H e R^3 é Cl

R^b	R^b	R^b	R^b	R^b	R^b	R^b
CO ₂ H	CO ₂ Me	CO ₂ Et	CO ₂ <i>t</i> -Bu	CO ₂ CH ₂ Ph	Br	I
OH	OMe	OS(O) ₂ CF ₃	nitro	NH ₂	ciano	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	CH ₂ OH	CH ₂ OC(O)Me	CHO	C(O)CH ₃	

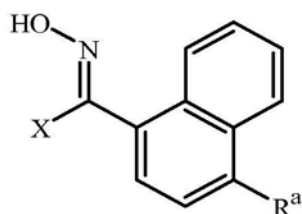
R^1 é CF_3 , R^a é H e R^3 é Br

R^b	R^b	R^b	R^b	R^b	R^b	R^b
CO ₂ H	CO ₂ Me	CO ₂ Et	CO ₂ <i>t</i> -Bu	CO ₂ CH ₂ Ph	Br	I
OH	OMe	OS(O) ₂ CF ₃	nitro	NH ₂	ciano	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	CH ₂ OH	CH ₂ OC(O)Me	CHO	C(O)CH ₃	

R^1 é CF_3 , R^a é H e R^3 é CF_3

R^b	R^b	R^b	R^b	R^b	R^b	R^b
CO ₂ H	CO ₂ Me	CO ₂ Et	CO ₂ <i>t</i> -Bu	CO ₂ CH ₂ Ph	Br	I
OH	OMe	OS(O) ₂ CF ₃	nitro	NH ₂	ciano	Me
CH ₂ Cl	CH ₂ Br	CH ₂ OH	CH ₂ OC(O)Me	CHO	C(O)CH ₃	

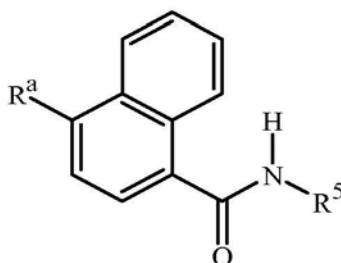
TABELA I-2



X	R^a	X	R^a	X	R^a
H	CO ₂ Me	Cl	CO ₂ Me	Br	CO ₂ Me
H	CO ₂ Et	Cl	CO ₂ Et	Br	CO ₂ Et
H	CO ₂ <i>t</i> -Bu	Cl	CO ₂ <i>t</i> -Bu	Br	CO ₂ <i>t</i> -Bu
H	CO ₂ CH ₂ Ph	Cl	CO ₂ CH ₂ Ph	Br	CO ₂ CH ₂ Ph
H	CH ₂ OC(O)Me	Cl	CH ₂ OC(O)Me	Br	CH ₂ OC(O)Me
H	Br	Cl	Br	Br	Br
H	I	Cl	I	Br	I
H	OH	Cl	OH	Br	OH
H	OMe	Cl	OMe	Br	OMe
H	OS(O) ₂ CF ₃	Cl	OS(O) ₂ CF ₃	Br	OS(O) ₂ CF ₃
H	nitro	Cl	nitro	Br	nitro

<u>X</u>	<u>R^a</u>	<u>X</u>	<u>R^a</u>	<u>X</u>	<u>R^a</u>
H	NH ₂	Cl	NH ₂	Br	NH ₂
H	ciano	Cl	ciano	Br	ciano
H	Me	Cl	Me	Br	Me
H	CH ₂ Cl	Cl	CH ₂ Cl	Br	CH ₂ Cl
H	CH ₂ Br	Cl	CH ₂ Br	Br	CH ₂ Br
H	CH ₂ OH	Cl	CH ₂ OH	Br	CH ₂ OH
H	OCH ₂ Ph	Cl	OCH ₂ Ph	Br	OCH ₂ Ph
H	C(O)Me	Cl	C(O)Me	Br	C(O)Me
H	C(O)Et	Cl	C(O)Et	Br	C(O)Et

TABELA I-3



R^a é CHO

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃

CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R^a é CH=NOH

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl

CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R^a é C(Cl)=NOH

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃

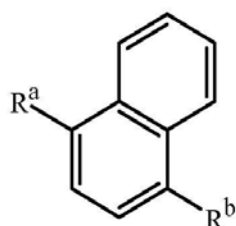
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R^a é C(Br)=NOH

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl

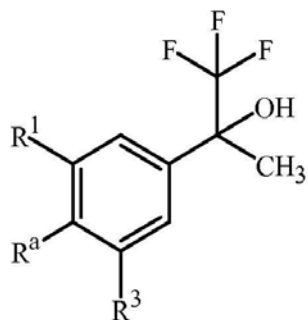
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

TABELA I-4



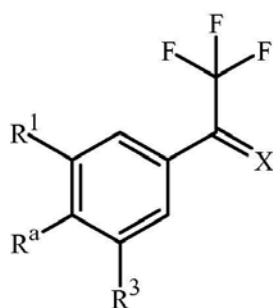
<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>	<u>R^a</u>	<u>R^b</u>
Me	H	CH ₂ Cl	CO ₂ H	CO ₂ H	CO ₂ H	CH ₂ OH	CO ₂ Me
Me	C(O)Me	CH ₂ Cl	CO ₂ Me	CO ₂ H	CO ₂ Me	CH ₂ OH	CO ₂ Et
Me	C(O)Et	CH ₂ Cl	CO ₂ Et	CO ₂ H	CO ₂ Et	CHO	CO ₂ Me
Me	CO ₂ H	CH ₂ Br	CO ₂ H	C(O)Cl	CO ₂ Me	CHO	CO ₂ Et
Me	CO ₂ Me	CH ₂ Br	CO ₂ Me	C(O)Cl	CO ₂ Et		
Me	CO ₂ Et	CH ₂ Br	CO ₂ Et				

TABELA I-5



R^1	R^a	R^3	R^1	R^a	R^3	R^1	R^a	R^3
Cl	H	Cl	CF ₃	H	Br	Br	N(CH ₂ Ph) ₂	Br
Cl	Cl	Cl	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	Cl
Cl	F	Cl	Cl	NH ₂	Cl	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	Br
Br	H	Br	Br	NH ₂	Br	Cl	NHC(O)Me	Cl
CF ₃	H	H	CF ₃	NH ₂	Cl	Br	NHC(O)Me	Br
CF ₃	H	F	CF ₃	NH ₂	Br	CF ₃	NHC(O)Me	Cl
CF ₃	H	Cl	Cl	N(CH ₂ Ph) ₂	Cl	CF ₃	NHC(O)Me	Br

TABELA I-6



$X \text{ é } CH_2$						$X \text{ é } O$					
R^1	R^a	R^3	R^1	R^a	R^3	R^1	R^a	R^3	R^1	R^a	R^3
Cl	H	Cl	Cl	N(CH ₂ Ph) ₂	Cl	Cl	H	Cl	Cl	N(CH ₂ Ph) ₂	Cl
Br	H	Br	Br	N(CH ₂ Ph) ₂	Br	Br	H	Br	Br	N(CH ₂ Ph) ₂	Br
CF ₃	H	H	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	H	CF ₃	H	H	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	H
CF ₃	H	F	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	F	CF ₃	H	F	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	F
CF ₃	H	Cl	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	Cl	CF ₃	H	Cl	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	Cl
CF ₃	H	Br	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	Br	CF ₃	H	Br	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	Br
CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	N(CH ₂ Ph) ₂	CF ₃
Cl	NH ₂	Cl	Cl	NHC(O)Me	Cl	Cl	NH ₂	Cl	Cl	NHC(O)Me	Cl
Br	NH ₂	Br	Br	NHC(O)Me	Br	Br	NH ₂	Br	Br	NHC(O)Me	Br
CF ₃	NH ₂	H	CF ₃	NHC(O)Me	H	CF ₃	NH ₂	H	CF ₃	NHC(O)Me	H
CF ₃	NH ₂	F	CF ₃	NHC(O)Me	F	CF ₃	NH ₂	F	CF ₃	NHC(O)Me	F
CF ₃	NH ₂	Cl	CF ₃	NHC(O)Me	Cl	CF ₃	NH ₂	Cl	CF ₃	NHC(O)Me	Cl
CF ₃	NH ₂	Br	CF ₃	NHC(O)Me	Br	CF ₃	NH ₂	Br	CF ₃	NHC(O)Me	Br
CF ₃	NH ₂	CF ₃	CF ₃	NHC(O)Me	CF ₃	CF ₃	NH ₂	CF ₃	CF ₃	NHC(O)Me	CF ₃
Cl	Cl	Cl	Cl	F	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl	F	Cl

[00135] Reconhece-se que alguns reagentes e condições de reação supradescritos para preparar compostos da Fórmula 1 podem não ser compatíveis com certas funcionalidades presentes nos intermediários. Nestes casos, a incorporação de sequências proteção/desproteção ou interconersões de grupo funcional na síntese ajudará na obtenção dos produtos desejados. O uso e escolha dos grupos de proteção ficarão aparentes aos versados em síntese química (ver, por exemplo, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Versados na tecnologia perceberão que, em alguns casos, após a introdução de um dado reagente da maneira descrita em qualquer esquema individual, pode ser necessário realizar etapas sintéticas de rotina adicionais não descritas em detalhes para completar a síntese dos compostos da Fórmula 1. Versados na tecnologia também reconhecerão que pode ser necessário realizar uma combinação das etapas ilustradas nos esquemas anteriores em uma ordem sem ser aquela implícita pela sequência particular apresentada para preparar os compostos da Fórmula 1.

[00136] Versados na tecnologia também reconhecerão que compostos da Fórmula 1 e os intermediários aqui descritos podem ser submetidos a várias reações eletrofílicas, nucleofílicas, de radicais, organometálicas, de oxidação, e de redução para adicionar substituintes ou modificar substituintes existentes.

[00137] Sem elaboração adicional, acredita-se que os versados na tecnologia usando as descrições anteriores podem utilizar a presente invenção em toda sua abrangência. Os Exemplos das sínteses seguintes são, portanto, considerados meramente ilustrativos e não limitantes da revelação de uma maneira qualquer que seja. Etapas nos Exemplos das sínteses seguintes ilustram um procedimento para cada etapa em uma transformação sintética geral, e o material de partida para cada etapa pode não ter sido

necessariamente preparado por uma corrida preparativa particular cujo procedimento é descrito em outros Exemplos ou Etapas. Porcentagens são em peso, exceto para misturas de solvente cromatográficas ou onde de outra forma indicada. Partes e porcentagens para misturas de solvente cromatográficas são em volume, a menos que de outra forma indicada. Os espectros RNM ^1H são reportados em ppm de baixo campo a partir de tetrametilsilano; "s" significa simplete, "d" significa duplete, "t" significa triplete, "q" significa quarteto, "m" significa multiplete, "dd" significa dupla de dupletes, "dt" significa dupla de tripletes e "br s" significa singlete amplo, e "br t" " significa triplete amplo.

EXEMPLO 1 DA SÍNTESE

PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-

ISOXAZOLIL]-N-[2-(METILTIO)ETIL]-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA

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

METILA

[00138] Uma solução de hidroxilamina (1,33 mL, 50% em água) foi adicionada a uma solução agitada de 4-formil-1-naftalenocarboxilato de metila (2,2 g, preparados da maneira descrita em *Journal of Medicinal Chemistry* 2002, 45(26), 5755-5775) em metanol (50 mL). Após agitação à temperatura ambiente por 2 horas, a mistura da reação foi concentrada sob baixa pressão para fornecer o composto título na forma de um sólido amarelo desbotado (2,55 g). RMN ^1H (CDCl_3): δ 8,93 (d, 1H), 8,86 (s, 1H), 8,41 (d, 1H), 8,14 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,63 (m, 2H), 4,02 (s, 3H).

ETAPA B: PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIIDRO-5-

(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-1-NAFTALENOCARBOXILATO DE METILA

[00139] *N*-clorosuccinimida (1,16 g, 8,72 mmol) foi adicionada a uma solução agitada de 4-[(hidroxiimino)metil]-1-naftalenocarboxilato de metila (isto é, o produto da Etapa A, 1,0 g, 4.36 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (5,0

mL). Esta mistura foi agitada por 1,5 hora à temperatura ambiente, e então uma solução de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluormetil)etenil]benzeno (3,20 g, 13,1 mmol, preparado a partir de 2-bromo-3,3,3-trifluorpropeno comercialmente disponível pelo método descrito em *J. Fluorine Chem.* **1999**, 95, 167-170) e trietilamina (6,1 mL, 43,6 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (4,0 mL) foi adicionada.

[00140] Após agitação por mais 2 horas à temperatura ambiente, a mistura da reação foi diluída com água e extraída com acetato de etila. Os extratos orgânicos combinados foram lavados com salmoura, secos sobre sulfato de sódio e concentrados sob baixa pressão.

[00141] O resíduo foi purificado por cromatografia em sílica gel eluído com acetato de etila/hexanos para disponibilizar o composto título na forma de um óleo amarelo desbotado (700 mg). RMN ¹H (CDCl₃): δ 8,88 (d, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,68 (m, 2H), 7,55 (m, 3H), 7,46 (dd, 1H), 4,27 (d, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,91 (d, 1H).

ETAPA C: PREPARAÇÃO DE ÁCIDO 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-1-NAFTALENOCARBOXÍLICO

[00142] Uma solução de hidróxido de lítio monoidratado (350 mg, 8,34 mmol) em água (10 mL) foi adicionada a uma solução agitada de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-1-naftalenocarboxilato de metila (isto é, o produto da Etapa B, 650 mg, 1,39 mmol) em tetraidrofurano (10 mL), seguido pela adição de metanol (10 mL). A mistura resultante foi agitada por toda a noite à temperatura ambiente e então particionada entre água e éter dietílico. A camada aquosa foi acidificada com ácido clorídrico aquoso 6 N em pH 2 e extraída com acetato de etila. Os extratos orgânicos combinados foram lavados com salmoura, secos sobre sulfato de sódio, e concentrados sob baixa pressão para fornecer o composto título na forma de um sólido branco (450 mg). RMN ¹H (CDCl₃): δ 9,08 (d, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 7,71 (m,

2H), 7,57 (m, 3H), 7,46 (dd, 1H), 4,28 (d, 1H), 3,91 (d, 1H).

ETAPA D: PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-[2-(METILTIO)ETIL]-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA

[00143] Cloreto de oxalila (0,24 mL) foi adicionado a uma suspensão agitada de ácido 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-1-naftalenocarboxílico (isto é, o produto da Etapa C, 620 mg) em diclorometano (20 mL), seguido pela adição de duas gotas de *N,N*-dimetilformamida. A mistura da reação foi agitada à temperatura ambiente por 1,5 hora e então concentrada a vácuo.

[00144] O resíduo foi dissolvido em diclorometano (10 mL) e adicionado a uma solução agitada de 2-(metiltio)etilamina (0,13 mL) e trietilamina (0,38 mL) em diclorometano (10 mL).

[00145] A mistura resultante da reação foi agitada a temperatura ambiente por toda a noite. A mistura da reação foi finalizada com água e extraída com diclorometano.

[00146] Os extratos orgânicos combinados foram lavados com salmoura, secos sobre sulfato de sódio, e concentrados sob baixa pressão.

[00147] O resíduo foi purificado por cromatografia de coluna em sílica gel e eluído com acetato de etila/hexanos para fornecer o composto título (510 mg), um composto desta invenção, na forma de um sólido branco. RMN ¹H (CDCl₃): δ 8,78 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,56-7,64 (m, 4H), 7,49 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 6,57 (br t, 1H), 4,23 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,71 (q, 2H), 2,79 (t, 2H), 2,15 (s, 3H).

EXEMPLO 2 DA SÍNTESE

PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-[2-(METILSULFINIL)ETIL]-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA

[00148] Ácido *m*-cloroperoxibenzóico (47 mg, pureza 70%) foi adicionado a -78 °C a uma solução agitada de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-

5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-*N*-[2-(metiltio)etil]-1-naftalenocarboxamida (isto é, o produto do Exemplo 1, Etapa D, 100 mg) em diclorometano (10 mL).

[00149] A mistura da reação foi agitada de -78 até -70 °C por 2,5 horas e, em seguida, finalizada com bicarbonato de sódio aquoso saturado e extraída com diclorometano. O extrato orgânico foi lavado com salmoura, seco sobre sulfato de sódio, e concentrado sob baixa pressão para fornecer o composto título (102 mg), um composto desta invenção, na forma de um sólido branco. RMN ¹H (CDCl₃): δ 8,78 (d, 1H), 8,29 (d, 1H), 7,42-7,64 (m, 7H), 7,37 (br t, 1H), 4,23 (d, 1H), 4,00 (q, 2H), 3,88 (d, 1H), 3,18 (dt, 1H), 2,89 (dt, 1H), 2,62 (s, 3H).

EXEMPLO 3 DA SÍNTESE

PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-*N*-[2-(METILSULFONIL)ETIL]-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA

[00150] H₂O₂ (0,056 mL, 30% em H₂O) foi adicionado a uma solução agitada de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-*N*-[2-(metilsulfnil)etil]-1-naftalenocarboxamida (isto é, o produto do Exemplo 2, 100 mg) em ácido acético (1,0 mL). A mistura da reação foi agitada a 60 °C por 4 horas, em seguida resfriada a temperatura ambiente, diluída com água, ajustada a pH 4 com solução aquosa de NaOH 1,0 M, e extraída com clorofórmio. O extrato orgânico foi lavado com salmoura, seco sobre sulfato de sódio e concentrado sob baixa pressão para fornecer o composto título (100 mg), um composto desta invenção, na forma de um sólido branco. RMN ¹H (CDCl₃): δ 8,80 (d, 1H), 8,29 (d, 1H), 7,43-7,66 (m, 7H), 6,94 (br t, 1H), 4,24 (d, 1H), 4,04 (q, 2H), 3,40 (t, 2H), 3,01 (s, 3H).

EXEMPLO 4 DA SÍNTESE**PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-[2-OXO-2-[(2,2,2-TRIFLUORETIL)AMINO]ETIL]-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA****ETAPA A: PREPARAÇÃO DE 4-BROMO-1-NAFTALENOCARBOXALDEÍDO OXIMA**

[00151] Uma solução aquosa de hidroxilamina (1,25 mL, 50% em água) foi adicionada a uma solução agitada de 4-bromo-1-naftalenocarboxaldeído (3,7 g, 15,7 mmol, preparada a partir de 1,4-dibromonaftaleno comercialmente disponível pelo método descrito em *European Journal of Organic Chemistry* **2006**, 10, 2329-2335) em etanol (30 mL). Após agitação a temperatura ambiente por 3 horas, a mistura da reação foi concentrada sob baixa pressão para fornecer o composto título na forma de um sólido amarelo desbotado (3,8 g). RMN ¹H (Me₂S(O)-d₆): δ 11,60 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,71 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,74 (m, 3H).

ETAPA B: PREPARAÇÃO DE 3-(4-BROMO-1-NAFTALENIL)-5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)ISOXAZOL

[00152] *N*-clorosuccinimida (1,70 g, 12,7 mmol) foi adicionada a uma solução de 4-bromo-1-naftalenocarboxaldeído oxima (isto é, o produto da Etapa A, 2,33 g, 9,3 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (6,0 mL).

[00153] A mistura da reação foi agitada por 1 hora a temperatura ambiente, e em seguida uma solução de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluormetil)etenil]benzeno (2,70 g, 11,2 mmol, preparada a partir de 2-bromo-3,3,3-trifluorpropeno comercialmente disponível pelo método descrito em *J. Fluorine Chem.* **1999**, 95, 167-170) e trietilamina (4,5 mL, 32,0 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (9,0 mL) foi adicionada.

[00154] Após agitação por mais 2 horas a temperatura ambiente, a mistura da reação foi diluída com água e extraída com acetato de etila. O extrato orgânico foi lavado com salmoura, seco sobre sulfato de sódio, e

concentrado sob baixa pressão.

[00155] O resíduo foi purificado por cromatografia em sílica gel eluído com acetato de etila/hexanos para disponibilizar o composto título na forma de um sólido branco (2.9 g). RMN ¹H (CDCl₃): δ 8,87 (m, 1H), 8,32 (m, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,66 (m, 2H), 7,55 (s, 2H), 7,46 (dd, 1H), 7,32 (d, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 3H).

ETAPA C: PREPARAÇÃO DE ÉSTER METÍLICO N-[[4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-1-NAFTALENIL]CARBONIL]GLICINA

[00156] Uma mistura de 3-(4-bromo-1-naftalenil)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)isoxazol (isto é, o produto da Etapa B, 500 mg), [1,1'-bis(difenil-fosfino)ferroceno]dicloropaládio (II) (82 mg), cloridrato de éster metílico de glicina (514 mg) e trietilamina (2,8 mL) em tolueno (10 mL) foi purgada com monóxido de carbono por 15 minutos.

[00157] A mistura da reação foi agitada a 70 °C sob uma atmosfera de monóxido de carbono por toda a noite.

[00158] A mistura foi em seguida resfriada à temperatura ambiente, filtrada através de uma almofada pequena de filtro diatomáceo de Celite® auxiliar, e rinsada com um pequena quantidade de acetato de etila.

[00159] O filtrado foi concentrado sob baixa pressão, e o resíduo foi purificado por cromatografia em sílica gel eluído com acetato de etila/hexanos para fornecer o composto título na forma de um sólido branco (310 mg). RMN ¹H (CDCl₃): δ 8,75 (d, 1H), 8,28 (d, 1H), 7,45-7,60 (m, 6H), 7,36 (d, 1H), 6,78 (br t, 1H), 4,26 (d, 2H), 4,21 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 3,80 (s, 3H).

ETAPA D: PREPARAÇÃO DE N-[[4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-1-NAFTALENIL]CARBONIL]GLICINA

[00160] Uma solução aquosa de LiOH (300 mg, em 5 mL de H₂O) foi adicionada a uma solução agitada de éster metílico de N-[[4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-1-naftalenil]carbonil]glicina (isto é, o produto da

Etapa C, 620 mg) em tetraidrofurano (5 mL).

[00161] Após agitação a temperatura ambiente por 1 hora, a mistura da reação foi diluída com água e extraída com hexano.

[00162] A camada aquosa foi acidificada com HCl 6,0 N a pH 2, e um precipitado branco formou-se e a mistura aquosa foi extraída com acetato de etila. O extrato orgânico foi lavado com salmoura, seco sobre sulfato de sódio, e concentrado sob baixa pressão para fornecer o composto título (600 mg) na forma de um sólido branco. RMN ¹H (Me₂S(O)-d₆): δ 9,02 (t, 1H), 8,81 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,83 (t, 1H), 7,65-7,74 (m, 5H), 4,58 (d, 1H), 4,54 (d, 1H), 4,02 (d, 2H).

ETAPA E: PREPARAÇÃO DE 4-[5-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-[2-OXO-2-[(2,2,2-TRIFLUORETIL)AMINO]ETIL]-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA

[00163] PS-carbodiimida (0,53 g, 123 mmol/g, Argonaut Technologies, Inc.) foi adicionada a uma mistura agitada de *N*-[[4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-1-naftalenil]carbonil]glicina (isto é, o produto da Etapa D, 510 mg) e 2,2,2-trifluoetilamina (0,072 mL) em diclorometano (3 mL) a temperatura ambiente.

[00164] A mistura foi agitada à temperatura ambiente por 5 horas, em seguida filtrada e concentrada sob baixa pressão.

[00165] O resíduo foi purificado por cromatografia de coluna para fornecer o composto título (99 mg), um composto desta invenção, na forma de um sólido branco.

[00166] RMN ¹H (CDCl₃): δ 8,82 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,46-7,67 (m, 7H), 7,09 (m, 2H), 4,28 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,96 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).

EXEMPLO 5 DA SÍNTESE**PREPARAÇÃO DE 4-[5-[3,5-BIS(TRIFLUORMETIL)FENIL]-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-[2-OXO-2-[(2,2,2-TRIFLUORETIL)AMINO]ETIL]-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA****ETAPA A: PREPARAÇÃO DE 5-[3,5-BIS(TRIFLUORMETIL)FENIL]-3-(4-BROMO-NAFTALENIL)-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)ISOXAZOL**

[00167] *N*-clorosuccinimida (2,05 g, 15,5 mmol) foi adicionada a uma solução de 4-bromo-1-naftalenocarboxaldeído oxima (isto é, o produto do Exemplo 4, Etapa A, 3,20 g, 12,8 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (20,0 mL). A mistura da reação foi agitada por 1 hora a temperatura ambiente, e em seguida uma solução de 1,3-bis(trifluormetil)-5-[1-(trifluormetil)etenil]benzeno (5,13 g, 16,6 mmol, preparada de acordo com o método descrito em *J. Org. Chem.* **1959**, 24, 238-239) e trietilamina (5,4 mL, 38,4 mmol) em *N,N*-dimetilformamida (10,0 mL) foi adicionada. Após agitação por mais 2 horas a temperatura ambiente, a mistura da reação foi diluída com água e extraída com acetato de etila.

[00168] O extrato orgânico foi lavado com salmoura, seco sobre sulfato de sódio, e concentrado sob baixa pressão.

[00169] O resíduo foi purificado por cromatografia em sílica gel eluído com acetato de etila/hexanos para disponibilizar o composto título na forma de um sólido branco (3,2 g). RMN ¹H (CDCl₃): δ 8,89 (m, 1H), 8,35 (m, 1H), 8,13 (s, 2H), 7,99 (s, 1H), 7,81 (d, 1H), 7,69 (m, 2H), 7,37 (d, 1H), 4,38 (d, 1H), 3,94 (d, 3H).

ETAPA B: PREPARAÇÃO DE ÉSTER METÍLICO DE N-[[4-[5-[3,5-BIS(TRIFLUORMETIL)FENIL]-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-1-NAFTALENIL]CARBONIL]GLICINA

[00170] Uma mistura de 5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-3-(4-bromo-1-naftalenil)-4,5-diidro-5-(trifluormetil)isoxazol (isto é, o produto da Etapa A, 1,2

g), [1,1'-bis(difenil-fosfino)ferroceno]dicloropaládio(II) (88 mg), cloridrato de éster metílico de glicina (1,1 g) e trietilamina (6,0 mL) em tolueno (20 mL) foi purgada com monóxido de carbono por 15 minutos. A mistura da reação foi agitada a 70 °C sob um atmosfera de monóxido de carbono por toda a noite. A mistura foi em seguida resfriada à temperatura ambiente, filtrada através de uma almofada pequena de filtro diatomáceo de Celite® auxiliar, e rinsada com uma pequena quantidade de acetato de etila. O filtrado foi concentrado sob baixa pressão, e o resíduo foi purificado por cromatografia em sílica gel eluído com acetato de etila/hexanos para fornecer o composto título na forma de um sólido branco (0,9 g). RMN ¹H (CDCl₃): δ 8,79 (d, 1H), 8,32 (d, 1H), 8,15 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,60 (m, 2H), 7,55 (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 6,66 (br t, 1H), 4,36 (d, 1H), 4,29 (d, 2H), 3,94 (d, 1H), 3,82 (s, 3H).

ETAPA C: PREPARAÇÃO DE N-[[4-[5-[3,5-BIS(TRIFLUORMETIL)FENIL]-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-1-NAFTALENIL]CARBONIL]GLICINA

[00171] Uma solução aquosa de LiOH (300 mg, em 10 mL de H₂O) foi adicionada a uma solução agitada de éster metílico de N-[[4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-1-naftalenil]carbonil]glicina (isto é, o produto da Etapa B, 850 mg) em tetraidrofurano (10 mL). Após agitação à temperatura ambiente por 1 hora, a mistura da reação foi diluída com água e extraída com hexano. A camada aquosa foi acidificada com HCl 6,0 N a pH 2, e um precipitado branco formou-se. A mistura aquosa foi extraída com acetato de etila. O extrato orgânico foi lavado com salmoura, seco sobre sulfato de sódio, e concentrado sob baixa pressão para fornecer o composto título (800 mg) na forma de um sólido branco. RMN ¹H (CDCl₃): δ 8,63 (d, 1H), 8,12 (d, 1H), 8,10 (s, 2H), 7,99 (s, 1H), 7,23-7,48 (m, 4H), 7,09 (br t, 1H), 4,20 (d, 1H), 4,19 (s, 2H), 3,83 (d, 1H).

ETAPA D: PREPARAÇÃO DE 4-[5-[3,5-BIS(TRIFLUORMETIL)FENIL]-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-[2-OXO-2-[(2,2,2-TRIFLUORETIL)AMINO]ETIL]-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA

[00172] PS-carbodiimida (400 mg, 123 mmol/g, Argonaut Technologies, Inc.) foi adicionada a uma mistura agitada de *N*-[[4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-1-naftalenil]carbonil]glicina (isto é, o produto da Etapa C, 140 mg) e 2,2,2-trifluoretilamina (0,038 mL) em diclorometano (3 mL) a temperatura ambiente. A mistura foi agitada a temperatura ambiente por toda a noite, em seguida filtrada e concentrada sob baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia de coluna em sílica gel, eluído com acetato de etila/hexano para fornecer o composto título (115 mg), um composto desta invenção, na forma de um sólido branco. RMN ¹H (CDCl₃): δ 8,77 (d, 1H), 8,16 (d, 1H), 8,13 (s, 2H), 8,01 (s, 1H), 7,51-7,60 (m, 3H), 7,46 (t, 1H), 7,42 (d, 1H), 7,33 (d, 1H), 4,31 (d, 1H), 4,23 (d, 2H), 3,83-3,92 (m, 3H).

EXEMPLO 6 DA SÍNTESE

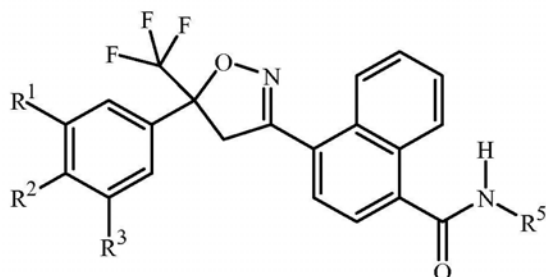
PREPARAÇÃO DE 4-[5-[3,5-BIS(TRIFLUORMETIL)FENIL]-4,5-DIIDRO-5-(TRIFLUORMETIL)-3-ISOXAZOLIL]-N-[2-[(1-METILETIL)AMINO]-2-OXOETIL]-1-NAFTALENOCARBOXAMIDA

[00173] Cloreto de trimetilacetila (0,078 mL) foi adicionado a uma mistura agitada de *N*-[[4-[5-[3,5-bis(trifluormetil)fenil]-4,5-diidro-5-(trifluormetil)-3-isoxazolil]-1-naftalenil]carbonil]glicina (isto é, o produto do Exemplo 5, Etapa C, 307 mg) e piridina (0,052 mL) em diclorometano (6 mL) a temperatura ambiente. A mistura foi agitada a temperatura ambiente por 2 horas e, em seguida, isopropilamina (0,29 mL) e trietilamina (1,8 mL) foram adicionados. Após agitação à temperatura ambiente por mais 1 hora, a mistura da reação foi concentrada sob baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia de coluna em sílica gel eluído com acetato de etila/hexanos para fornecer o composto título (235 mg), um composto desta invenção, na forma de um sólido

branco. RMN ^1H ($\text{CD}_3\text{C}(\text{O})\text{CD}_3$): δ 8.92 (d, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.38 (s, 2H), 8.26 (s, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.84 (br t, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.64-7.72 (m, 2H), 7.15 (br s, 1H), 4.74 (d, 1H), 4.65 (d, 1H), 4.09 (d, 2H), 1.15 (d, 6H).

[00174] Pelos procedimentos aqui descritos junto com métodos conhecidos na tecnologia, os compostos seguintes das Tabelas 1 a 5 podem ser preparados. As abreviações seguintes são usadas nas Tabelas que se seguem: Me significa metila, Et significa etila, *i*-Pr significa $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, *z*-Bu $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, *s*-Bu significa $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, *t*-Bu $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, CN significa ciano, S(O) significa sulfinila, S(O)₂ sulfonila, e C(O) significa carbonila (por exemplo, C(O)Me metilcarbonila). Amidas representadas por RC(O)NHR' ou RC(O)NR'R" são da maneira definida previamente no Sumário da Invenção.

TABELA 1



R^1 é Cl, R^2 é H e R^3 é Cl

R^5	R^5	R^5
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Et)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
C(Me) ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)

CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃

CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me		

R¹ é Cl, R² é F e R³ é Cl

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Et)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
C(Me) ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)

CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃

CH₂CH₂CH(CF₃)S(O)Me
 CH(Me)CH₂CH₂S(O)Me
 CH(Et)CH₂CH₂S(O)Me

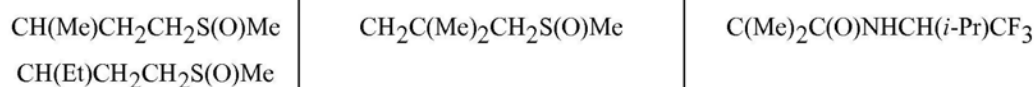
CH₂CH(Me)CH₂S(O)Me
 CH₂C(Me)₂CH₂S(O)Me

C(Me)₂C(O)NHCH₂(CF₂)₂CF₃
 C(Me)₂C(O)NHCH(*i*-Pr)CF₃

R¹ é Br, R² é H e R³ é Br

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Et)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
C(Me) ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)

CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃



R¹ é CF₃, R² é H e R³ é F

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Et)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
C(Me) ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)

CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me		

R^1 é CF_3 , R^2 é H e R^3 é Cl

R^5	R^5	R^5
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Et)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
C(Me) ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂

CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃

R¹ é CF₃, R² é H e R³ é Br

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(CF ₃)(Me)OH	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH(Et)CH ₂ OH	C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NEt ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ OH	CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH(CF ₃)OH	CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NMe(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
C(Me) ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ CH ₂ OH	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH(Et)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)NH(Et)
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(<i>t</i> -Bu)
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (<i>t</i> -Bu)
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃

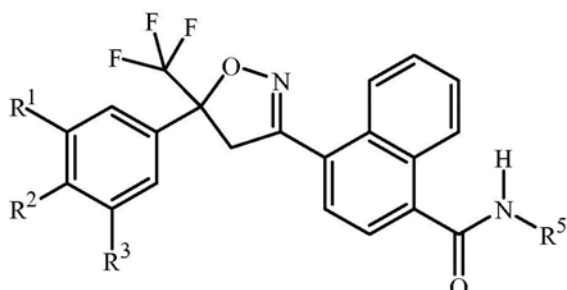
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHFCF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me		

R^1 é CF_3 , R^2 é H e R^3 é CF_3

R^5	R^5	R^5
CH_2CH_2OH	$CH_2CH_2SO_2Me$	$CH_2C(O)NH(Me)$
CH_2CH_2OMe	$CH_2CH_2SO_2Et$	$CH_2C(O)NH(Et)$
CH_2CH_2OEt	$CH_2CH_2SO_2(n-Pr)$	$CH_2C(O)NH(n-Pr)$
$CH_2CH_2O(i-Pr)$	$CH_2CH_2SO_2(i-Pr)$	$CH_2C(O)NH(i-Pr)$
$CH_2CH(Me)OH$	$CH_2CH_2SO_2(i-Bu)$	$CH_2C(O)NH(n-Bu)$
$CH_2CH(CF_3)OH$	$CH_2CH_2SO_2(t-Bu)$	$CH_2C(O)NH(i-Bu)$
$CH_2C(Me)_2OH$	$CH_2CH(Me)SO_2Me$	$CH_2C(O)NH(s-Bu)$
$CH_2C(CF_3)(Me)OH$	$CH_2CH(CF_3)SO_2Me$	$CH_2C(O)NH(t-Bu)$
$CH(Me)CH_2OH$	$CH_2C(Me)_2SO_2Me$	$CH_2C(O)NHCH_2(t-Bu)$
$C(Me)_2CH_2OH$	$CH(Me)CH_2SO_2Me$	$CH_2C(O)NMe_2$
$CH(Et)CH_2OH$	$C(Me)_2CH_2SO_2Me$	$CH_2C(O)NMe(Et)$
$CH(i-Pr)CH_2OH$	$CH(Et)CH_2SO_2Me$	$CH_2C(O)NEt_2$
$CH(i-Bu)CH_2OH$	$CH(i-Pr)CH_2SO_2Me$	$CH_2C(O)NMe(n-Pr)$
$CH(Me)CH(CF_3)OH$	$CH(i-Bu)CH_2SO_2Me$	$CH_2C(O)NMe(i-Pr)$
$CH_2CH_2CH_2OH$	$CH_2CH_2CH_2SO_2Me$	$CH_2C(O)NMe(s-Bu)$
$CH_2CH_2CH_2OMe$	$CH_2CH_2CH_2SO_2Et$	$CH(Me)C(O)NH(Me)$
$CH_2CH_2CH_2OEt$	$CH_2CH_2CH_2SO_2(i-Bu)$	$CH(Me)C(O)NH(Et)$
$CH_2CH_2CH(CF_3)OH$	$CH_2CH_2CH_2SO_2(t-Bu)$	$CH(Me)C(O)NH(n-Pr)$
$CH(Me)CH_2CH_2OH$	$CH_2CH_2CH(Me)SO_2Me$	$CH(Me)C(O)NH(i-Pr)$
$C(Me)_2CH_2CH_2OH$	$CH_2CH_2CH(CF_3)SO_2Me$	$CH(Me)C(O)NH(n-Bu)$
$CH(i-Pr)CH_2CH_2OH$	$CH(Me)CH_2CH_2SO_2Me$	$CH(Me)C(O)NH(i-Bu)$
$CH_2CH(Me)CH_2OH$	$CH(Et)CH_2CH_2SO_2Me$	$CH(Me)C(O)NH(s-Bu)$
$CH_2C(Me)_2CH_2OH$	$CH_2CH(Me)CH_2SO_2Me$	$CH(Me)C(O)NH(t-Bu)$
$CH_2CH_2CH(Me)OH$	$CH_2C(Me)_2CH_2SO_2Me$	$CH(Me)(O)NHCH_2(t-Bu)$
$CH_2CH_2C(Me)_2OH$	$CH_2C(O)NHCH_2CH_2F$	$C(Me)_2C(O)NH(Me)$
CH_2CH_2SMe	$CH_2C(O)NHCH_2CH_2Cl$	$C(Me)_2C(O)NH(Et)$
CH_2CH_2SEt	$CH_2C(O)NHCH_2CHF_2$	$C(Me)_2C(O)NH(n-Pr)$
$CH_2CH_2S(n-Pr)$	$CH_2C(O)NHCH_2CF_3$	$C(Me)_2C(O)NH(i-Pr)$
$CH_2CH_2S(i-Pr)$	$CH_2C(O)NHCH_2CH(Me)F$	$C(Me)_2C(O)NH(n-Bu)$
$CH_2CH_2S(i-Bu)$	$CH_2C(O)NHCH_2C(Me)_2F$	$C(Me)_2C(O)NH(i-Bu)$
$CH_2CH_2S(t-Bu)$	$CH_2C(O)NH(CH_2)_2CH_2F$	$C(Me)_2C(O)NH(s-Bu)$
$CH_2CH(Me)SMe$	$CH_2C(O)NHCH_2CH_2CF_3$	$C(Me)_2C(O)NH(t-Bu)$
$CH_2CH(CF_3)SMe$	$CH_2C(O)NHCH_2CHF_2CF_3$	$C(Me)_2C(O)NHCH_2(t-Bu)$
$CH_2C(Me)_2SMe$	$CH_2C(O)NHCH_2CF_2CF_3$	$CH_2C(O)N(Me)CH_2CH_2F$
$CH(Me)CH_2SMe$	$CH_2C(O)NHCH(Me)CF_3$	$CH_2C(O)N(Me)CH_2CH_2Cl$
$C(Me)_2CH_2SMe$	$CH_2C(O)NHCH(CF_3)_2$	$CH_2C(O)N(Me)CH_2CHF_2$
$CH(Et)CH_2SMe$	$CH_2C(O)NHC(Me)_2CF_3$	$CH_2C(O)N(Me)CH_2CF_3$

CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH(Et)CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	CH(Me)C(O)N(Me)(CH ₂) ₂ CH ₂ F
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH(Me)C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(CF ₃) ₂	CH(Me)C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ F
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₂ F
CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₂ CF ₃
CH(Et)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH(<i>i</i> -Pr)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH(CF ₃) ₂
CH(<i>i</i> -Bu)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)F	C(Me) ₂ C(O)N(Me)C(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ C(Me) ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CH ₂ F	C(Me) ₂ C(O)NHCH(CF ₃) ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>i</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>t</i> -Bu)	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	C(Me) ₂ C(O)NH(CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	C(Me) ₂ C(O)NHCH(<i>i</i> -Pr)CF ₃
CH(Et)CH ₂ CH ₂ S(O)Me		

TABELA 2



R^1 é Cl, R^2 e R^3 são H

R^5	R^5	R^5
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é Cl, R² é H e R³ é F

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃

CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ e R² são Cl, R³ é H

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹, R² e R³ são Cl

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ e R³ são Cl, R² é ciano

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂

CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é Br, R² e R³ são H

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)

CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é Br, R² é H e R³ é F

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)

CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é Br, R² é H e R³ é Cl

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂

CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ e R³ são Br, R² é F

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃

CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é Br, R² e R³ são Cl

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃

CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ e R³ são Br, R² é Cl

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl

CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é CF₃, R² e R³ são H

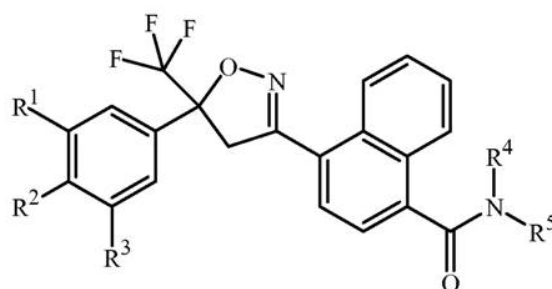
<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂

CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é OCF₃, R² é H e R³ é Br

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃

$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{SMe}$	$\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	$\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CF}_3$
$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CF}_3)\text{SMe}$	$\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{Me})$	$\text{CH}(\text{Me})\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$
$\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$	$\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{Et})$	$\text{CH}(\text{Me})\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CHF}_2$
$\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{SMe}$	$\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}(n\text{-Pr})$	$\text{CH}(\text{Me})\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CF}_3$
$\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_2\text{CH}_2\text{SMe}$	$\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}(i\text{-Pr})$	$\text{CH}(\text{Me})\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$
$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{Me}$	$\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}(i\text{-Bu})$	$\text{CH}(\text{Me})\text{C}(\text{O})\text{NHCH}(\text{Me})\text{CF}_3$
$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{Et}$	$\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}(s\text{-Bu})$	$\text{CH}(\text{Me})\text{C}(\text{O})\text{NHCH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{CF}_3$

TABELA 3

R¹ é Cl, R² é H, R³ é Cl, R⁴ é C(O)Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é Cl, R² é H, R³ é Cl, R⁴ é CO₂Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂

CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é Cl, R² é H, R³ é Cl, R⁴ é CO₂(*t*-Bu)

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é Cl, R² é F, R³ é Cl, R⁴ é C(O)Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é Cl, R² é F, R³ é Cl, R⁴ é CO₂Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é Cl, R² é F, R³ é Cl, R⁴ é CO₂(*t*-Bu)

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃

CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é Br, R² é H, R³ é Br, R⁴ é C(O)Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é Br, R² é H, R³ é Br, R⁴ é CO₂Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é Br, R² é H, R³ é Br, R⁴ é CO₂(t-Bu)

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é CF₃, R² é H, R³ é F, R⁴ é C(O)Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

5

R¹ é CF₃, R² é H, R³ é F, R⁴ é CO₂Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂

CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é CF₃, R² é H, R³ é F, R⁴ é CO₂(*t*-Bu)

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é CF₃, R² é H, R³ é Cl, R⁴ é C(O)Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é CF₃, R² é H, R³ é Cl, R⁴ é CO₂Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é CF₃, R² é H, R³ é Cl, R⁴ é CO₂(*t*-Bu)

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃

CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é CF₃, R² é H, R³ é Br, R⁴ é C(O)Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é CF₃, R² é H, R³ é Br, R⁴ é CO₂Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é CF₃, R² é H, R³ é Br, R⁴ é CO₂(t-Bu)

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é CF₃, R² é H, R³ é CF₃, R⁴ é C(O)Me

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R¹ é CF₃, R² é H, R³ é CF₃, R⁴ é CO₂Me

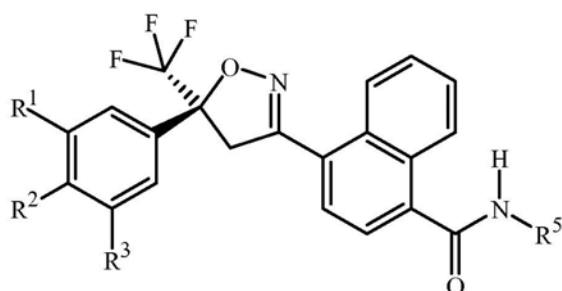
<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂

CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

R^1 é CF₃, R^2 é H, R^3 é CF₃, R^4 é CO₂(*t*-Bu)

R^5	R^5	R^5
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NMe ₂	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	

TABELA 4



R¹ é Cl, R² é H e R³ é Cl

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R^1 é Cl, R^2 é F e R^3 é Cl

R^5	R^5	R^5
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R^1 é Br, R^2 é H e R^3 é Br

R^5	R^5	R^5
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R^1 é CF_3 , R^2 é H e R^3 é F

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é CF₃, R² é H e R³ é Cl

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é CF₃, R² é H e R³ é Br

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)

CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R^1 é CF₃, R^2 é H e R^3 é CF₃

R^5	R^5	R^5
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)

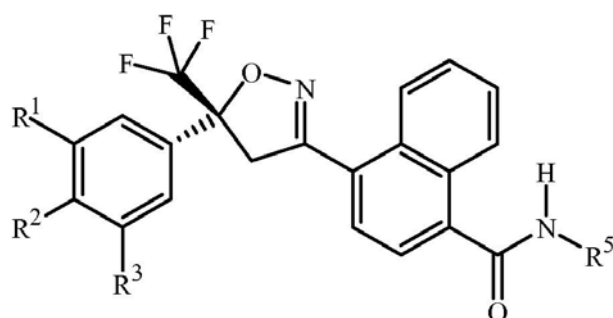
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ is CF₃, R² is H and R³ is CF₃

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)

CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

TABELA 5



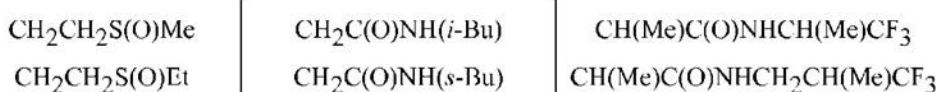
R¹ é Cl, R² é H e R³ é Cl

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂

CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é Cl, R² é F e R³ é Cl

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃



R¹ é Br, R² é H e R³ é Br

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é CF₃, R² é H e R³ é F

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é CF₃, R² é H e R³ é Cl

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)

CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é CF₃, R² é H e R³ é Br

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)

CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

R¹ é CF₃, R² é H e R³ é CF₃

<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>	<u>R⁵</u>
CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ S(O)(<i>n</i> -Pr)	CH ₂ C(O)NMe ₂
CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH ₂ C(O)NMe(Et)
CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Me)
CH ₂ CH ₂ O(<i>i</i> -Pr)	CH ₂ C(Me) ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(Et)
CH ₂ CH(Me)OH	CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>n</i> -Pr)
CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)
CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH(Me)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ CH(Me)S(O)Me	CH(Me)C(O)NH(<i>s</i> -Bu)

CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH(Me)CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)OH	CH ₂ CH(Me)CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH(Me)CH ₂ CH ₂ OH	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(Me)CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH ₂ CH(Me)OH	CH ₂ CH ₂ SO ₂ (<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH ₂ C(Me) ₂ OH	CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ C(Me) ₂ SO ₂ Me	CH(Me)C(O)N(Me)CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	C(Me) ₂ C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH ₂ C(Me) ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(Me)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	CH(Me)CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₂ CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(Me)SMe	CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)SMe	CH ₂ C(O)NH(Me)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl
CH(Me)CH ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(Et)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CHF ₂
CH ₂ CH(Me)CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>n</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CF ₃
CH ₂ C(Me) ₂ CH ₂ SMe	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Me	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH(Me)CF ₃
CH ₂ CH ₂ S(O)Et	CH ₂ C(O)NH(<i>s</i> -Bu)	CH(Me)C(O)NHCH ₂ CH(Me)CF ₃

[00175] Um composto desta invenção será geralmente usado na forma de um ingrediente ativo no controle de pragas invertebradas em uma composição, isto é, formulação, com pelo menos um componente adicional selecionado do grupo que consiste em agentes tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos, que funciona na forma de um veículo. Os ingredientes da formulação ou composição são selecionados para que sejam consistentes com as propriedades físicas do ingrediente ativo, modo de aplicação e fatores ambientais, tais como tipo de solo, umidade e temperatura.

[00176] As formulações usadas incluem tanto composições líquidas quanto sólidas. As composições líquidas incluem soluções (incluindo concentrados emulsificáveis), suspensões, emulsões (incluindo microemulsões e/ou suspoemulsões) e similares, que opcionalmente podem ser espessados nos géis. Os tipos gerais de composições líquidas aquosas são concentrados solúveis, concentrado em suspensão, suspensão em cápsula, emulsão concentrada, microemulsão e suspoemulsão. Os tipos gerais de composições líquidas não aquosas são concentrados emulsificáveis, concentrado microemulsificável, concentrado dispersível e dispersão em óleo.

[00177] Os tipos gerais de composições sólidas são poeiras, pós, grânulos, *pellets*, perolados, pastilhas, comprimidos, filmes cheios (incluindo revestimentos de semente) e similares, que podem ser dispersíveis em água ("molháveis") ou solúveis em água. Filmes e revestimentos formados de soluções de formação de filme ou suspensões escoáveis são particularmente usadas para tratamento de semente. O ingrediente ativo pode ser (micro)encapsulado e formado adicionalmente em uma suspensão ou formulação sólida; alternativamente a formulação total de ingrediente ativo pode ser encapsulada (ou "recoberta"). A encapsulação pode controlar ou atrasar a liberação do ingrediente ativo. Um grânulo emulsificável combina as vantagens tanto de uma formulação concentrada emulsificável quanto uma formulação granular seca. As composições de alta concentração são basicamente usadas como intermediários para formulação adicional.

[00178] As formulações aspergíveis são tipicamente estendidas em um meio adequado antes da aspersão. Tais formulações líquidas e sólidas são formuladas para ser facilmente diluídas no meio de aspersão, normalmente água. Os volumes de aspersão podem variar de cerca de um a milhares de litros por hectare, mas, mais tipicamente são na faixa de cerca de dez a centenas de litros por hectare. As formulações aspergíveis podem ser

misturadas no tanque com água ou em um outro meio adequado para tratamento foliar por aplicação aérea ou terrestre, ou para aplicação ao meio terrestre da planta. As formulações líquidas e secas podem ser medidas diretamente nos sistemas de irrigação por gotejamento ou medidas no sulco durante o plantio. As formulações líquidas e sólidas podem ser aplicadas nas sementes das lavouras e outra vegetação desejável como tratamentos de semente antes do plantio para proteger o desenvolvimento das raízes e de outras partes subterrâneas da planta e/ou folhagem através de captação sistêmica.

[00179] As formulações conterão tipicamente quantidades efetivas de ingrediente ativo, diluente e agente tensoativo nas seguintes faixas aproximadas que adicionam até 100 por cento em peso.

Porcentagem em peso			
	Ingrediente ativo	Diluente	Agente tensoativo
Grânulos dispersíveis em água e solúveis em água, comprimidos e pós	0,001-90	0-99,999	0-15
Dispersões em óleo, suspensões, emulsões, soluções, (incluindo concentrados emulsificáveis)	1-50	40-99	0-50
Poeiras	1-25	70-99	0-5
Grânulos e pelotas	0,001-99	5-99,999	0-5
Composições de alta concentração	90-99	0-10	0-2

[00180] Diluentes sólidos incluem, por exemplo, argilas tais como bentonita, montmorilonita, atapulgita e caolim, gesso, celulose, dióxido de titânio, óxido de zinco, amido, dextrina, açúcares (por exemplo, lactose,

sacarose), sílica, talco, mica, terra diatomácea, uréia, carbonato de cálcio, carbonato de sódio e bicarbonato e sulfato de sódio. Diluentes sólidos típicos são descritos em Watkins et al., *Handbook the Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

[00181] Diluentes líquidos incluem, por exemplo, água, *N-N*-dimetilalcanamidas (por exemplo, *N-N*-dimetilformamida), limoneno, sulfóxido de dimetila, *N*-alquilpirrolidonas (por exemplo, *N*-metilpirrolidinona), etilenoglicol, metilenoglicol, propilenoglicol, dipropilenoglicol, polipropilenoglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (por exemplo, óleos minerais brancos, parafinas normais, isoparafinas), alquilbenzenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, triacetina, hidrocarbonetos aromáticos, alifáticos desaromatizados, cetonas tais como cicloexanona, 2-heptanona, isoforona e 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tal 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 alquilado, ésteres dibásicos e γ -butirolactona, e álcoois, que podem ser lineares, ramificados, saturados ou insaturados, tais como metanol, etanol, *n*-propanol, álcool isopropílico, *n*-butanol, álcool isobutílico, *n*-hexanol, 2-etilexanol, *n*-octanol, decanol, álcool isodecílico, iso-octadecanol, álcool cetílico, álcool laurílico, álcool tridecílico, álcool oleílico, cicloexanol, álcool tetraidrofurfurílico, álcool diacetona e álcool benzílico. Diluentes líquidos também incluem ésteres de glicerol ácidos graxos saturados e insaturados (tipicamente C₆-C₂₂), tal como semente de plantas e óleos de fruto (por exemplo, óleos de oliva, mamona, linhaça, sésamo, milho, amendoim, girassol, semente de uva, girassol, algodão, soja, colza, coco e semente de palma), gorduras de origem animal (por exemplo, sebo de carne de boi, sebo de carne de porco, banha de porco, óleo de fígado de bacalhau, óleo de peixe), e misturas destes. Diluentes líquidos também incluem ácidos graxos

alquilados (por exemplo, metilado, etilado, butilado) em que os ácidos graxos podem ser obtidos por hidrólise de ésteres de glicerol a partir de fontes vegetal e animal, e podem ser purificados por destilação. Diluentes líquidos típicos são descritos em Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

[00182] As composições sólidas e líquidas da presente invenção frequentemente incluem um ou mais agentes tensoativos. Quando adicionados a um líquido, agentes tensoativos (também conhecidos como "agentes de atividade superficial") geralmente modificam-se, a maioria frequentemente reduz a tensão superficial dos líquidos. Dependendo da natureza dos grupos hidrofílicos e lipofílicos em uma molécula de agente tensoativo, agentes tensoativos podem ser usados como agentes umectantes, dispersantes, emulsificantes ou agentes desespumantes.

[00183] Agentes tensoativos podem ser classificados como não iônico, aniônico ou catiônico. Agentes tensoativos não iônicos usados para as presentes composições incluem, mas sem limitações, álcool alcoxilado tal como álcool alcoxilado com base em álcoois naturais e sintéticos (que podem ser ramificados ou lineares) e preparados a partir dos álcoois e óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou misturas destes; amina etoxilada, alcanolamidas e alcanolamidas etoxilada; triglicerídeos alcoxilados tal como soja etoxilada, óleos de mamona e colza; alquilfenol alcoxilado tal como octilfenol etoxilado, nonilfenol etoxilado, dinonilfenol etoxilado e dodecilfenol etoxilado (preparados a partir dos fenóis e óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou misturas destes); polímeros de bloco preparados a partir de óxido de etileno ou óxido de polímeros bloco reversos onde os blocos terminais são preparados a partir de óxido de ácidos graxos etoxilados, ésteres e óleos graxos etoxilados; ésteres metílicos etoxilados; tristirilfenol etoxilado (incluindo aqueles preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou misturas destes); ésteres de ácido

graxo, ésteres de glicerol, derivados a base de lanolina, ésteres polietoxilados tais como ésteres de ácido graxo de sorbitano polietoxilados, ésteres de ácido graxo de sorbitol polietoxilados e ésteres de ácido graxo de glicerol polietoxilados; outros derivados de sorbitano tal como ésteres de sorbitano; agentes tensoativos poliméricos tal como copolímeros aleatórios, copolímeros bloco, resinas peguiladas (polietilenoglicol), polímeros de enxerto ou *comb* e polímeros estrelas; polietilenos glicóis (*pegs*); ésteres de ácido graxo de polietilenoglicol; agentes tensoativos a base de silicone; e derivados de açúcar tais como ésteres de sacarose, poliglicosídeos de alquila e polissacarídeos de alquila.

[00184] Os agentes tensoativos aniônicos usados incluem, mas sem limitações, ácidos sulfônicos alquilarila e seus sais; álcool carboxilado ou alquilfenol etoxilado; derivados de sulfonato de difenila; lignina e derivados de lignina tais como lignossulfonatos; ácidos maléico ou succínico ou seus anidretos; sulfonatos de olefina; ésteres de fosfato tais como ésteres de fosfato de álcool alcoxilado, ésteres de fosfato de alquilfenol alcoxilado e ésteres de fosfato de estiril fenol etoxilado; agentes tensoativos a base de proteína; derivados de sarcosina; sulfato de éter fenol estearílico; 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 tal como *N-N*-alquilauros; sulfonatos de benzeno, comento, tolueno, xileno, e dodecila e tridecilbenzenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno e naftaleno de alquila; sulfonatos de petróleo fracionado; sulfosuccinamatos; e sulfosuccinatos e seus derivados tais como sais de sulfosuccinato de dialquila.

[00185] Os agentes tensoativos catiônicos usados incluem, mas sem limitações, amidas e amidas etoxiladas; aminas tal como *N*-alquilpropanodiaminas, tripropilenotriaminas e dipropilenotetraminas, e aminas

etoxilada etoxiladas, diaminas e aminas propoxiladas (preparadas a partir das aminas e óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou misturas destes); sais de amina tais como acetatos de amina e sais de diamina; sais amônio quaternários tal como sais quaternários, sais quaternários etoxilados e sais diquaternários; e óxidos de amina tais como óxidos alquildimetilamina e óxidos de bis-(2-hidroxietil)-alquilamina.

[00186] Também usados para as presentes composições são misturas de agentes tensoativos não iônico e aniônico ou misturas de agentes tensoativos não iônico e catiônico. Os agentes tensoativos não iônico, aniônico e catiônico e seus usos recomendados são revelados em uma variedade de referências publicadas incluindo *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; and A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

[00187] Composições desta invenção podem também conter auxiliares e aditivos da formulação, conhecidos pelos versados na tecnologia como auxiliares de formulação (alguns dos quais podem também funcionar como diluentes sólidos, diluentes líquidos ou agentes tensoativos). Tais auxiliares e aditivos da formulação podem controlar: pH (tampões), espumamento durante o processamento (antiespumas como poliorganossiloxanos), sedimentação de ingredientes ativos (agentes de suspensão), viscosidade (espessantes tixotrópicos), crescimento microbiano em recipiente (antimicrobianos), congelamento do produto (anticongelantes), cor (dispersões de corantes/pigmentos), desbotamento (agentes formadores ou de engomamento de filme), evaporação (retardantes de evaporação), e outros atributos da formulação. Formadores de filme incluem, por exemplo, acetatos

de polivinila, copolímeros de acetato de polivinila, copolímero de acetato de vinil polivinilpirrolidona, álcoois polivinílicos, copolímeros de álcool polivinílico e ceras. Exemplos de auxiliares e aditivos da formulação incluem aquela listada em *McCutcheon 's Volume 2: Functional Materials*, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; and PCT Publication WO 03/024222.

[00188] O composto da Fórmula 1 e quaisquer outros ingredientes ativos são tipicamente incorporados nas presentes composições dissolvendo-se o ingrediente ativo em um solvente ou moendo-se em um diluente líquido ou seco. Soluções, incluindo concentrados emulsificáveis, podem ser preparadas simplesmente misturando-se os ingredientes. Se o solvente de uma composição líquida visada para uso como um concentrado emulsificável for miscível em água, um emulsificador é tipicamente adicionado para emulsificar o solvente contendo ativo mediante diluição com água. As lamas de ingrediente ativo, com diâmetros de partícula de até 2.000 µm podem ser moídas molhadas usando moinhos de meio para obter partículas com diâmetros médios abaixo de 3 µm. As lamas aquosas podem ser feitas em concentrados de suspensão finalizada (ver, por exemplo, patente U.S. n.º 3.060.084) ou processadas adicionalmente por secagem por aspersão para formar grânulos dispersíveis em água. Formulações secas normalmente exigem processos de moagem a seco, que produz diâmetros médios de partícula na faixa de 2 a 10 µm. Poeiras e pós podem ser preparados por misturas e normalmente moagem (tal como com um moinho de martelo ou moinho de energia de fluido). Grânulos e pelotas podem ser preparados aspergindo o material ativo mediante veículos granulares realizados ou por técnicas de aglomeração. Ver Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963,

páginas 8-57 e seguinte, e WO 91/13546. *Pellets* podem ser preparados da maneira descrita em U.S. 4.172.714. Dispersíveis em água e solúveis em água grânulos podem ser preparados da maneira preceituada em U.S. 4.144.050, U.S. 3.920.442 e DE 3.246.493. Comprimidos podem ser preparados da maneira preceituada em U.S. 5.180.587, U.S. 5.232.701 e U.S. 5.208.030. Filmes podem ser preparados da maneira preceituada em GB 2.095.558 e U.S. 3.299.566.

[00189] Para informação adicional com relação à tecnologia de formulação, ver T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Ambiente Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. Ver também U.S. 3.235.361, Col. 6, linha 16 até Col. 7, linha 19 e Exemplos 10-41; U.S. 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; U.S. 2.891.855, Col. 3, linha 66 até Col. 5, linha 17 e Exemplos 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; and *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

[00190] Nos Exemplos seguintes, todas as porcentagens são em peso e todas as formulações são preparadas de maneira convencional. Os números do composto referem-se a compostos em Tabelas de Índice A-G. Sem elaboração adicional, acredita-se que versados na tecnologia usando as descrições anteriores podem utilizar a presente invenção em toda sua abrangência. Os Exemplos seguintes, portanto, devem ser considerados meramente ilustrativos, e não limitantes da revelação de uma

qualquer maneira que seja. Porcentagens são em peso, exceto onde de outra forma indicada.

Exemplo A

Concentrado de alta intensidade

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

Exemplo B

Pó Molhável

Composto 3	65,0%
Éter de polietileno glicol dodecilfenol	2,0%
Ligninossulfonato de sódio	4,0%
Silicoaluminato de sódio	6,0%
Montmorilonita (calcinação)	23,0%

Exemplo C

Grânulo

Composto 11	10,0%
Grânulos de atapulgita (matéria baixo volátil 0,71/0,30 mm U.S.S peneiras n.º 25-50)	90,0%

Exemplo D

Pellet extrusado

Composto 17	25,0%
Sulfato de sódio anidro	10,0%
Ligninossulfonato de cálcio bruto	5,0%
Alquilnaftalenosulfonato de sódio	1,0%
Bentonita cálcio/magnésio	59,0%

Exemplo E**Concentrado Emulsificável**

Composto 18	10,0%
Hexaoleato de polioxietileno sorbitol	20,0%
Éster metílico de ácido graxo C ₆ -C ₁₀	70,0%

Exemplo F**Microemulsão**

Composto 19	5,0%
Copolímero de acetato de vinil polivinilpirrolidona	30,0%
Alquilpoliglicosídeo	30,0%
Monoleato de glicerila	15,0%
Água	20,0%

Exemplo G**Tratamento de Semente**

Composto 26	20,00%
Copolímero de acetato de vinil polivinilpirrolidona	5,00%
Cera de lignite	5,00%
Ligninossulfonato de cálcio	1,00%
Copolímeros bloco de polioxietileno/polioxipropileno	1,00%
Álcool estearílico (POE 20)	2,00%
Poliorganossilano	0,20%
Pigmento vermelho corante	0,05%
Água	65,75%

Exemplo H**Bastão fertilizante**

Composto 28	2,5%
Copolímero de pirrolidona-estireno	4,8%
Tristirilfenil 16-etoxilato	2,3%
Talco	0,8%
Amido de milho	5,0%
Fertilizante de liberação lenta 15-9-15	36,0%
Permanente Nitrophoska® (BASF)	
Caulim	38,0%
Água	10,6%

Exemplo I**Concentrado de alta intensidade**

Composto 37	98,5%
Sílica aerogel	0,5%
Sílica fina amorfa sintética	1,0%

Exemplo J**Pó Molhável**

Composto 40	65,0%
éter de polietileno glicol dodecilfenol	2,0%
Ligninossulfonato de sódio	4,0%
Silicoaluminato de sódio	6,0%
Montmorilonita (calcinação)	23,0%

Exemplo K**Grânulo**

Composto 49	10,0%
Grânulos de atapulgita (matéria baixo volátil)	90,0%

0,71/0,30 mm

U.S.S peneiras no. 25-50)

Exemplo L**Pellet extrusado**

Composto 52	25,0%
Sulfato de sódio anidro	10,0%
Ligninossulfonato de cálcio bruto	5,0%
Alquilnaftalenosulfonato de sódio	1,0%
Bentonita cálcio/magnésio	59,0%

Exemplo M**Concentrado Emulsificável**

Composto 62	10,0%
Hexaoleato de polioxietileno sorbitol	20,0%
Éster metílico de ácido graxo C ₆ -C ₁₀	70,0%

Exemplo N**Microemulsão**

Composto 66	5,0%
Copolímero de acetato de vinil polivinilpirrolidona	30,0%
Alquilpoliglicosídeo	30,0%
Monoleato de glicerila	15,0%
Água	20,0%

Exemplo O**Tratamento de Semente**

Composto 94	20,00%
Copolímero de acetato de vinil polivinilpirrolidona	5,00%
Cera de lignite	5,00%

Ligninossulfonato de cálcio	1,00%
Copolímeros bloco de polioxietileno/polioxipropileno	1,00%
Álcool estearílico (POE 20)	2,00%
Poliorganossilano	0,20%
Pigmento vermelho corante	0,05%
Água	65,75%

Exemplo P

Bastão fertilizante

Composto 95	2,5%
Copolímero de pirrolidona-estireno	4,8%
Tristirilfenil 16-etoxilato	2,3%
Talco	0,8%
Amido de milho	5,0%
Fertilizante de liberação lenta 15-9-15	36,0%
Permanente Nitrophoska® (BASF)	
Caulim	38,0%
Água	10,6%

[00191] Compostos desta invenção apresentam atividade contra um amplo espectro de pragas de invertebrados. Estas pragas incluem invertebrados que habitam uma variedade de ambientes tais como, por exemplo, folhagem de plantas, raízes, solo, plantações colhidas ou outros gêneros alimentícios, estruturas de construção ou tegumentos animais. Estas pragas incluem, por exemplo, alimentação de invertebrados em folhagem (incluindo folhas, caules, flores e frutos), sementes, madeira, fibras têxteis ou sangue ou tecidos de animal, e causando assim lesão ou dano, por exemplo, a plantações agrônômicas em crescimento ou armazenados, silvicultura, plantações domésticas, plantas ornamentais, sementeiras, gêneros alimentícios ou produtos

de fibra armazenados, ou casas ou outras estruturas ou seus conteúdos, ou sendo prejudicial a saúde animal ou saúde pública. Versados na tecnologia perceberão que nem todos os compostos são igualmente efetivos contra todos os estágios de crescimento de todas as pragas.

[00192] Estes presentes compostos e composições são assim usados agronomicamente para proteger plantações em campo de pragas invertebradas fitófagas, e também não agronomicamente para proteger outras plantações de hortaliças e plantas das pragas de invertebrados fitófagas. Esta utilidade inclui proteger as plantações e outras plantas (isto é, tanto agrônomo quanto não agrônomo) que contêm material genético introduzido por engenharia genética (isto é, transgênica) ou modificada por mutagênese para fornecer traços vantajosos. Exemplos de tais traços incluem tolerância a herbicidas, resistência a pragas de fitófago (por exemplo, insetos, ácaros, afídios, aranhas, nemátodos, caracóis, fungo patogênico de planta, bactéria e vírus), maior crescimento da planta, maior tolerância de crescimento adverso condições tais como temperaturas altas ou baixas, baixa ou alta umidade do solo, e alta salinidade, maior florescimento ou frutificação, maior rendimento de colheita, maturação mais rápida, maior florescimento e frutificação e/ou produto colhido de maior valor nutritivo, ou melhores propriedades de armazenamento ou processo do produto colhido. Plantas transgênicas podem ser modificadas para expressar múltiplos traços. Exemplos de plantas contendo traços fornecidos pela engenharia genética ou mutagênese incluem variedades de milho, algodão, soja e batata que expressam um toxina inseticida de *Bacillus thuringiensis* tais como YELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® e NEWLEAF®, e variedades tolerantes a herbicida de milho, algodão, soja e colza tal como ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI, STS e CLEARFIELD, bem como plantações que expressam *N*-acetiltransferase (GAT) para fornecer resistência ao herbicida glifosato, ou

plantações contendo o gene HRA fornecendo resistência a herbicidas que inibem sintase de acetolactato (ALS). Os presentes compostos e composições podem interagir sinergicamente com traços introduzidos por engenharia genética ou modificados por mutagênese, aumentando assim a expressão ou eficiência fenotípica dos traços ou aumentando a eficiência do controle de praga de invertebrados dos presentes compostos e composições. Em particular, os presentes compostos e composições podem interagir sinergicamente com a expressão fenotípica de proteínas ou outros produtos naturais tóxicos para pragas de invertebrados para fornecer um controle maior do que o aditivo destas pragas.

[00193] Composições desta invenção podem também opcionalmente compreender nutrientes vegetais, por exemplo, uma composição fertilizante compreendendo pelo menos um nutriente da planta selecionado de nitrogênio, fósforo, potássio, enxofre, cálcio, magnésio, ferro, cobre, boro, manganês, zinco, e molibdênio. De nota são composições compreendendo pelo menos uma composição fertilizante compreendendo pelo menos um nutriente de planta selecionado de nitrogênio, fósforo, potássio, enxofre, cálcio e magnésio. Composições da presente invenção que compreendem adicionalmente pelo menos uma planta nutriente pode ser na forma de líquido ou sólido. De nota são formulações sólidas na forma de grânulos, pequenos bastões ou comprimidos. Formulações sólidas compreendendo uma composição fertilizante podem ser preparadas misturando-se o composto ou composição da presente invenção com a composição fertilizante junto com ingredientes de formulação e então preparar a formulação por métodos tais como granulação ou extrusão. Alternativamente, formulações sólidas podem ser preparadas aspergindo uma solução ou suspensão de um composto ou composição da presente invenção em um solvente volátil em uma composição fertilizante preparada previamente na

forma de misturas dimensionalmente estáveis, por exemplo, grânulos, pequenos bastões ou comprimidos, e em seguida evaporando-se o solvente.

[00194] Exemplos de pragas de invertebrados agronômicas ou não agronômicas incluem ovos, larvas e adultos da ordem Lepidoptera, tais como lagartas de cereais, lagarta-rosca, mandruvá e lagarta da maçã na família Noctuidae (por exemplo, broca da haste rosa (*Sesamia inferens* Walker), broca do caule de cereal (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), lagarta de cereais do sul (*Spodoptera eridania* Cramer), lagarta-do-cartucho (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), lagarta de raiz de beterraba (*Spodoptera exigua* Hübner), lagarta de algodão (*Spodoptera littoralis* Boisduval), lagartas *Spodoptera ornithogalli* Guenee, lagarta-rosca (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), lagarta da soja (*Anticarsia gemmatalis* Hübner), lagarta do tomate (*Lithophane antennata* Walker), lagarta de cereais (*Barathra brassicae* Linnaeus), lagarta broca de soja (*Pseudoplusia includens* Walker), broca de repolho (*Trichoplusia ni* Hübner), lagarta da maçã do algodoeiro (*Heliothis virescens* Fabricius)); brocas, lagartas de casulo, lagartas de teias, lagartas roscas, lagarta de repolho e algodoeiro do mato da família Pyralidae (por exemplo, braca de cereal Europeu (*Ostrinia nubilalis* Hübner), lagarta da laranja-baía (*Amyelois transitella* Walker), lagarta de casulo de raiz de milho (*Crambus caliginosellus* Clemens), lagartas de casulo de grama (Pyralidae: *Crambinae*) tal como lagarta de grama (*Herpeto gramma licarsisalis* Walker), broca do caule de cana de açúcar (*Chilo infuscatellus* Snellen), broca do tomate pequeno (*Neoleucinodes elegantalis* Guenee), lagarta enroladeira da folha verde (*Cnaphalocerus medinalis*), lagarta enroladeira de parreira (*Desmia funeralis* Hübner), lagarta do melão (*Diaphania nitidalis* Stoll), lagarta do centro do repolho (*Helluala hydralis* Guenee), broca da haste amarela (*Scirpophaga incertulas* Walker), broca da cana de açúcar precoce (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), broca do caule branco (*Scirpophaga innotata* Walker), broca do caule superior

(*Scirpophaga nivella* Fabricius), broca do arroz de cabeça escura (*Chilo polichrysus* Meyrick), broca de agrupamento de repolho (*Crocidolomia binotalis* English)); lagartas enroladeiras, lagartas de brotos, lagarta de semente, e lagartas de frutas na família Tortricidae (por exemplo, traça de maçã (*Cydia pomonella* Linnaeus), lagarta de parreira (*Endopiza viteana* Clemens), lagarta de fruta oriental (*Grapholita molesta* Busck), falsa traça de frutos cítricos (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), broca de frutos cítricos (*Ecdytolopha aurantiana* Lima), lagarta enroladeira vermelha (*Argyrotaenia velutinana* Walker), lagarta enroladeira (*Choristoneura rosaceana* Harris), mariposa da maçã marrom claro (*Epiphyas postvittana* Walker), mariposa de videira européia (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), mariposa de botão de maçã (*Pandemis pyrusana* Kearfott), lagarta enroladeira onívora (*Platynota stultana* Walsingham), tortrix de árvore frutífera listrada (*Pandemis cerasana* Hübner), tortrix marrom da maçã (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); e muitos outros lepidópteros economicamente importantes (por exemplo, traça das crucíferas (*Plutella xylostella* Linnaeus), lagarta enroladeira rosa (*Pectinophora gossypiella* Saunders), mariposa cigana (*Lymantria dispar* Linnaeus), broca do pessegueiro (*Carposina niponensis* Walsingham), broca do broto do pessegueiro (*Anarsia lineatella* Zeller), lagarta enroladeira da batata (*Phthorimaea operculella* Zeller), minador do citro teniforme pontual (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), minador da maçã asiática (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), lagarta enroladeira do arroz (*Lerodea eufala* Edwards), minador da maçã (*Leucoptera scitella* Zeller)); ovos, ninfas e adultos da ordem Blattodea incluindo baratas das famílias Blattellidae e Blattidae (por exemplo, barata oriental (*Blatta orientalis* Linnaeus), barata asiática (*Blattella asahinai* Mizukubo), barata alemã (*Blattella germanica* Linnaeus), barata marrom listrada (*Supella longipalpa* Fabricius), barata americana (*Periplaneta americana* Linnaeus), barata marrom (*Periplaneta brunnea* Burmeister), barata da madeira

(*Leucophaea maderae* Fabricius)), barata marrom esfumada (*Periplaneta fuliginosa* Service), barata australiana (*Periplaneta australasiae* Fabr.), barata lagosta (*Nauphoeta cinerea* Olivier) e barata lisa (*Symploce pallens* Stensens)); ovos, alimentação foliar, alimentação de frutos, alimentação da raiz, alimentação da semente e alimentação de tecido vesicular de larvas e adultos da ordem Coleoptera incluindo gorgulhos das famílias Anthribidae, Bruchidae, e Curculionidae (por exemplo, gorgulho de algodão (*Anthonomus grandis* Boheman), gorgulho de água de arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), gorgulho de celeiro (*Sitophilus granarius* Linnaeus), gorgulho de arroz (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), gorgulho de ervas daninhas anuais (*Listronotus maculicollis* Dietz), curculionídeos de gramíneas (*Sfenophorus parvulus* Gyllenhal), curculionídeo de caça (*Sfenophorus venatus vestitus*), curculionídeo de Denver (*Sfenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); pulgas, besouro de pepino, lagarta de raízes, besouro de folha, besouro de batata, e minadores da família Chrysomelidae (por exemplo, besouro da batata do Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), lagarta de cereais do leste (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); besouros da família Scarabaeidae (por exemplo, besouro japonês (*Popillia japonica* Newman), besouro oriental (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), escaravelho marcarado do norte (*Ciclocephala borealis* Arrow), escaravelho mascarado do sul (*Ciclocephala immaculata* Olivier ou *C. lurida* Bland), besouro de esterco e larva branca (*Aphodius* spp.), ataenius de gramado preto (*Ataenius spretulus* Haldeman), besouro de junho verde (*Cotinis nitida* Linnaeus), besouro de jardim asiático (*Maladera castanea* Arrow), besouros de maio/junho (*Phyllophaga* spp.) e escaravelho europeu (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); besouros de tapete da família Dermestidae; larvas de eraterídeos da família Elateridae; besouros de casca de árvore da família Scolytidae e besouros de farinha da família Tenebrionidae. Além disso, pragas agrônômicas e não agrônômicas incluem:

ovos, adultos e larvas da ordem Dermaptera incluindo lacrainhas da família Forficulidae (por exemplo, lacrainha européira (*Forficula auricularia* Linnaeus), lacrainha preta (*Chelisoche mono* Fabricius)); ovos, imaturos, adultos e ninfas da ordem Hemiptera e Homoptera tais como, bichos de planta da família Miridae, cicadas da família Cicadidae, cigarrinhas (por exemplo, *Empoasca* spp.) da família Cicadellidae, percevejos (por exemplo, *Cimex lectularius* Linnaeus) da família Cimicidae, cigarrinhas verdes das famílias Fulgoroidea e Delphacidae, cigarrinhas de árvores da família Membracidae, psilides da família Psyllidae, moscas brancas da família Aleyrodidae, afídios da família Aphididae, filoxera da família Phylloxeridae, insetos de alimentos da família Pseudococcidae, cochonilhas das famílias Coccidae, Diaspididae e Margarodidae, percevejos de renda da família Tingidae, percevejos fitófagos da família Pentatomidae, percevejos comuns (por exemplo, percevejo cabeludo (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) e percevejo do sul (*Blissus insularis* Barber)) e outros percevejos de semente da família Lygaeidae, percevejos de saliva da família Cercopidae, percevejos de andorinha da família Coreidae, e percevejos vermelhos e manchadores de algodão da família Pyrrhocoridae. Também são incluídos ovos, larvas, ninfas e adultos da ordem Acari (ácaros), tal como ácaros de aranha e ácaros vermelhos na família Tetranychidae (por exemplo, ácaro vermelho europeu (*Panonychus ulmi* Koch), ácaro de aranha de duas manchas (*Tetranychus urticae* Koch), ácaro McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); ácaros chatos na família Tenuipalpidae (por exemplo, ácaros chatos cítricos (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); ácaros de ferrugem e de botão na família Eriophyidae e outros ácaros de alimentação foliar e ácaros importantes na saúde humana e animal, isto é, ácaros de poeira na família Epidermoptidae, ácaros de folículo na família Demodicidae, ácaros de grão na família Glycyphagidae; carrapatos na família Ixodidae, comumente conhecidos como carrapatos duros (por exemplo, carrapato de veado (*Ixodes scapularis*

Say), carrapato da paralisia australiana (*Ixodes holocyclus* Neumann), carrapato do cão americano (*Dermacentor variabilis* Say), carrapato da estrela solitária (*Amblyomma americanum* Linnaeus), carrapato vermelho do cão (*Rhipicephalus sanguineus*) e carrapatos de bovinos (por exemplo, *Rhipicephalus annulatus* e *Rhipicephalus microplus*), e carrapatos na família Argasidae, comumente conhecidos como carrapatos macios (por exemplo, carrapato da febre recorrente (*Ornithodoros turicata*), carrapato de ave comum (*Argas radiatus*)); ácaros de sarna e comichão nas famílias Psoroptidae, Pyemotidae, e Sarcoptidae; ovos, adultos e imaturos da ordem Orthoptera, incluindo gafanhotos, grilos e cigarras (por exemplo, gafanhotos migratórios (por exemplo, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differ entialis* Thomas), gafanhotos americanos (por exemplo, *Schistocerca americana* Drury), grilo do deserto (*Schistocerca gregaria* Forskal), grilo migratório (*Grilloa migratoria* Linnaeus), grilo de arbusto (*Zonocerus* spp.), cigarra de casa (*Acheta domesticus* Linnaeus), cigarras de mancha (por exemplo, cigarra de mancha amarelo-castanha (*Scapteriscus vicinus* Scudder) e cigarra de mancha do sul (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); ovos, adultos e imaturos da ordem Diptera, incluindo insetos (por exemplo, *Liriomyza* spp., tal como inseto vegetal de serpentina (*Liriomyza sativae* Blanchard)), mosquitos-pólvora, moscas de fruta (Tephritidae), moscas de vidro poroso (por exemplo, *Oscinella frit* Linnaeus), vermes do solo, moscas caseiras (por exemplo, *Musca domestica* Linnaeus), moscas caseiras inferiores (por exemplo, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), moscas de cavalariis (por exemplo, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), moscas da face, moscas de chifre, moscas de vento (por exemplo, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), e outra pragas de mosca mucosóide, moscas de cavalo (por exemplo, *Tabanus* spp.), moscas do agreste (por exemplo, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), bernes de gado (por exemplo, *Hypoderma* spp.), moscas de veado (por exemplo, *Chrysops* spp.), piolho (por exemplo,

Melophagus ovinus Linnaeus) e outros Brachycera, mosquitos (por exemplo, *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*), moscas pretas (por exemplo, *Prosimulium spp.*, *Simulium spp.*), mosquitos-pólvora que picam, moscas de areia, sciarídeos e outros Nematocera; ovos, adultos e imaturos da ordem Thysanoptera, incluindo larvas de cebola (*Thrips tabaci* Lindeman), larvas de flor (*Frankliniella spp.*), e outros larvas de alimentação foliar; pragas de inseto da ordem Hymenoptera, incluindo formigas da Família Formicidae, incluindo a formiga de carpinteiro da flórida (*Camponotus floridanus* Buckley), formiga de carpinteiro vermelha (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), formiga de carpinteiro preta (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), formiga de pés brancos (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), formigas de cabeça grande (*Feidole sp.*), formiga fantasma (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); formiga do faraó (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), formiga de chama pequena (*Wasmannia auropunctata* Roger), formiga de chama (*Solenopsis geminata* Fabricius), formiga de chama importada vermelha (*Solenopsis invicta* Buren), formiga argentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), formiga louca (*Paratrechina longicornis* Latreille), formiga de pavimentação (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), formiga de campo de milho (*Lasius alienus* Förster) e percevejo (*Tapinoma sessile* Say). Outros Hymenoptera, incluindo abelhas (incluindo abelhas de carpinteiro), vespas, jaquetas amarelas, vespas e insetos (*Neodiprion spp.*; *Cephus spp.*); pragas de inseto da ordem Isoptera, incluindo terácáros nas famílias Termitidae (por exemplo, *Macrotermes sp.*, *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (por exemplo, *Cryptoterm.es sp.*), e Rhinotermitidae (por exemplo, *Reticulitermes sp.*, *Coptotermes sp.*, *Heterotermes tenuis* Hagen), o cupim subterrâneo oriental (*Reticulitermes flavipes* Kollar), cupim subterrâneo ocidental (*Reticulitermes hesperus* Banks), cupim subterrâneo Formosan (*Coptotermes formosanus* Shiraki), cupim de madeira seca do oeste da Índia (*Incisitermes immigrans* Snyder), cupim de poste de força

(*Cryptotermes brevis* Walker), cupim de madeira seca (*Incisitermes snyderi* Light), cupim subterrâneo do sudeste (*Reticulitermes virginicus* Banks), cupim de madeira seca ocidental (*Incisitermes minor* Hagen), cupins de árvores, tal como *Nasutitermes* sp. e outros cupins de importância econômica, pragas de inseto da ordem Thysanura, tal como traça (*Lepisma saccharina* Linnaeus) e traça do livro (*Thermobia domestica* Packard); pragas de inseto da ordem Mallophaga e incluindo o piolho de cabeça (*Pediculus humanus capitis* De Geer), piolho de corpo (*Pediculus humanus* Linnaeus), piolho do corpo de galinha (*Menacanthus straminaus* Nitzsch), piolho do cão (*Trichodectes canis* De Geer), piolho de penugem (*Goniocotes gallinae* De Geer), piolho do corpo de ovelha (*Bovicola ovis* Schrank), piolho do gado de nariz curto (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), piolho do gado de nariz comprido (*Linognathus vituli* Linnaeus) e outros piolhos parasitas que sugam, chupam e atacam homens e animais; pragas de inseto da ordem Siphonoptera, incluindo a pulga do rato oriental (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), pulga do gato (*Ctenocephalides felis* Bouche), pulga do cão (*Ctenocephalides canis* Curtis), pulga da galinha (*Ceratophyllus gallinae* Schrank, *Echidnophaga gallinacea* Westwood), pulga humana (*Pulex irritans* Linnaeus) e outras pulgas que afligem mamíferos e aves. Pragas artrópodes cobertas incluem ainda: aranhas na ordem Araneae, tal como aranha marrom solitária (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) e a aranha viúva negra (*Latrodectus mactans* Fabricius), e centípodas na ordem Scutigleromorpha, tal como a centopéia de casa (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus). Compostos da presente invenção também têm atividade nos membros das Classes Nematoda, Cestoda, Trematoda, e Acanthocephala, incluindo membros economicamente importantes da ordem Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida, e Enoplida, tal como, mas sem limitações, pragas agrícolas economicamente importantes (isto é, nemátodes de nó de raiz no gênero *Meloidogyne*, nemátodes de lesão no

gênero *Pratylenchus*, nemátodos de raiz curta e grossa no gênero *Trichodorus*, etc.) e pragas para saúde animal e humana (isto é, todos os fascíolas, tênias, e nemátodos economicamente importantes, tal como *Strongylus vulgaris* em cavalos, *Toxocara canis* em cães, *Haemonchus contortus* em ovelhas, *Dirofilaria immitis* Leidy em cães, *Anoplocephala perfoliata* em cavalos, *Fasciola hepatica* Linnaeus em ruminantes, etc.).

[00195] Compostos da invenção apresentam particularmente alta atividade contra pragas na ordem Lepidoptera (por exemplo, *Alabama argillacea* Hübner (verme de folha de algodão), *Archips argyrospila* Walker (traça de árvore frutífera), *A. rosana* Linnaeus (traça Européia) e outros *Archips species*, *Chilo suppressalis* Walker (broca do caule de arroz), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (traça de folha de arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (lagarta de raiz de cereal), *Crambus teterrellus* Zincken (lagarta de gramíneas), *Cydia pomonella* Linnaeus (traça de maçã), *Earias insulana* Boisduval (lagarta espinhenta de algodoeiro), *Earias vittella* Fabricius (lagarta manchada), *Helicoverpa armigera* Hübner (lagarta americana), *Helicoverpa zea* Boddie (larva de traça de cereal), *Heliothis virescens* Fabricius (larva de traça do tabaco), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (besouro de grama), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (traça de baga-de-uva), *Pectinophora gossypiella* Saunders (lagarta rosa), *Phyllocnistis citrella* Stainton (insetos cítricos), *Pieris brassicae* Linnaeus (borboleta branca grande), *Pieris rapae* Linnaeus (borboleta branca pequena), *Plutella xylostella* Linnaeus (traça do diamante negro), *Spodoptera exigua* Hübner (larva de beterraba), *Spodoptera litura* Fabricius (lagarta de tabaco, lagarta de cardume), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (lagarta-do-cartucho), *Trichoplusia ni* Hübner (lagarta de repolho) e *Tuta absoluta* Meyrick (inseto de tomate)).

[00196] Compostos da invenção também têm atividade significativa nos membros da ordem Homoptera incluindo: *Acyrtosiphon pisum*

Harris (afídio de pera), *Aphis craccivora* Koch (afídio de fruta-do-conde), *Aphis fabae* Scopoli (afídio de feijão preto), *Aphis gossypii* Glover (afídio de algodão, afídio de melão), *Aphis pomi* De Geer (afídio de maçã), *Aphis spiraeicola* Patch (afídio de erva), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (afídio de dedal), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (afídio de morango), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (afídio de trigo russo), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (afídio de maçã rosada), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (afídio de maçã crespa), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (afídio de ameixa insípido), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (afídio de nabo), *Metopolophium dirrhodum* Walker (afídio de cereal), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (afídio de batata), *Myzus persicae* Sulzer (afídio de pêssego-batata, afídio de pêssego verde), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (afídio de alface), *Pemphigus* spp. (afídios de raiz e afídios de vesícula), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (afídio de folha de cereal), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (afídio de cereja de pássaro), *Schizaphis graminum* Rondani (inseto verde), *Sitobion avenae* Fabricius (afídio de grão inglês), *Therioaphis maculata* Buckton (afídio de alfafa manchada), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (afídios cítricos pretos), e *Toxoptera citricida* Kirkaldy (afídios cítricos marrons); *Adelges* spp. (adelgídeos); *Phylloxera devastatrix* Pergande (filoxera de noz-pecã); *Bemisia tabaci* Gennadius (mosca branca do tabaco, mosca branca de batata-doce), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (mosca branca), *Dialeurodes citri* Ashmead (mosca branca cítrica) e *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca branca de estufa); *Empoasca fabae* Harris (besouro de batata), *Laodelphax striatellus* Fallen (cigarrinhas marrom pequeno), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (besouro de áster), *Nephotettix cincticeps* Uhler (besouro verde), *Nephotettix nigropictus* Stal (besouro de arroz), *Nilaparvata lugens* Stal (cigarrinhas marrom), *Peregrinus maidis* Ashmead (cigarrinhas de cereal), *Sogatella furcifera* Horvath (cigarrinhas de costas brancas), *Sogatodes orizicola* Muir (delfacídeo de arroz), besouro de maçã

branca McAtee *Typhlocyba pomaria*, *Erythroneoura* spp. (cigarrinhas de uva); *Magacidada septendecim* Linnaeus (cigarra periódica); *Icerya purchasi* Maskell (piolho de costura de algodão), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (piolho de São José); *Planococcus citri* Risso (insetos cítricos); *Pseudococcus* spp. (outros insetos complexos); *Cacopsylla pyricola* Foerster (psilídeo de pera), *Trioza diospyri* Ashmead (psilídeo de caqui).

[00197] Compostos desta invenção também podem ter atividade nos membros da ordem Hemiptera incluindo: *Acrosternum hilare* Say (inseto fedorento verde), *Anasa tristis* De Geer (inseto de abóbora), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (inseto de pulga), *Cimex lectularius* Linnaeus (percevejo) *Corythuca gossypii* Fabricius (inseto da renda de algodão), *Cyrtopeltis modesta* Distant (inseto de tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schaffer (manchador de algodão), *Euchistus servus* Say (inseto fedorento marrom), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (inseto fedorento de uma mancha), *Graptosthetus* spp. (insetos de complexo de semente), *Leptoglossus corculus* Say (inseto de semente de pinha), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (inseto de planta manchada), *Nezara viridula* Linnaeus (inseto fedorento verde do sul), *Oebalus pugnax* Fabricius (inseto fedorento de arroz), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (inseto de serralha), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (predadores de algodão). Outras ordens de inseto controladas por compostos da invenção incluem Thysanoptera (por exemplo, *Frankliniella occidentalis* Pergande (larvas de flor ocidental), *Scirtothrips citri* Moulton (larvas cítricos), *Sericothrips variabilis* Beach (larvas de soja), e *Thrips tabaci* Lindeman (larvas de cebola); e a ordem Coleoptera (por exemplo, *Leptinotarsa decemlineata* Say (besouro da batata do Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (besouro de feijões mexicano) e larvas de eraterídeos do gênero *Agriotes*, *Athous* ou *Limonius*).

[00198] Note que alguns sistemas de classificação

contemporâneos colocam Homoptera como uma subordem na ordem Hemiptera.

[00199] Observa-se o uso dos compostos desta invenção para controlar mosca branca (*Bemisia argentifolii*). Observa-se o uso dos compostos desta invenção para controlar larvas de flor ocidental (*Frankliniella occidentalis*). Observa-se o uso dos compostos desta invenção para controlar besouro da batata (*Empoasca fabae*). Observa-se o uso dos compostos desta invenção para controlar cigarrinhas de cereal (*Peregrinus maidis*). Observa-se o uso dos compostos desta invenção para controlar afídio de melão de algodão (*Aphis gossypii*). Observa-se o uso dos compostos desta invenção para controlar afídio de pêsego verde (*Myzus persicae*). Observa-se o uso dos compostos desta invenção para controlar traça das crucíferas (*Plutella xylostella*). Observa-se o uso dos compostos desta invenção para controlar lagarta-do-cartucho (*Spodoptera frugiperda*).

[00200] Compostos desta invenção podem também ser misturados com um ou mais outros compostos ou agentes biologicamente ativos incluindo inseticidas, fungicidas, nematicidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, antídotos de herbicida, reguladores de crescimento tais como inibidores de muda de inseto e estimulantes de enraizamento, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, agentes de atração, feromônios, estimulantes de alimentação, outros compostos biologicamente ativos ou bactéria entomopatogênica, vírus ou fungos para formar um pesticida multicomponente dando ainda uma utilidade mais ampla de espectro de agrônômico e não agrônômico. Assim, a presente invenção também diz respeito a uma composição compreendendo um composto da Fórmula 1 (isto é, uma quantidade biologicamente efetiva), pelo menos um componente adicional selecionado do grupo que consiste em agentes tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos. Para misturas da presente invenção, os outros

compostos ou agentes biologicamente ativos podem ser formulados junto com os presentes compostos, incluindo os compostos da Fórmula 1, para formar uma pré-mistura, ou os outros compostos ou agentes biologicamente ativos podem ser formulados separadamente dos presentes compostos, incluindo os compostos da Fórmula 1, e as duas formulações combinadas juntas antes da aplicação (por exemplo, em um tanque de aspersão) ou, alternativamente, aplicadas em sucessão.

[00201] Exemplos de tais compostos ou agentes biologicamente ativos com cujos compostos desta invenção podem ser formulados são inseticidas tais como abamectina, acefato, acequinocil, acetamiprida, acrinatrina, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfós-metil, bifentrina, bifenazato, bistriflurom, borato, 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida, buprofezina, cadusafós, carbarila, carbofurano, cartape, carzol, clorantraniliprole, clorfenapir, clorfluazurom, clopirifós, clopirifós-metil, cromafenzida, clofentezina, clotianidina, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, gama-cialotrina, lambda-cialotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiurom, diazinon, dieldrina, diflubenzurom, dimeflutrina, dimehipo, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endossulfam, esfenvalerato, etiprole, etofenproxi, etoxazol, óxido de fenbutatina, fenotiocarbe, fenoxicarbe, fempropatrina, fenvalerato, fipronila, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, flufenerim, flufenoxurom, fluvalinato, tau-fluvalinato, fonofós, formetanato, fostiazato, halofenzida, hexaflumurom, hexitiazoxi, hidrametilnona, imidacloprido, indoxacabee, sabões inseticidas, isofenfós, lufenurom, malationa, metaflumizona, metaldeído, metamidofós, metidationa, metiodicarbe, metomil, metopreno, metoxicloro, metoflutrina, monocrotofós, metoxifenzida, nitenpiram, nitiazina, novalurom, noviflumumurom, oxamila,

parationa, parationa-metil, permetrina, forato, fosalona, fosmete, fosfamidona, pirimicarbe, profenofós, proflutrina, propargito, protrifenbuto, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridabem, piridalila, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifem, rotenona, rianodina, spinetoram, spinosad, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulprofós, tebufenozida, tebufenpirade, teflubenzurom, teflutrina, terbufós, tetraclorvinfós, tetrametrina, tiacloprido, tiametoxam, tiodicarbe, tiosultap-sódio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfom, triflumurom, *Bacillus thuringiensis* delta-endotoxinas, bactéria entomopatogênica, vírus entomopatogênico e fungos entomopatogênico.

[00202] De nota são inseticidas tais como abamectina, acetamiprida, acrinatrina, amitraz, avermectina, azadiractina, bifentrina, 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-*N*-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-1-*H*-pirazol-5-carboxamida, buprofezina, cadusafós, carbarila, cartape, clorantraniliprole, clorfenapir, clofirifós, clotianidina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, gama-cialotrina, lambda-cialotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endossulfam, esfenvalerato, etiprole, etofenproxi, etoxazol, fenotiocarbe, fenoxicarbe, fenvalerato, fipronil, flonicamida, flubendiamida, flufenoxurom, fluvalinato, formetanato, fostiazato, hexaflumurom, hidrametilnona, imidacloprido, indoxacarbe, lufenurom, metaflumizona, metiodicarbe, metomil, metopreno, metoxifenoizida, nitenpiram, nitiazina, novalurom, oxamila, pimetrozina, piretrina, piridabem, piridalila, piriproxifem, rianodina, spinetoram, spinosad, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, tebufenozida, tetrametrina, tiacloprido, tiametoxam, tiodicarbe, tiosultap-sódio, tralometrina, triazamato, triflumurom, *Bacillus thuringiensis* delta-endotoxinas, todas cepas de *Bacillus thuringiensis* e todas as cepas de vírus nucleopoliedro.

[00203] Uma modalidade de agentes biológicos para misturar

com compostos desta invenção inclui bactéria entomopatogênica tais como *Bacillus thuringiensis*, e delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* (por exemplo, Cellcap, MPV, MPVII); fungos entomopatogênico tal como o fungo muscaria verde; e vírus entomopatogênico (tanto de ocorrência natural quanto geneticamente modificados) incluindo baculovírus, vírus nucleopoliedro (NPV) tal como Helicoverpa zea nucleopoliedrovirus (HzNPV), Anagrafa falcifera nucleopoliedrovírus (AfNPV); e vírus granulosis (GV) tal como Cydia vírus pomonella granulosis (CpGV).

[00204] De particular nota é uma combinação como essa, onde o outro controle de praga de ingrediente ativo de invertebrado pertence a uma classe química diferente ou tem um sítio diferente de ação que o composto da Fórmula 1. Em certos casos, uma combinação com pelo menos um outro ingrediente ativo de controle de pragas invertebradas tendo um espectro similar de controle, mas um sítio diferente de ação será particularmente vantajoso para controle de resistência. Assim, uma composição da presente invenção pode compreender adicionalmente pelo menos um ingrediente ativo adicional de controle de pragas invertebradas tendo um espectro similar de controle, mas pertencendo a uma classe química diferente ou tendo um sítio diferente de ação. Estes compostos ou agentes biologicamente ativos adicionais incluem, mas sem limitações, moduladores do canal de sódio tais como bifentrina, cipermetrina, cialotrina, lambda-cialotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, deltametrina, dimeflutrina, esfenvalerato, fenvalerato, indoxacarbe, metoflutrina, proflutrina, piretrina e tralometrina; inibidores de colinesterase tais como clopirifós, metomil, oxamila, tiodicarbe e triazamato; neonicotinóides tais como acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprido, nitenpiram, nitiazina, tiacloprido e tiametoxam; inseticidas lactonas macrocíclicas tais como spinetoram, spinosad, abamectina, avermectina e emamectina; GABA (ácido γ -aminobutírico), antagonistas de canal controlado por cloreto tal como

avermectina ou bloqueadores tais como etiprole e fipronil; inibidores da síntese de quitina tais como buprofezina, ciromazina, flufenoxurom, hexaflumurom, lufenurom, novalurom, noviflumurom e triflumurom; miméticos hormônio juvenil tais como diofenolano, fenoxicarbe, metoprene e piriproxifem; agentes de ligação do receptor de octopamina tal como amitraz; inibidores de muda e agonistas de ecdisona tal como azadiractina, metoxifenoze e tebufenoze; agentes de ligação do receptor de rianodina tal como rianodina, diamidas antranílicas tal como clorantraniliprole (ver Patente U.S. 6.747.047, Publicações PCT WO 2003/015518 e WO 2004/067528) e flubendiamida (ver Patente U.S. 6.603.044); análogos de nereistoxina tal como cartape; inibidores de transportadora de elétron mitocondrial tal como clorfenapir, hidrametilnona e piridabem; inibidores de biossíntese de lipídio tais como espirodiclofeno e espiromesifeno; inseticidas ciclodieno tais como dieldrin ou endossulfan; piretróides; carbamatos; uréias inseticidas; e agentes biológicos incluindo vírus nucleopoliedro (NPV), membros de *Bacillus thuringiensis*, delta-endotoxinas encapsulado de *Bacillus thuringiensis*, e outros vírus inseticidas de ocorrência natural ou geneticamente modificados.

[00205] Exemplos de compostos ou agentes biologicamente ativo adicionais com cujos compostos desta invenção pode ser formulada são: fungicidas tais como acibenzolar, aldimorf, amisulbrom, azaconazol, azoxistrobina, benalaxila, benomila, bentiavalicarbe, bentiavalicarbe-isopropila, binomial, bifenila, bitertanol, blasticidin-S, mistura Bordeaux (sulfato de cobre tribásico), boscalide/nicobifeno, bromuconazol, bupirimato, butiobato, carboxina, carpropamid, captafol, captano, carbendazim, cloroneb, clorotalonila, clozolinato, clotrimazol, oxicloreto de cobre, sais de cobre tais como sulfato de cobre e hidróxido de cobre, ciazofamid, ciflunamid, cimoxanila, ciproconazol, ciprodinila, diclofluanid, diclocimet, diclomezina,

diclorano, dietofencarbe, difenoconazol, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazole-M, dinocape, discostrobina, ditianon, dodemorf, dodina, econazol, etaconazol, edifenfós, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fencaramid, fenfuram, fenexamida, fenoxanila, fencpiclonila, fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferfurazoato, ferimzona, fluazinam, fludioxonila, flumetover, fluopicolida, fluoxastrobina, fluquinconazol, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanila, flutriafol, folpet, fosetil-alumínio, fuberidazol, furalaxila, furametapir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalila, imibenconazol, iminoctadina, iodicarbe, ipconazol, iprobenfós, iprodiona, iprovalicarbe, isoconazol, isoprotilane, casugamicina, cresoxim-metílico, mancozeb, mandipropamida, maneb, mapanipirina, mefenoxam, mepronila, metalaxila, metconazol, metassulfocarbe, metiram, metominostrobin/fenominostrobin, mepanipirim, metrafenona, miconazol, miclobutanila, neo-asozin (metanoarsonato férrico), nuarimol, octilinona, ofurace, orisastrobina, oxadixila, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, paclobutrazol, penconazol, pencicurom, pentiopirad, perfurazoato, ácido fosfônico, ftalida, picobenzamid, picoxistrobina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarbe, cloridrato de propamocarbe, propiconazol, propineb, proquinazida, protioconazol, piraclostrobina, priazofós, pirifenox, pirimetanila, pirifenox, pirolnitrina, piroquilon, quinconazol, quinoxifen, quintozeno, siltiofam, simeconazol, espiroxamina, estreptomicina, enxofre, tebuconazol, tecrazeno, tecloftalam, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato, tiofanato-metil, tiram, tiadinila, tolclófósmetil, tolifluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazoxida, tridemorf, trimofamida, triciclazol, trifloxistrobina, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, vinclozolina, zineb, ziram, e zoxamide; nematócidos tais como aldicarbe, imiciafós, oxamila e fenamifós; bactericidas tal como

estreptomicina; acaricidas tais como amitraz, quinometionato, clorobenzilato, ciexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fempropatrina, fenpiroximato, hexitiazoxi, propargito, piridabem e tebufenpirade.

[00206] Em certos casos, combinações de um composto desta invenção com outros compostos ou agentes biologicamente ativos (particularmente controle de pragas invertebradas) (isto é, ingredientes ativos) podem resultar em um efeito maior do que o aditivo (isto é, sinérgico). Reduzir a quantidade de ingredientes ativos liberados no ambiente assegurando ao mesmo tempo o controle de praga efetivo é sempre desejável. Quando sinergismo de ingredientes ativos de controle de praga de invertebrados ocorre nas taxas de aplicação dando níveis agronomicamente satisfatórios de controle de pragas invertebradas, tais combinações podem ser vantajosas para reduzir o custo de produção da plantação e diminuir a carga ambiental.

[00207] Compostos desta invenção e composições destes podem ser aplicados a plantas geneticamente transformadas para expressar proteínas tóxicas para pragas invertebradas (tal como *Bacillus thuringiensis* delta-endotoxinas). Uma aplicação como essa pode fornecer um espectro mais amplo de proteção da planta e ser vantajoso para controle de resistência. O efeito dos compostos de controle de pragas invertebradas exogenamente aplicados desta invenção pode ser sinérgico com as proteínas de toxina expressa.

[00208] Referências gerais para esses protetores agrícolas (isto é, inseticidas, fungicidas, nematocidas, acaricidas, herbicidas e agentes biológicos) incluem *The Pesticide Manual*, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 e *The BioPesticide Manual*, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

[00209] Para modalidades onde um ou mais desses vários parceiros de mistura são usados, a razão em peso desses vários parceiros de mistura (no total) para o composto da Fórmula 1 é tipicamente entre cerca de 1:3.000 e cerca de 3.000:1. De nota são razões em peso entre cerca de 1:300 e cerca de 300:1 (por exemplo razões entre cerca de 1:30 e cerca de 30:1). Versados na tecnologia determinarão facilmente por meio de simples experimentação a quantidade biologicamente efetiva de ingredientes ativos necessária para o espectro desejado de atividade biológica.

[00210] Ficará evidente que incluir estes componentes adicionais pode expandir o espectro de pragas invertebradas controlado além do espectro controlado pelo composto da Fórmula 1 sozinho.

[00211] A Tabela A lista combinações específicas de um composto da Fórmula 1 com outros agentes de controle de pragas invertebradas ilustrativos das misturas, composições e métodos da presente invenção. A primeira coluna da Tabela A lista os agentes de controle de pragas invertebradas específico (por exemplo, "Abamectina" na primeira linha). A segunda coluna da Tabela A lista o modo de ação (se conhecido) ou classe química dos agentes de controle de pragas invertebradas. A terceira coluna da Tabela A lista a(s) modalidade(s) de faixas de razões em peso para taxas nas quais o agente de controle de pragas invertebradas pode ser aplicado com relação a um composto da Fórmula 1 (por exemplo, "50:1 a 1:50" de abamectina com relação a um composto da Fórmula 1 em peso). Assim, por exemplo, a primeira linha da Tabela A especificamente revela a combinação de um composto da Fórmula 1 com abamectina pode ser aplicado em uma razão em peso entre 50:1 a 1:50. As linhas restantes da tabela A devem ser interpretadas similarmente. De nota adicional, a Tabela A lista combinações específicas de um composto da Fórmula 1 com outros agentes de controle de pragas invertebradas ilustrativos das misturas,

composições e métodos da presente invenção e inclui modalidades adicionais de faixas de razão em peso para taxas de aplicação.

TABELA A

Agente de controle de praga invertebrada	Modo de ação ou classe química	Razão de peso típica
Abamectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:50
Acetamiprida	Neonicotinóides	150:1 a 1:200
Amitraz	Elementos de ligação do receptor 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 canal de sódio	150:1 a 1:200
Bifentrina	Moduladores de canal de sódio	100:1 a 1:10
Buprofezina	Inibidores de síntese de quitina	500:1 a 1:50
Cartape	Análogos de nereistoxina	100:1 a 1:200
Clorantraniliprole	Elementos de ligação do receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Clorfenapir	Inibidores de transporte de elétron mitocondrial	300:1 a 1:200
Clorpirifós	Inibidores de colinesterase	500:1 a 1:200
Clotianidina	Neonicotinóides	100:1 a 1:400
Ciflutrina	Moduladores de canal de sódio	150:1 a 1:200
Cialotrina	Moduladores de canal de sódio	150:1 a 1:200
Cipermetrina	Moduladores de canal de sódio	150:1 a 1:200
Ciromazina	Inibidores de síntese de quitina	400:1 a 1:50
Deltametrina	Moduladores de canal de sódio	50:1 a 1:400
Dieldrina	Inseticidas ciclodieno	200:1 a 1:100
Dinotefuran	Neonicotinóides	150:1 a 1:200
Diofenolan	Inibidor de muda	150:1 a 1:200
Emamectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:10
Endosulfan	Inseticidas ciclodieno	200:1 a 1:100

Agente de controle de praga invertebrada	Modo de ação ou classe química	Razão de peso típica
Esfenvalerato	Moduladores de canal de sódio	100:1 a 1:400
Etiprole	Bloqueadores de canal de cloreto regulados por GABA	200:1 a 1:100
Fenotiocarbe		150:1 a 1:200
Fenotiocarbe	Miméticos do hormônio juvenil	500:1 a 1:100
Fenvalerato	Moduladores de canal de sódio	150:1 a 1:200
Fipronil	Bloqueadores de canal de cloreto regulados por GABA	150:1 a 1:100
Flonicamidaa		200:1 a 1:100
Flubendiamida	Elementos de ligação do receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Flufenoxurom	Inibidores de síntese de quitina	200:1 a 1:100
Hexaflumurom	Inibidores de síntese de quitina	300:1 a 1:50
Hidrametilnona	Inibidores de transporte de elétron mitocondrial	150:1 a 1:250
Imidacloprido	Neonicotinóides	1.000:1 a 1:1.000
Indoxacarbe	Moduladores de canal de sódio	200:1 a 1:50
Lambda-cialotrina	Moduladores de canal de sódio	50:1 a 1:250
Lufenurom	Inibidores de síntese de quitina	500:1 a 1:250
Metaflumizona		200:1 a 1:200
Metomil	Inibidores de colinesterase	500:1 a 1:100
Metopreno	Miméticos do hormônio juvenil	500:1 a 1:100
Metoxifenoazida	Agonistas de ecdisona	50:1 a 1:50
Nitenpiram	Neonicotinóides	150:1 a 1:200
Nitiazina	Neonicotinóides	150:1 a 1:200
Novalurom	Inibidores de síntese de quitina	500:1 a 1:150
Oxamil	Inibidores de colinesterase	200:1 a 1:200
Pimetrozina		200:1 a 1:100
Piretrina	Moduladores de canal de sódio	100:1 a 1:10
Piridabem	Inibidores de transporte de elétron mitocondrial	200:1 a 1:100

Agente de controle de praga invertebrada	Modo de ação ou classe química	Razão de peso típica
Piridalil		200:1 a 1:100
Piriproxifem	Miméticos do hormônio juvenil	500:1 a 1:100
Rianodina	Elementos de ligação do receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Espinetoram	Lactonas macrocíclicas	150:1 a 1:100
Espinosade	Lactonas macrocíclicas	500:1 a 1:10
Espiroidiclofeno	Inibidores de biossíntese de lipídeo	200:1 a 1:200
Espiromesifeno	Inibidores de biossíntese de lipídeo	200:1 a 1:200
Tebufenozida	Agonistas de ecdisona	500:1 a 1:250
Tiacloprido	Neonicotinóides	100:1 a 1:200
Tiametoxam	Neonicotinóides	1250:1 a 1:1.000
Tiodicarbe	Inibidores de colinesterase	500:1 a 1:400
Tiosultap-sódio		150:1 a 1:100
Tralometrina	Moduladores de canal de sódio	150:1 a 1:200
Triazamato	Inibidores de colinesterase	250:1 a 1:100
Triflumurom	Inibidores de síntese de quitina	200:1 a 1:100
Bacillus thuringiensis	Agentes biológicos	50:1 a 1:10
Bacillus thuringiensis delta-endotoxina	Agentes biológicos	50:1 a 1:10
NPV (por exemplo, gemstar)	Agentes biológicos	50:1 a 1:10
(A)	Agentes de ligação do receptor de rianodina	100:1 a 1:120

(a) 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-ciano-2-metil-6-[(metilamino) carbonil]-fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida

[00212] De nota é a composição da presente invenção em que pelo menos um composto ou agente biologicamente ativo adicional é selecionado dos agentes de controle de pragas invertebradas listados na tabela

A anterior.

[00213] As razões de pesos de um composto, incluindo um composto da fórmula 1, para o agente de controle de pragas invertebradas adicional estão tipicamente entre 1.000:1 e 1:1.000, com uma modalidade estando entre 500:1 e 1:500, uma outra modalidade estando entre 250:1 e 1:200 e uma outra modalidade estando entre 100:1 e 1 :50.

[00214] Estão listadas abaixo, na tabela B, modalidades de composições específicas compreendendo um composto da fórmula 1 (números compostos referem-se a compostos na tabela A índice) e um agente de controle de pragas invertebradas adicional.

TABELA B

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
A-1	1	e	Abamectina	B-1	11	e	Abamectina
A-2	1	e	Acetamiprida	B-2	11	e	Acetamiprida
A-3	1	e	Amitraz	B-3	11	e	Amitraz
A-4	1	e	Avermectina	B-4	11	e	Avermectina
A-5	1	e	Azadiractina	B-5	11	e	Azadiractina
A-6	1	e	Beta-ciflutrina	B-6	11	e	Beta-ciflutrina
A-7	1	e	Bifentrina	B-7	11	e	Bifentrina
A-8	1	e	Buprofezina	B-8	11	e	Buprofezina
A-9	1	e	Cartape	B-9	11	e	Cartape
A-10	1	e	Clorantraniliprole	B-10	11	e	Clorantraniliprole
A-11	1	e	Clorfenapir	B-11	11	e	Clorfenapir
A-12	1	e	Clorpirifós	B-12	11	e	Clorpirifós
A-13	1	e	Clotianidina	B-13	11	e	Clotianidina
A-14	1	e	Ciflutrina	B-14	11	e	Ciflutrina
A-15	1	e	Cialotrina	B-15	11	e	Cialotrina

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
A-16	1	e	Cipermetrina	B-16	11	e	Cipermetrina
A-17	1	e	Ciromazina	B-17	11	e	Ciromazina
A-18	1	e	Deltametrina	B-18	11	e	Deltametrina
A-19	1	e	Dieldrina	B-19	11	e	Dieldrina
A-20	1	e	Dinotefuran	B-20	11	e	Dinotefuran
A-21	1	e	Diofenolan	B-21	11	e	Diofenolan
A-22	1	e	Emamectina	B-22	11	e	Emamectina
A-23	1	e	Endosulfan	B-23	11	e	Endosulfan
A-24	1	e	Esfenvalerato	B-24	11	e	Esfenvalerato
A-25	1	e	Etiprole	B-25	11	e	Etiprole
A-26	1	e	Fenotiocarbe	B-26	11	e	Fenotiocarbe
A-27	1	e	Fenoxicarbe	B-27	11	e	Fenoxicarbe
A-28	1	e	Fenvalerato	B-28	11	e	Fenvalerato
A-29	1	e	Fipronil	B-29	11	e	Fipronil
A-30	1	e	Flonicamidaaa	B-30	11	e	Flonicamidaa
A-31	1	e	Flubendiamida	B-31	11	e	Flubendiamida
A-32	1	e	Flufenoxurom	B-32	11	e	Flufenoxurom
A-33	1	e	Hexaflumurom	B-33	11	e	Hexaflumurom
A-34	1	e	Hidrametilnona	B-34	11	e	Hidrametilnona
A-35	1	e	Imidacloprido	B-35	11	e	Imidacloprido
A-36	1	e	Indoxacarbe	B-36	11	e	Indoxacarbe
A-37	1	e	Lambda-Cialotrina	B-37	11	e	Lambda-Cialotrina
A-38	1	E	Lufenurom	B-38	11	E	Lufenurom
A-39	1	e	Metaflumizona	B-39	11	e	Metaflumizona
A-40	1	e	Metomil	B-40	11	e	Metomil
A-41	1	e	Metopreno	B-41	11	e	Metopreno

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
A-42	1	e	Metoxifenoazida	B-42	11	e	Metoxifenoazida
A-43	1	e	Nitenpiram	B-43	11	e	Nitenpiram
A-44	1	e	Nitiazina	B-44	11	e	Nitiazina
A-45	1	e	Novalurom	B-45	11	e	Novalurom
A-46	1	e	Oxamil	B-46	11	e	Oxamil
A-47	1	e	Pimetrozina	B-47	11	e	Pimetrozina
A-48	1	e	Piretrina	B-48	11	e	Piretrina
A-49	1	e	Piridabem	B-49	11	e	Piridabem
A-50	1	e	Piridalil	B-50	11	e	Piridalil
A-51	1	e	Piriproxifem	B-51	11	e	Piriproxifem
A-52	1	e	Rianodina	B-52	11	E	Rianodina
A-53	1	e	Espinetoram	B-53	11	e	Espinetoram
A-54	1	e	Espinosade	B-54	11	e	Espinosade
A-55	1	e	Espiroidiclofeno	B-55	11	e	Espiroidiclofeno
A-56	1	e	Espiromesifeno	B-56	11	e	Espiromesifeno
A-57	1	e	Tebufenozida	B-57	11	e	Tebufenozida
A-58	1	e	Tiacloprido	B-58	11	e	Tiacloprido
A-59	1	e	Tiametoxam	B-59	11	e	Tiametoxam
A-60	1	e	Tiodicarbe	B-60	11	e	Tiodicarbe
A-61	1	e	Tiossultap-sódio	B-61	11	e	Tiossultap-sódio
A-62	1	e	Tralometina	B-62	11	e	Tralometina
A-63	1	e	Triazamato	B-63	11	e	Triazamato
A-64	1	e	Triflumurom	B-64	11	e	Triflumurom
A-65	1	e	<i>Bacillus thuringiensis</i>	B-65	11	e	<i>Bacillus thuringiensis</i>
A-66	1	e	<i>Bacillus</i>	B-66	11	e	<i>Bacillus</i>

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
			<i>thuringiensis</i>				<i>thuringiensis</i>
			delta-endotoxina				delta-endotoxina
A-67	1	e	NPV (por exemplo, Gemstar)	B-67	11	e	NPV (por exemplo, Gemstar)
C-1	17	e	Abamectina	D-1	20	e	Abamectina
C-2	17	e	Acetamiprida	D-2	20	e	Acetamiprida
C-3	17	e	Amitraz	D-3	20	e	Amitraz
C-4	17	e	Avermectina	D-4	20	e	Avermectina
C-5	17	e	Azadiractina	D-5	20	e	Azadiractina
C-6	17	e	Beta-ciflutrina	D-6	20	e	Beta-ciflutrina
C-7	17	e	Bifentrina	D-7	20	e	Bifentrina
C-8	17	e	Buprofezina	D-8	20	e	Buprofezina
C-9	17	e	Cartape	D-9	20	e	Cartape
C-10	17	e	Clorantraniliprole	D-10	20	e	Clorantraniliprole
C-11	17	e	Clorfenapir	D-11	20	e	Clorfenapir
C-12	17	e	Clorpirifós	D-12	20	e	Clorpirifós
C-13	17	e	Clotianidina	D-13	20	e	Clotianidina
C-14	17	e	Ciflutrina	D-14	20	e	Ciflutrina
C-15	17	e	Cialotrina	D-15	20	e	Cialotrina
C-16	17	e	Cipermetrina	D-16	20	e	Cipermetrina
C-17	17	e	Ciromazina	D-17	20	e	Ciromazina
C-18	17	e	Deltametrina	D-18	20	e	Deltametrina
C-19	17	e	Dieldrina	D-19	20	e	Dieldrina
C-20	17	e	Dinotefuran	D-20	20	e	Dinotefuran
C-21	17	e	Diofenolan	D-21	20	e	Diofenolan
C-22	17	e	Emamectina	D-22	20	e	Emamectina

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
C-23	17	e	Endosulfan	D-23	20	e	Endosulfan
C-24	17	e	Esfenvalerato	D-24	20	e	Esfenvalerato
C-25	17	e	Etiprole	D-25	20	e	Etiprole
C-26	17	e	Fenotiocarbe	D-26	20	e	Fenotiocarbe
C-27	17	e	Fenoxicarbe	D-27	20	e	Fenoxicarbe
C-28	17	e	Fenvalerato	D-28	20	e	Fenvalerato
C-29	17	e	Fipronil	D-29	20	e	Fipronil
C-30	17	e	Flonicamidaa	D-30	20	e	Flonicamidaa
C-31	17	e	Flubendiamida	D-31	20	e	Flubendiamida
C-32	17	e	Flufenoxurom	D-32	20	e	Flufenoxurom
C-33	17	e	Hexaflumurom	D-33	20	e	Hexaflumurom
C-34	17	e	Hidrametilnona	D-34	20	e	Hidrametilnona
C-35	17	e	Imidacloprido	D-35	20	e	Imidacloprido
C-36	17	e	Indoxacarbe	D-36	20	e	Indoxacarbe
C-37	17	e	Lambda-Cialotrina	D-37	20	e	Lambda-Cialotrina
C-38	17	e	Lufenurom	D-38	20	e	Lufenurom
C-39	17	e	Metaflumizona	D-39	20	e	Metaflumizona
C-40	17	e	Metomil	D-40	20	e	Metomil
C-41	17	e	Metopreno	D-41	20	e	Metopreno
C-42	17	e	Metoxifenzida	D-42	20	e	Metoxifenzida
C-43	17	e	Nitenpiram	D-43	20	e	Nitenpiram
C-44	17	e	Nitiazina	D-44	20	e	Nitiazina
C-45	17	e	Novalurom	D-45	20	e	Novalurom
C-46	17	e	Oxamil	D-46	20	e	Oxamil
C-47	17	e	Pimetrozina	D-47	20	e	Pimetrozina
C-48	17	e	Piretrina	D-48	20	e	Piretrina

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
C-49	17	e	Piridabem	D-49	20	e	Piridabem
C-50	17	e	Piridalil	D-50	20	e	Piridalil
C-51	17	e	Piriproxifem	D-51	20	e	Piriproxifem
C-52	17	e	Rianodina	D-52	20	e	Rianodina
C-53	17	e	Espinetoram	D-53	20	e	Espinetoram
C-54	17	e	Espinosade	D-54	20	e	Espinosade
C-55	17	e	Espiroadiclofeno	D-55	20	e	Espiroadiclofeno
C-56	17	e	Espiromesifeno	D-56	20	e	Espiromesifeno
C-57	17	e	Tebufenozida	D-57	20	e	Tebufenozida
C-58	17	e	Tiacloprido	D-58	20	e	Tiacloprido
C-59	17	e	Tiametoxam	D-59	20	e	Tiametoxam
C-60	17	e	Tiodicarbe	D-60	20	e	Tiodicarbe
C-61	17	e	Tiossultap-sódio	D-61	20	e	Tiossultap-sódio
C-62	17	e	Tralometina	D-62	20	e	Tralometina
C-63	17	e	Triazamato	D-63	20	e	Triazamato
C-64	17	e	Triflumurom	D-64	20	e	Triflumurom
C-65	17	e	<i>Bacillus thuringiensis</i>	D-65	20	e	<i>Bacillus thuringiensis</i>
C-66	17	e	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxina	D-66	20	e	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxina
C-67	17	e	NPV (por exemplo, Gemstar)	D-67	20	e	NPV (por exemplo, Gemstar)
E-1	37	e	Abamectina	F-1	52	e	Abamectina
E-2	37	e	Acetamiprida	F-2	52	e	Acetamiprida
E-3	37	e	Amitraz	F-3	52	e	Amitraz
E-4	37	e	Avermectina	F-4	52	e	Avermectina
E-5	37	e	Azadiractina	F-5	52	e	Azadiractina

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
E-6	37	e	Beta-ciflutrina	F-6	52	e	Beta-ciflutrina
E-7	37	e	Bifentrina	F-7	52	e	Bifentrina
E-8	37	e	Buprofezina	F-8	52	e	Buprofezina
E-9	37	e	Cartape	F-9	52	e	Cartape
E-10	37	e	Clorantraniliprole	F-10	52	e	Clorantraniliprole
E-11	37	e	Clorfenapir	F-11	52	e	Clorfenapir
E-12	37	e	Clorpirifós	F-12	52	e	Clorpirifós
E-13	37	e	Clotianidina	F-13	52	e	Clotianidina
E-14	37	e	Ciflutrina	F-14	52	e	Ciflutrina
E-15	37	e	Cialotrina	F-15	52	e	Cialotrina
E-16	37	e	Cipermetrina	F-16	52	e	Cipermetrina
E-17	37	e	Ciromazina	F-17	52	e	Ciromazina
E-18	37	e	Deltametrina	F-18	52	e	Deltametrina
E-19	37	e	Dieldrina	F-19	52	e	Dieldrina
E-20	37	e	Dinotefuran	F-20	52	e	Dinotefuran
E-21	37	e	Diofenolan	F-21	52	e	Diofenolan
E-22	37	e	Emamectina	F-22	52	e	Emamectina
E-23	37	e	Endosulfan	F-23	52	e	Endosulfan
E-24	37	e	Esfenvalerato	F-24	52	e	Esfenvalerato
E-25	37	e	Etiprole	F-25	52	e	Etiprole
E-26	37	e	Fenotiocarbe	F-26	52	e	Fenotiocarbe
E-27	37	e	Fenoxicarbe	F-27	52	e	Fenoxicarbe
E-28	37	E	Fenvalerato	F-28	52	E	Fenvalerato
E-29	37	e	Fipronil	F-29	52	e	Fipronil
E-30	37	e	Flonicamidaa	F-30	52	e	Flonicamidaa
E-31	37	e	Flubendiamida	F-31	52	e	Flubendiamida

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
E-32	37	e	Flufenoxurom	F-32	52	e	Flufenoxurom
E-33	37	e	Hexaflumurom	F-33	52	e	Hexaflumurom
E-34	37	e	Hidrametilnona	F-34	52	e	Hidrametilnona
E-35	37	e	Imidacloprido	F-35	52	e	Imidacloprido
E-36	37	e	Indoxacarbe	F-36	52	e	Indoxacarbe
E-37	37	e	Lambda-Cialotrina	F-37	52	e	Lambda-Cialotrina
E-38	37	e	Lufenurom	F-38	52	e	Lufenurom
E-39	37	e	Metaflumizona	F-39	52	e	Metaflumizona
E-40	37	e	Metomil	F-40	52	e	Metomil
E-41	37	e	Metopreno	F-41	52	e	Metopreno
E-42	37	e	Metoxifenoizida	F-42	52	e	Metoxifenoizida
E-43	37	e	Nitenpiram	F-43	52	e	Nitenpiram
E-44	37	e	Nitiazina	F-44	52	e	Nitiazina
E-45	37	e	Novalurom	F-45	52	e	Novalurom
E-46	37	e	Oxamil	F-46	52	e	Oxamil
E-47	37	e	Pimetrozina	F-47	52	e	Pimetrozina
E-48	37	e	Piretrina	F-48	52	e	Piretrina
E-49	37	e	Piridabem	F-49	52	e	Piridabem
E-50	37	e	Piridalil	F-50	52	e	Piridalil
E-51	37	e	Piriproxifem	F-51	52	e	Piriproxifem
E-52	37	e	Rianodina	F-52	52	e	Rianodina
E-53	37	e	Espinetoram	F-53	52	e	Espinetoram
E-54	37	e	Espinosade	F-54	52	e	Espinosade
E-55	37	e	Espiroidiclofeno	F-55	52	e	Espiroidiclofeno
E-56	37	e	Espiromesifeno	F-56	52	e	Espiromesifeno
E-57	37	e	Tebufenozida	F-57	52	e	Tebufenozida

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
E-58	37	e	Tiacloprido	F-58	52	e	Tiacloprido
E-59	37	e	Tiametoxam	F-59	52	e	Tiametoxam
E-60	37	e	Tiodicarbe	F-60	52	e	Tiodicarbe
E-61	37	e	Tiossultap-sódio	F-61	52	e	Tiossultap-sódio
E-62	37	e	Tralometina	F-62	52	e	Tralometina
E-63	37	e	Triazamato	F-63	52	e	Triazamato
E-64	37	e	Triflumurom	F-64	52	e	Triflumurom
E-65	37	e	<i>Bacillus thuringiensis</i>	F-65	52	e	<i>Bacillus thuringiensis</i>
E-66	37	e	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxina	F-66	52	e	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxina
E-67	37	e	NPV (por exemplo, Gemstar)	F-67	52	e	NPV (por exemplo, Gemstar)
E-68	37		(a)	F-68	52		(a)
G-1	62	e	Abamectina	H-1	94	e	Abamectina
G-2	62	e	Acetamiprida	H-2	94	e	Acetamiprida
G-3	62	e	Amitraz	H-3	94	e	Amitraz
G-4	62	e	Avermectina	H-4	94	e	Avermectina
G-5	62	e	Azadiractina	H-5	94	e	Azadiractina
G-6	62	e	Beta-ciflutrina	H-6	94	e	Beta-ciflutrina
G-7	62	e	Bifentrina	H-7	94	e	Bifentrina
G-8	62	e	Buprofezina	H-8	94	e	Buprofezina
G-9	62	e	Cartape	H-9	94	e	Cartape
G-10	62	e	Clorantraniliprole	H-10	94	e	Clorantraniliprole
G-11	62	e	Clorfenapir	H-11	94	e	Clorfenapir
G-12	62	e	Clorpirifós	H-12	94	e	Clorpirifós
G-13	62	e	Clotianidina	H-13	94	e	Clotianidina

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
G-14	62	e	Ciflutrina	H-14	94	e	Ciflutrina
G-15	62	e	Cialotrina	H-15	94	e	Cialotrina
G-16	62	e	Cipermetrina	H-16	94	e	Cipermetrina
G-17	62	e	Ciromazina	H-17	94	e	Ciromazina
G-18	62	e	Deltametrina	H-18	94	e	Deltametrina
G-19	62	e	Dieldrina	H-19	94	e	Dieldrina
G-20	62	e	Dinotefuran	H-20	94	e	Dinotefuran
G-21	62	e	Diofenolan	H-21	94	e	Diofenolan
G-22	62	e	Emamectina	H-22	94	e	Emamectina
G-23	62	e	Endosulfan	H-23	94	e	Endosulfan
G-24	62	e	Esfenvalerato	H-24	94	e	Esfenvalerato
G-25	62	e	Etiprole	H-25	94	e	Etiprole
G-26	62	e	Fenotiocarbe	H-26	94	e	Fenotiocarbe
G-27	62	e	Fenoxicarbe	H-27	94	e	Fenoxicarbe
G-28	62	e	Fenvalerato	H-28	94	e	Fenvalerato
G-29	62	e	Fipronil	H-29	94	e	Fipronil
G-30	62	e	Flonicamidaa	H-30	94	e	Flonicamidaa
G-31	62	e	Flubendiamida	H-31	94	e	Flubendiamida
G-32	62	e	Flufenoxurom	H-32	94	e	Flufenoxurom
G-33	62	e	Hexaflumurom	H-33	94	e	Hexaflumurom
G-34	62	e	Hidrametilnona	H-34	94	e	Hidrametilnona
G-35	62	e	Imidacloprido	H-35	94	e	Imidacloprido
G-36	62	e	Indoxacarbe	H-36	94	e	Indoxacarbe
G-37	62	e	Lambda-Cialotrina	H-37	94	e	Lambda-Cialotrina
G-38	62	e	Lufenurom	H-38	94	e	Lufenurom
G-39	62	e	Metaflumizona	H-39	94	e	Metaflumizona

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
G-40	62	e	Metomil	H-40	94	e	Metomil
G-41	62	e	Metopreno	H-41	94	e	Metopreno
G-42	62	e	Metoxifenoazida	H-42	94	e	Metoxifenoazida
G-43	62	e	Nitenpiram	H-43	94	e	Nitenpiram
G-44	62	e	Nitiazina	H-44	94	e	Nitiazina
G-45	62	e	Novalurom	H-45	94	e	Novalurom
G-46	62	e	Oxamil	H-46	94	e	Oxamil
G-47	62	e	Pimetrozina	H-47	94	e	Pimetrozina
G-48	62	e	Piretrina	H-48	94	e	Piretrina
G-49	62	e	Piridabem	H-49	94	e	Piridabem
G-50	62	e	Piridalil	H-50	94	e	Piridalil
G-51	62	e	Piriproxifem	H-51	94	e	Piriproxifem
G-52	62	e	Rianodina	H-52	94	e	Rianodina
G-53	62	e	Espinetoram	H-53	94	e	Espinetoram
G-54	62	e	Espinosade	H-54	94	e	Espinosade
G-55	62	e	Espiroidiclofeno	H-55	94	e	Espiroidiclofeno
G-56	62	e	Espiromesifeno	H-56	94	e	Espiromesifeno
G-57	62	e	Tebufenozida	H-57	94	e	Tebufenozida
G-58	62	e	Tiacloprido	H-58	94	e	Tiacloprido
G-59	62	e	Tiametoxam	H-59	94	e	Tiametoxam
G-60	62	e	Tiodicarbe	H-60	94	e	Tiodicarbe
G-61	62	e	Tiossultap-sódio	H-61	94	e	Tiossultap-sódio
G-62	62	e	Tralometina	H-62	94	e	Tralometina
G-63	62	e	Triazamato	H-63	94	e	Triazamato
G-64	62	e	Triflumurom	H-64	94	e	Triflumurom
G-65	62	e	<i>Bacillus thuringiensis</i>	H-65	94	e	<i>Bacillus thuringiensis</i>

Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado	Número da mistura	Número de Composto	e	Agente de controle de praga de invertebrado
G-66	62	e	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxina	H-66	94	e	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxina
G-67	62	e	NPV (por exemplo, Gemstar)	H-67	94	e	NPV (por exemplo, Gemstar)
G-68	62		(a)	H-68	94		(a)

(a) 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-metil-6-
[(metilamino)carboxil]fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida

[00215] As misturas específicas listadas na tabela B combinam tipicamente um composto da fórmula 1 com o outro agente de pragas invertebradas nas razões especificadas na tabela A.

[00216] As pragas invertebradas são controladas em aplicações agrônômicas e não agrônômicas aplicando um ou mais compostos desta invenção, tipicamente na forma de uma composição, em uma quantidade biologicamente efetiva, no ambiente das pragas, incluindo o local de infestação agrônômico e/ou não agrônômico, na área a ser protegida, ou diretamente nas pragas a serem controladas.

[00217] Assim, a presente invenção compreende um método para controlar pragas invertebradas em aplicações agrônômicas e/ou não agrônômicas, compreendendo colocar em contato as pragas invertebradas ou seu ambiente com uma quantidade biologicamente efetiva de um ou mais dos compostos da invenção, ou com uma composição compreendendo pelo menos um composto como este ou uma composição compreendendo pelo menos um composto como este e uma quantidade biologicamente efetiva de pelo menos um composto ou agente biologicamente ativo adicional. Exemplos de composições adequadas compreendendo um composto da invenção e uma

quantidade biologicamente efetiva de pelo menos um composto ou agente biologicamente ativo adicional incluem composições granulares, em que o composto ativo adicional está presente no mesmo grânulo que o composto da invenção ou em grânulos separados daqueles do composto da invenção.

[00218] Para atingir o contato com um composto ou composição da invenção para proteger uma plantação no campo de pragas invertebradas, o composto ou composição é tipicamente aplicado na semente da plantação antes do plantio, na folhagem (por exemplo, folhas, caules, flores, frutos) de plantas de plantação, ou no solo ou outro meio de crescimento antes ou após a plantação ser cultivada.

[00219] Uma modalidade de um método de contato é por aspersão. Alternativamente, uma composição granular compreendendo um composto da invenção pode ser aplicada na folhagem da planta ou no solo. Os compostos desta invenção também podem ser eficientemente distribuídos através da absorção da planta colocando a planta em contato com uma composição compreendendo um composto desta invenção aplicado como um remédio líquido no solo a partir de uma formulação líquida, uma formulação granular no solo, um tratamento de caixa de sementeira ou uma imersão de transplantes. De nota é uma composição da presente invenção na forma de uma formulação líquida embebida no solo. Também de nota é um método para controlar pragas invertebradas compreendendo colocar em contato pragas invertebradas ou seu ambiente com uma quantidade biologicamente efetiva de um composto da presente invenção ou com uma composição compreendendo uma quantidade biologicamente efetiva de um composto da presente invenção. De nota adicional é este método em que o ambiente é o solo e a composição é aplicada no solo como uma formulação embebida no solo. De nota adicional é que compostos desta invenção são também efetivos por aplicação localizada no local de infestação. Outros métodos de contato incluem aplicação de um

composto ou uma composição da invenção por aspersões direta e residual, aspersões aéreas, géis, revestimentos de semente, microencapsulações, absorção sistêmica, iscas, marcas auriculares, bolos, dispositivos de formação de névoa, fumegantes, aerossóis, poeiras e muitos outros. Uma modalidade de um método de contato é um grânulo, bastão ou comprimido fertilizante dimensionalmente estável compreendendo um composto ou composição da invenção. Os compostos desta invenção também podem ser impregnados nos materiais para fabricar dispositivos de controle de invertebrado (por exemplo, tela de inseto).

[00220] Os compostos desta invenção são também usados em tratamentos de semente para proteger sementes de pragas invertebradas. No contexto da presente revelação e reivindicações, tratar uma semente significa colocar a semente em contato com uma quantidade biologicamente efetiva de um composto desta invenção, que é tipicamente formulado como uma composição da invenção. Este tratamento de semente protege a semente de pragas invertebradas do solo e, em geral, também pode proteger raízes e outras partes da planta em contato com o solo do desenvolvimento da muda a partir da semente em germinação. O tratamento de semente também pode fornecer proteção de folhagem por translocação do composto desta invenção ou um segundo ingrediente ativo na planta em desenvolvimento. Os tratamentos de semente podem ser aplicados a todos os tipos de sementes, incluindo aquelas cujas plantas transformadas geneticamente para expressar traços especializados germinarão. Exemplos representativos incluem aqueles que expressam proteínas tóxicas para pragas invertebradas, tal como toxina de *Bacillus thuringiensis* ou aqueles que expressam resistência a herbicida tal como glifosato acetiltransferase, que fornece resistência à glifosato.

[00221] Um método de tratamento de semente é por aspersão ou pulverização da semente com um composto da invenção (isto é, como uma

composição formulada) antes da disseminação das sementes. As composições formuladas para tratamento de semente compreendem em geral um formador de filme ou agente adesivo. Portanto, tipicamente, uma composição de revestimento de semente da presente invenção compreende um composto da fórmula 1 e um formador de filme ou agente adesivo. A semente pode ser revestida aspergindo um concentrado de suspensão com boa fluidez diretamente em um leito de tamboreamento de sementes e então secando as sementes. Alternativamente, outros tipos de formulação tais como pós molháveis, soluções, suspoemulsões, concentrados emulsificáveis e emulsões em água podem ser aspergidas na semente. Este processo é usado particularmente para aplicar revestimentos de filme nas sementes. Várias máquinas e processos de revestimento estão disponíveis aos versados na técnica. Processos adequados incluem aqueles listados em P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Mongraph No. 57, e referências nele listadas.

[00222] A semente tratada compreende tipicamente um composto da presente invenção em uma quantidade de cerca de 0,1 g a 1 kg por 100 kg de semente (isto é, de cerca de 0,0001 a 1% em peso da semente antes do tratamento). Uma suspensão dispersível formulada para o tratamento de semente compreende tipicamente de cerca de 0,5 a cerca de 70% do ingrediente ativo, de cerca de 0,5 a cerca de 30% de um adesivo que forma filme, de cerca de 0,5 a cerca de 20% de um agente de dispersão, de 0 a cerca de 5% de um espessante, de 0 a cerca de 5% de um pigmento e/ou corante, de 0 a cerca de 2% de um agente antiespumante, de 0 a cerca de 1% de um conservante, e de 0 a cerca de 75% de um diluente líquido volátil.

[00223] Os compostos desta invenção podem ser incorporados em uma composição de isca que é consumida por pragas invertebradas ou usado em um dispositivo tal como uma armadilha, estação de isca e similares.

Uma composição de isca como esta pode estar na forma de grânulos que compreendem (a) ingredientes ativos, a saber, um composto da fórmula 1, (b) um ou mais materiais alimentícios; opcionalmente (c) um agente de atração e, opcionalmente, (d) um ou mais umectantes. De nota, são grânulos ou composições de isca que compreendem entre cerca de 0,001 a 5% de ingredientes ativos, cerca de 40-99% de material alimentício e/ou agente de atração e, opcionalmente, cerca de 0,05-10% de umectantes, que são efetivos em controlar pragas de invertebrados de 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 tanto como uma fonte alimentar quanto como um agente de atração. Materiais alimentícios incluem carboidratos, proteínas e lipídeos. Exemplos de materiais alimentícios são farinha vegetal, açúcar, amidos, gordura animal, óleo vegetal, extratos de levedura e sólidos de leite. Exemplos de agentes de atração são aromatizantes e flavorizantes, tais como extratos de fruta ou de planta, perfume ou outros componentes de animal ou de planta, feromônios ou outros agentes conhecidos por atrair pragas invertebradas-alvos. Exemplos de umectantes, isto é, agentes que mantêm a umidade, são glicóis e outros polióis, glicerina e sorbitol. De nota, é uma composição de isca (e um método que utiliza uma composição de isca como esta) usada para controlar pelo menos pragas invertebradas selecionadas do grupo que consiste em formigas, téracarinos e baratas. Um dispositivo para controlar pragas invertebradas pode compreender a presente composição de isca e um alojamento adaptado para receber a composição de isca, em que o alojamento tenha pelo menos uma abertura dimensionada para permitir que pragas invertebradas passem através da abertura de maneira que as pragas invertebradas possam ter acesso à composição de isca a partir de um local fora do alojamento, e em que o alojamento é adicionalmente adaptado para ser colocado em um local de

potencial ou atividade conhecida para as pragas invertebradas, ou próximo a ele.

[00224] Os compostos desta invenção podem ser aplicados sem outros adjuvantes, mas, na maioria das vezes, a aplicação será de uma formulação compreendendo um ou mais ingredientes ativos com carreadores adequados, diluentes, e agentes tensoativos e possivelmente em combinação com um alimento dependendo do uso final pretendido. Um método de aplicação envolve aspergir uma dispersão aquosa ou solução de óleo refinado de um composto da presente invenção. Combinações com óleos de aspersão, concentrações de óleo de aspersão, espalhantes adesivos, adjuvantes, outros solventes e agentes sinérgicos, tais como piperonil butóxido melhoram frequentemente a eficiência do composto. Para usos não agronômicos tais aspersões podem ser aplicadas a partir de recipientes de aspersão tal como uma lata, uma garrafa ou outro recipiente, tanto por meio de uma bomba, quanto liberando-as de um recipiente pressurizado, por exemplo, uma lata de aspersão de aerossol pressurizado. Tais composições de aspersão podem assumir várias formas, por exemplo, aspersões, nevoeiros, espumas, vapores ou névoa. Assim, tais composições de aspersão podem compreender adicionalmente propulsores, agentes espumantes, etc., conforme o caso. De nota, é uma composição de aspersão compreendendo um composto ou uma composição da presente invenção e um carreador. Uma modalidade de uma composição de aspersão como esta compreende uma quantidade biologicamente efetiva de um composto ou uma composição da presente invenção e um propulsor. Propulsores representativos incluem, mas sem limitações, metano, etano, propano, butano, isobutano, buteno, pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrofluorcarbonos, clorofluorcarbonos, éter dimetila e misturas dos anteriores. De nota, é uma composição de aspersão (e um método que utiliza uma composição de aspersão como esta dispensada de

um recipiente de aspersão) usado para controlar pelo menos pragas invertebradas selecionadas do grupo que consiste em mosquitos, moscas negras, moscas dos estábulos, moscas do cervo, moscas do cavalo, vespas, jaquetas amarelas, vespões, carrapatos, aranhas, formigas, mosquitinhos e similares, incluindo individualmente ou em combinações.

[00225] Usos não agronômicos referem-se ao controle de pragas invertebradas nas áreas sem ser campos de plantação. Usos não agronômicos dos presentes compostos e composições incluem controle de pragas invertebradas em grãos armazenados, feijões e outros gêneros alimentícios, e em tecidos tais como roupas e tapetes. Usos não agronômicos dos presentes compostos e composições também incluem controle de praga de invertebrados em plantas ornamentais, florestas, em pátios, ao longo de margens de estradas e ferrovias permanentes, e em grama tais como gramados, campos de golfe e pastagens. Usos não agronômicos dos presentes compostos e composições também incluem controle de pragas invertebradas em casas e outras construções que podem ser ocupadas por humanos e/ou animais de companhia, de fazenda, de rancho, de zoológico ou outros animais. Usos não agronômicos dos presentes compostos e composições também incluem o controle de pragas tal como teracarinos que podem danificar madeira ou outros materiais estruturais usados em construções.

[00226] Usos não agronômicos dos presentes compostos e composições também incluem proteger a saúde humana e animal controlando pragas invertebradas que são parasíticas ou transmitem doenças infecciosas. O controle de parasitas de animal inclui controlar parasitas externos que são parasíticos na superfície do corpo do animal hospedeiro (por exemplo, ombros, axilas, abdome, parte interna das coxas) e parasitas internos que são parasíticos no interior do corpo do animal hospedeiro (por exemplo, estômago, intestino, pulmão, veias, sob a pele, tecido linfático). Pragas parasíticas

externas ou que transmitem doença incluem, por exemplo, bichos de pé, carrapatos, piolhos, mosquitos, moscas, pequenos acarinos e pulgas. Parasitas internos incluem parasitas do coração, ancilóstomos e helmintos. Os compostos e composições da presente invenção são particularmente adequados para combater pragas parasíticas externas ou que transmitem doenças. Os compostos e composições da presente invenção são adequados para o controle sistêmico e/ou não sistêmico de infestação ou infecção por parasitas em animais.

[00227] Os compostos e composições da presente invenção são adequados para combater parasitas que infestam sujeitos animais incluindo aqueles selvagens, animais de fazenda e animais de trabalho agrícola. Animais de fazenda é o termo usado para se referir (de maneira singular ou plural) a um animal domesticado criado intencionalmente em um ambiente agrícola para fabricar produto tal como alimento ou fibra, ou para mão de obra própria; exemplos de animais de fazenda incluem gado, ovelha, cabras, cavalos, porcos, burros, camelos, búfalo, coelhos, galinhas, perus, patos e gansos (por exemplo, fornecedores de carne, leite, manteiga, ovos, pele, couro, penas e/ou lã). São reduzidos a fatalidades e diminuição de desempenho (em termos de carne, leite, lã, peles, ovos, etc.) pelo combate de parasitas, de maneira tal que aplicar uma composição compreendendo um composto da presente invenção permita criação mais econômica e simples de animais.

[00228] Os compostos e composições da presente invenção são especialmente adequados para combater parasitas que infestam animais de companhia e animais de estimação (por exemplo, cães, gatos, pássaros domésticos e peixe de aquário), animais de pesquisa e experimentais (por exemplo, *hamsters*, porquinhos da Índia, ratos e camundongos), bem como animais criados em zoológicos, *habitats* selvagens e/ou circos.

[00229] Em uma modalidade desta invenção, o animal é

preferivelmente um vertebrado e, mais preferivelmente, um mamífero, ave ou peixe. Em uma modalidade particular, o sujeito animal é um mamífero (incluindo grandes macacos, tais como humanos). Outros sujeitos mamíferos incluem primatas (por exemplo, macacos), bovinos (por exemplo, gado ou vacas leiteiras), suínos (por exemplo, leitões ou porcos), ovinos (por exemplo, cabras ou ovelha), equinos (por exemplo, cavalos), caninos (por exemplo, cães), felinos (por exemplo, gatos domésticos), camelos, cervos, burros, búfalos, antílopes, coelhos e roedores (por exemplo, porquinhos da Índia, esquilos, ratos, camundongos, gerbis e *hamsters*). Aves incluem Anatidae (cisnes, patos e gansos), Columbidae (por exemplo, pombos e rolinhas), Phasianidae (por exemplo, perdizes, faisão e perus), Thesienidae (por exemplo, galinhas domésticas), Psittacines (por exemplo, periquitos, araras e papagaios), aves de caça e ratitas (por exemplo, avestruzes).

[00230] De nota particular é a modalidade em que os animais a ser protegidos são cães domesticados (isto é, *Canis lupus familiaris*) e gatos domésticos (isto é, *Felis catus*).

[00231] Pássaros tratados ou protegidos pelos compostos inventivos podem estar associados tanto com avicultura comercial quanto como não comercial. Estes incluem Anatidae, tais como cisnes, gansos, e patos, Columbidae, tais como pombos e rolinhas domésticas, Phasianidae, tais como perdiz, tetraz e perus, Thesienidae, tais como galinhas domésticas, e Psittacines, tais como periquitos, araras e papagaios para o mercado de animais domésticos ou de colecionador, entre outros.

[00232] Com propósitos da presente invenção, sabe-se que o termo "peixe" inclui sem limitação, o agrupamento Teleosti de peixe, isto é, teleósteos. Tanto a ordem Salmoniformes (que inclui a família Salmonidae) quanto a ordem Perciformes (que inclui a família Centrarchidae) fazem parte do agrupamento Teleosti. Exemplos de outras classificações de peixes potenciais

incluem o Salmonidae, Serranidae, Sparidae, Cichlidae e Centrarchidae, entre outros.

[00233] Outros animais também são contemplados com o benefício dos métodos inventivos, incluindo marsupiais (tais como cangurus), répteis (tais como tartarugas marinhas), e outros animais domésticos importantes economicamente cujos métodos inventivos são seguros e efetivos em tratar ou prevenir infecção ou infestação parasita.

[00234] Exemplos de pragas parasíticas invertebradas controladas administrando-se uma quantidade parasiticida efetiva de um composto desta invenção a um animal a ser protegido incluem ectoparasitas (artrópodes, acarinos, etc.) e endoparasitas (helmintos, por exemplo, nemátodes, tremátodes, cestóides, acantocéfalos, etc.).

[00235] A doença ou grupo de doenças descritas em geral como helmintíase é em virtude da infecção de um animal hospedeiro com vermes parasíticos conhecidos como helmintos. O termo "helmintos" inclui nemátodes, tremátodes, cestóides e acantocéfalos. Helmintíase é um problema prevalente e econômico grave com animais domesticados tais como suíno, ovelha, cavalos, gado, cabras, cães, gatos e aves domésticas.

[00236] Entre os helmintos, o grupo de vermes descrito como nemátodes causa infecção muito difundida e, as vezes, grave em várias espécies de animais. Pretende-se que os nemátodes a serem tratados pelos compostos desta invenção e pelos métodos inventivos incluam, sem limitação, os seguintes gêneros: *Acanthocheilonema*, *Aelurostrongylus*, *Ancylostoma*, *Angiostrongylus*, *Ascaridia*, *Ascaris*, *Brugia*, *Bunostomum*, *Capillaria*, *Chabertia*, *Cooperia*, *Crenosoma*, *Dictyocaulus*, *Dioctophyme*, *Dipetalonema*, *Diphyllobothrium*, *Dirofilaria*, *Dracunculus*, *Enterobius*, *Filaroides*, *Haemonchus*, *Heterakis*, *Lagochilascaris*, *Loa*, *Mansonella*, *Muellerius*, *Necator*, *Nematodirus*, *Oesophagostomum*, *Ostertagia*, *Oxyuris*, *Parafilaria*, *Parascaris*, *Physaloptera*,

Protostrongylus, Setaria, Spirocerca, Stephanofilaria, Strongyloides, Strongylus, Thelazia, Toxascaris, Toxocara, Trichinella, Trichonema, Trichostrongylus, Trichuris, Uncinaria e Wuchereria.

[00237] Do exposto, os gêneros mais comuns de nematóides que infectam os animais referidos anteriormente são *Haemonchus, Trichostrongylus, Ostertagia, Nematodirus, Cooperia, Ascaris, Bunostomum, Oesophagostomum, Chabertia, Trichuris, Strongylus, Trichonema, Dictyocaulus, Capillaria, Heterakis, Toxocara, Ascaridia, Oxyuris, Ancylostoma, Uncinaria, Toxascaris e Parascaris*. Uma quantidade indeterminada destes, tais como *Nematodirus, Cooperia* e *Oesophagostomum* atacam principalmente o trato intestinal, enquanto outros, tais como *Haemonchus* e *Ostertagia*, são mais prevalentes no estômago, enquanto outros, tais como *Dictyocaulus* são encontrados nos pulmões. Outros parasitas ainda podem estar localizados em outros tecidos tais como o coração e vasos sanguíneos, tecido subcutâneo e linfático, e similares.

[00238] Pretende-se que os tremátodes a serem tratados pelos compostos desta invenção e pelos métodos inventivos incluam, sem limitação, os seguintes gêneros: *Alaria, Fasciola, Nanophyetus, Opisthorchis, Paragonimus* e *Schistosoma*.

[00239] Pretende-se que os cestóides a serem tratados pelos compostos desta invenção e pelos métodos inventivos incluam, sem limitação, os seguintes gêneros: *Diphyllobothrium, Diplydium, Spirometra* e *Taenia*.

[00240] Os gêneros mais comuns de parasitas do trato gastrointestinal de humanos são *Ancylostoma, Necator, Ascaris, Strongyloides, Trichinella, Capillaria, Trichuris* e *Enterobius*. Outros gêneros de parasitas de importância médica que são encontrados no sangue ou outros tecidos e órgãos fora do trato gastrointestinal são os vermes filariais tais como *Wuchereria, Brugia, Onchocerca* e *Loa*, bem como *Dracunculus* e estágios extra intestinais

dos vermes intestinais vermes *Strongyloides* e *Trichinella*.

[00241] Inúmeros outros gêneros e espécie de helmintos são conhecidos na técnica, e pretende-se também que sejam tratados pelos compostos da invenção. Estes são enumerados com mais detalhes em *Textbook of Veterinary Clinica Parasitology*, Volume 1, Helminths, E. J. L. Soulsby, F. A. Davis Co., Philadelphia, Pa.; *Helminths, Arthropods and Protozoa*, (6th Edition of Monnig's Veterinary Helminthology and Entomology), E. J. L. Soulsby, O Williams e Wilkins Co., Baltimore, Md.

[00242] Os compostos da fórmula 1 são efetivos contra inúmeros ectoparasitas de animais (por exemplo, ectoparasitas artrópodes de mamíferos e pássaros).

[00243] Pragas do tipo inseto e acarino incluem, por exemplo, insetos sugadores tais como moscas e mosquitos, pequenos acarinos, carrapatos, piolhos, pulgas, percevejos, larvas parasíticas e similares.

[00244] Moscas adultas incluem, por exemplo, a mosca dos chifres ou *Haematobia irritans*, a mosca do cavalo ou *Tabanus* spp., a mosca dos estábulos ou *Stomoxys calcitrans*, a mosca negra ou *Simulium* spp., a mosca dos cervos ou *Chrysops* spp., a mosca do piolho ou *Melophagus ovinus*, e a mosca tse-tsé ou *Glossina* spp. Larvas de moscas parasíticas incluem, por exemplo, a mosca varejeira (*Oestrus ovis* e *Cuterebra* spp.), a mosca da morte ou *Phaenicia* spp., a larva de mosca varejeira ou *Cochliomyia hominivorax*, o berne ou *Hypoderma* spp., o verme da lã e o *Gastrophilus* de cavalos. Mosquitos incluem, por exemplo, *Culex* spp., *Anopheles* spp. e *Aedes* spp.

[00245] Pequenos acarinos incluem *Mesostigmata* spp., por exemplo, mesostigmatas tal como o pequeno acarino de galinha, *Dermanyssus gallinae*; pequenos acarinos que causam coceira e sarna tal como *Sarcoptidae* spp., por exemplo, *Sarcoptes scabiei*; pequenos acarinos que causam ronha tal como *Psoroptidae* spp., incluindo *Chorioptes bovis* e *Psoroptes ovis*; bichos de

pé por exemplo, *Trombiculidae* spp., por exemplo, o bicho de pé norte americano, *Trombicula alfreddugesi*. Carrapatos incluem, por exemplo, carrapatos moles incluindo *Argasidae* spp., por exemplo, *Argas* spp. e *Ornithodoros* spp.; carrapatos duros incluindo *Ixodidae* spp., por exemplo, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor variabilis*, *Dermacentor andersoni*, *Amblyomma americanum*, *Ixodes scapularis* e outros *Rhipicephalus* spp. (incluindo os gêneros anteriores *Boophilus*).

[00246] Piolhos incluem, por exemplo, piolhos sugadores, por exemplo, *Menopon* spp. e *Bovicola* spp.; *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp. e *Solenopotes* spp. Pulgas incluem, por exemplo, *Ctenocephalides* spp., tais como pulga de cachorro (*Ctenocephalides canis*) e pulga de gato (*Ctenocephalides felis*); *Xenopsylla* spp. tal como pulga de rato oriental (*Xenopsylla cheopis*); e *Pulex* spp. tal como pulga humana (*Pulex irritans*).

[00247] Percevejos incluem, por exemplo, *Cimicidae* ou, por exemplo, o percevejo comum (*Cimex lectularius*); *Triatominae* spp. incluindo insetos triatomídeos também conhecidos como insetos beijoqueiros; por exemplo, *Rhodnius prolixus* e *Triatoma* spp.

[00248] Em geral, moscas, pulgas, piolhos, mosquitos, mosquitinhos, pequenos acarinos, carrapatos e helmintos causam grandes perdas aos setores de animais de fazenda e animal de companhia. Parasitas artrópodes também são um incômodo aos humanos e podem causar doença por vetores em organismos humanos e animais.

[00249] Inúmeras outras pragas artrópodes e ectoparasitas são conhecidas na técnica, e pretende-se também que sejam tratadas pelos compostos da invenção. Estes são enumerados com mais detalhes em *Medical and Veterinary Entomology*, D. S. Kettle, John Wiley & Sons, Nova Iorque e Toronto; *Control of Artropods Pests of Livestock: A Review of Technology*, R. O. Drummand, J. E. George, e S. E. Kunz, CRC Press, Boca Raton, Fla.

[00250] Pretende-se também que os compostos e composições desta invenção possam ser efetivos contra inúmeros endoparasitas protozoários de animais, incluindo aqueles resumidos pela tabela 1, a seguir.

TABELA 1

Protozoário parasítico exemplar e doenças humanas associadas				
Filo	Subfilo	Gêneros representativos	Distúrbio ou doença humana	
<i>Sarcomastigophora</i> (com flagelos, pseudópodes, ou ambos)	<i>Mastigophora</i> (Flagelos)	<i>Leishmania</i>	Infecção visceral, cutânea e mucocutânea	
		<i>Tiypansoma</i>	Doença do sono	
			Doença de Chagas	
			<i>Giardia</i>	Diarréia
			<i>Trichomonas</i>	Vaginite
		<i>Sarcodina</i> (pseudópodes)	<i>Entamoeba</i>	Disenteria, abscesso no fígado
			<i>Dientamoeba</i>	Colite
			<i>Naegleria e Acanthamoeba</i>	Sistema nervoso central úlcera na córnea
			<i>Babesia</i>	Babesia
	<i>Apicomplexa</i> (complexo apical)		<i>Plasmodium</i>	Malária
		<i>Isospora</i>	Diarréia	
		<i>Sarcocystis</i>	Diarréia	
		<i>Cryptosporidium</i>	Diarréia	

Protozoário parasítico exemplar e doenças humanas associadas			
Filo	Subfilo	Gêneros representativos	Distúrbio ou doença humana
		<i>Toxoplasma</i>	Toxoplasmose
		<i>Eimeria</i>	Cocodiose em galinha
<i>Microspora</i>		<i>Enterocytozoon</i>	Diarréia
<i>Ciliophora</i> (com cílios)		<i>Balantidium</i>	Disenteria
Não classificado		<i>Pneumocystis</i>	Pneumonia

[00251] Em particular, os compostos desta invenção são efetivos contra ectoparasitas incluindo: moscas tais como *Haematobia (Lyperosia) irritans* (moscas dos chifres), *Stomoxys calcitrans* (mosca dos estábulos), *Simulium* spp. (mosca negra), *Glossina* spp. (moscas tse-tse), *Hydrotaea irritans* (mosca da cabeça), *Musca autumnalis* (mosca da face), *Musca domestica* (mosca doméstica), *Morellia simplex* (mosca de doces), *Tabanus* spp. (mosca de cavalos), *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Lucilia sericata*, *Lucilia cuprina* (mosca varejeira verde), *Calliphora* spp. (mosca varejeira), *Protophormia* spp., *Oestrus ovis* (mosca varejeira nasal), *Culicoides* spp. (mosquitos-pólvora), *Hippobosca equina*, *Gastrophilus instestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* e *Gastrophilus nasalis*; piolhos tais como *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Bovicola equi*, *Haematopinus asini*, *Felicola subrostratus*, *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* e *Trichodectes canis*; carrapatos de ovelha tal como *Melophagus ovinus*; pequenos acarinos tal como *Psoroptes* spp., *Sarcoptes scabiei*, *Chorioptes bovis*, *Demodex equi*, *Cheyletiella* spp., *Notoedres cati*, *Trombicula* spp. e *Otodectes cyanotis* (pequenos acarinos do ouvido); carrapatos tais como *Ixodes* spp., *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp.,

Amblyomma spp., *Dermacentor* spp., *Hyalomma* spp. e *Haemaphysalis* spp.; e pulgas tais como *Ctenocephalides felis* (pulga de gato) e *Ctenocephalides canis* (pulga de cachorro).

[00252] Compostos ou agentes biologicamente ativos usados nas composições da presente invenção incluem os pesticidas organofosforados. Esta classe de pesticidas tem ampla atividade como inseticida e, em certos exemplos, atividade anti-helmíntica. Os pesticidas organofosforados incluem, por exemplo, dicrotofós, terbufós, dimetoato, diazinon, dissulfoton, triclorfom, azinfós-metila, clorpirifós, malationa, oxidemeton-metila, metamidofós, acefato, parationa etila, parationa metila, mevinfós, forato, carbofention e fosalone. Pretende-se também que incluam combinações dos métodos e compostos inventivos com pesticidas, tipo carbamato, incluindo, por exemplo, carbarila, carbofuran, aldicarbe, molinato, metomil, etc., bem como combinações com os pesticidas tipo organocloro. Pretende-se adicionalmente que incluam combinações com pesticidas biológicos, incluindo repelentes, as piretrinas (bem como variações sintéticas destes, por exemplo, aletrina, resmetrina, permetrina, tralometrina), e nicotina, que é frequentemente empregada como um acaricida. Outras combinações pretendidas são com pesticidas mistos incluindo: *Bacillus thuringiensis*, clorobenzilato, formamidinas (por exemplo, amitraz), compostos de cobre (por exemplo, hidróxido de cobre e sulfato de oxicloreto cúprico), ciflutrina, cipermetrina, dicofol, endossulfam, esfenvalerato, fenvalerato, lambda-Cialotrina, metóxicloro e enxofre.

[00253] De nota são compostos ou agentes biologicamente ativos adicionais selecionado de anti-helmínticos conhecidos na técnica, tais como, por exemplo, lactonas macrocíclicas (por exemplo, ivermectina, moxidectina, milbemicina), benzimidazóis (por exemplo, albendazol, triclabendazol), salicilanilidas (por exemplo, closantel, oxiclozanida), fenos substituídos (por exemplo, nitroxinila), pirimidinas (por exemplo, pirantel), imidazotiazóis (por

exemplo, levamisol), depsipeptídeos cíclicos (por exemplo, emodepsídeo), sais de piperazina, nitroscanato e praziquantel.

[00254] Outros compostos ou agentes biologicamente ativos usados nas composições da presente invenção podem ser selecionados de reguladores de crescimento de insetos (IGRs) e análogos do hormônio juvenil (JHAs) tais como diflubenzurom, triflumurom, fluazurom, ciromazina, metopreno, etc., fornecendo por meio disso, tanto controle inicial, quanto sustentado de parasitas (em todos os estágios de desenvolvimento de insetos, incluindo ovos) no sujeito animal, bem como no ambiente do sujeito animal.

[00255] De nota são compostos ou agentes biologicamente ativos usados nas composições da presente invenção selecionados da classe avermectina de compostos antiparasíticos. Da maneira declarada anteriormente, sabe-se que a família avermectina de compostos inclui agentes antiparasíticos conhecidos muito potentes e é usada contra um amplo espectro de endoparasitas e ectoparasitas em mamíferos.

[00256] Um composto preferido para uso no escopo da presente invenção é ivermectina. Ivermectina é um derivado semissintético de avermectina e, em geral, é produzido como uma mistura de pelo menos 80% de 22,23-diidroavermectina B_{1a} e menos que 20% de 22,23-diidroavermectina B_{1b}. A ivermectina é revelada na patente U.S. 4.199.569. A abamectina é uma avermectina que é revelada como avermectina B_{1a}/B_{1b} na patente U.S. 4.310.519. A abamectina contém pelo menos 80% de avermectina B_{1a} e não mais que 20% de avermectina B_{1b}.

[00257] Outra avermectina preferida é doramectina, também conhecida como 25-cicloexil-avermectina B₁. A estrutura e preparação de doramectina são reveladas em patente U.S. 5.089.480.

[00258] Outra avermectina preferida é moxidectina. A moxidectina, também conhecida como LL-F28249 alfa, é conhecida a partir da patente U.S.

4.916.154.

[00259] Outra avermectina preferida é selamectina. A selamectina é 25-ciclohexil-25-de(1-metilpropil)-5-deoxi-22,23-diidro-5-(hidroxiimino)-avermectina B₁ monossacarídeo.

[00260] Milbemicina, ou B₄₁, é uma substância que é isolada a partir do caldo de fermentação de uma amostra de *Streptomyces* produtora de milbemicina. O microrganismo, as condições de fermentação e os procedimentos de isolamento estão descritos nas patentes U.S. 3.950.360 e 3.984.564.

[00261] A emamectina (4"-deóxi-4"-epi-metilaminoavermectina B₁), que pode ser preparada da maneira descrita nas patentes U.S. 5.288.710 e 5.399.717, é uma mistura de dois homólogos, 4"-deóxi-4"-epi-metilaminoavermectina B_{1a} e 4"-deóxi-4"-epi-metilaminoavermectina B_{1b}. Preferivelmente, um sal de emamectina é usado. Exemplos não limitantes de sais de emamectina que podem ser usados na presente invenção incluem os sais descritos na patente U.S. 5.288.710, por exemplo, sais derivados de ácido benzóico, ácido benzóico substituído, ácido benzenossulfônico, ácido cítrico, ácido fosfórico, ácido tartárico, ácido maléico e similares. Mais preferivelmente, o sal de emamectina usado na presente invenção é benzoato de emamectina.

[00262] A eprinomectina é quimicamente conhecida como 4"-epi-acetilamino-4"-deóxi-avermectina B₁. A eprinomectina foi desenvolvida especificamente para ser usada em todas as classes de gado e grupos de idade. Foi a primeira avermectina a mostrar atividade de amplo espectro tanto contra endo, quanto contra ectoparasitas e, também, deixando ao mesmo tempo mínimos resíduos em carne e leite. Tem a vantagem adicional de ser altamente potente quando liberada topicamente.

[00263] A composição da presente invenção compreende opcionalmente combinações de um ou mais dos seguintes compostos antiparasitários: compostos de imidazo[1,2-b]piridazina da maneira descrita por

pedido de publicação de patente U.S. 2005/0182059 A1; compostos de 1-(4-mono e di-halometilssulfonilfenil)-2-acilamino-3-fluoropropanol, da maneira descrita por patente U.S. 7.361.689; derivados de éter trifluormetanossulfonanilida oxima, da maneira descrita por patente U.S. 7.312.248; e derivados de *n*-[(feniloxi)fenil]-1,1,1-trifluormetanossulfonamida e *n*-[(fenilsulfanil)fenil]-1,1,1-trifluormetanossulfonamida, da maneira descrita por pedido de publicação de patente PCT WO 2006/135648.

[00264] As composições da presente invenção também podem compreender adicionalmente um vermífico para fasciola. Vermíficos para fasciolas adequados incluem, por exemplo, triclabendazol, fenbendazol, albendazol, clorsulon e oxibendazol. Percebe-se que as combinações anteriores podem incluir mais combinações de compostos ativos antibióticos, antiparasitários e antifasciola.

[00265] Além das combinações anteriores, pretende-se também fornecer combinações dos métodos e compostos inventivos, da maneira aqui descrita, com outros remédios de saúde animal tal como elementos traço, anti-inflamatórios, anti-infecciosos, hormônios, preparações dermatológicas, incluindo antissépticos e desinfetantes, e imunobiológicos tais como vacinas e antissoro para a prevenção de doenças.

[00266] Por exemplo, tais anti-infecciosos incluem um ou mais antibióticos que são opcionalmente coadministrados durante o tratamento usando os compostos ou métodos inventivos, por exemplo, em uma composição combinada e/ou em formas de dosagem separadas. Antibióticos adequados conhecidos na técnica com este propósito incluem, por exemplo, aqueles aqui listados a seguir.

[00267] Um antibiótico usado é florfenicol, também conhecido como D-(treo)-1-(4-metilssulfonilfenil)-2-dicloroacetamido-3-fluor-1-propanol. Outro composto antibiótico preferido é D-(treo)-1-(4-metilsulfonilfenil)-2-

difluoracetamido-3-flúor-1-propanol. Outro antibiótico usado é tianfenicol. Os processos para a fabricação destes compostos antibióticos e intermediários usados em tais processos são descritos nas patentes U.S. 4.31.857; 4.582.918; 4.973.750; 4.876.352; 5.227.494; 4.743.700; 5.567.844; 5.105.009; 5.382.673; 5.352.832 e 5.663.361. Outros análogos de florfenicol e/ou promedicamentos foram revelados e tais análogos também podem ser usado nas composições e métodos da presente invenção (ver, por exemplo, patentes U.S. 7.041.670 e 7.153.842).

[00268] Outro composto antibiótico usado é tilmicosina. Tilmicosina é um antibiótico macrolídeo que é quimicamente definido como 20-diidro-20-deoxi-20-(*cis*-3,5-dimetilpiperidina-1-yl)-desmicosina e é revelado na patente U.S. 4.820.695.

[00269] Outro antibiótico utilizado na presente invenção é tulatromicina. A tulatromicina pode ser preparada de acordo com os procedimentos apresentados na patente U.S. 6.825.327.

[00270] Mais antibióticos para uso na presente invenção incluem as cefalosporinas tais como, por exemplo, ceftiofur, cefquinoma, etc. A concentração de cefalosporina na formulação da presente invenção varia opcionalmente entre cerca de 1 mg/mL a 500 mg/mL.

[00271] Outro antibiótico usado inclui as fluorquinolonas, tal como, por exemplo, enrofloxacin, danofloxacin, difloxacin, orbifloxacin e marbofloxacin. No caso de enrofloxacin, esta pode ser administrada em uma concentração de cerca de 100 mg/mL. Danofloxacin pode estar presente em uma concentração de cerca de 180 mg/mL.

[00272] Outros antibióticos macrolídeos usados incluem compostos da classe de cetolídeos ou, mais especificamente, os azalídeos. Tais compostos são descritos, por exemplo, nas patentes U.S. 6.514.945, 6.472.371, 6.270.768, 6.437.151, 6.271.255, 6.239.12, 5.958.888, 6.339.063, e 6.054.434.

[00273] Outros antibióticos usados incluem as tetraciclina, particularmente clortetraciclina e oxitetraciclina. Outros antibióticos podem incluir β -lactâmicos tal como penicilinas, por exemplo, penicilina, ampicilina, amoxicilina, ou uma combinação de amoxicilina com ácido clavulânico ou outros inibidores de beta-lactamase.

[00274] Aplicações não agrônômicas no setor veterinário se dão por meios convencionais, tal como por administração enteral na forma de, por exemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, preparações encharcadas, granulados, pastas, bolo, procedimentos através de alimentação, ou supositórios; ou por administração parenteral, tal como por injeção (incluindo intramuscular, subcutânea, intravenosa, intraperitoneal) ou implantes; por administração nasal; por administração tópica, por exemplo, na forma de imersão ou banho de imersão, aspensão, lavagem, revestimento com pó, ou aplicação em uma pequena área do animal, e através de artigos tais como coleiras, etiquetas auriculares, fitas na causa, fitas nas patas ou cabrestos que compreendem compostos ou composições da presente invenção.

[00275] Quaisquer dos compostos da presente invenção, ou uma combinação adequada de tais compostos, podem ser administrados diretamente no sujeito animal e/ou indiretamente aplicando-o no ambiente local no qual o animal vive (tal como roupa de cama, caixas ou similares). A administração direta inclui colocar em contato a pele, película ou penas de um sujeito animal com os compostos, ou alimentando ou injetando os compostos no animal.

[00276] Os compostos da presente invenção podem ser administrados em uma forma de liberação controlada, por exemplo, em uma formulação de liberação lenta subcutânea, ou na forma de um dispositivo de liberação controlada fixa em um animal, tal como um colar de pulga. Colares para a liberação controlada de um agente inseticida para proteção em longo prazo contra infestação de pulga em um animal de companhia são conhecidos

na técnica e são descritos, por exemplo, nas patentes U.S. 3.852.416; 4.224.901; 5.555.848; e 5.184.573.

[00277] Tipicamente, uma composição parasiticida de acordo com a presente invenção compreende uma mistura de um composto da Fórmula 1 com um ou mais carreadores farmacêutica ou veterinariamente aceitáveis compreendendo excipientes e auxiliares selecionados quanto à via de administração pretendida (por exemplo, administração oral, tópica ou parenteral tal como injeção) e de acordo com a prática padrão. Além do mais, um carreador adequado é selecionado com base na compatibilidade com um ou mais ingredientes ativos na composição, incluindo tais considerações como estabilidade relativa ao pH e teor de umidade. Portanto, de nota, é uma composição para proteger um animal de uma praga parasítica de invertebrada compreendendo um composto da invenção (isto é, em uma quantidade parasiticida efetiva) e pelo menos um carreador veterinariamente aceitável.

[00278] Para administração parenteral, incluindo injeção intravenosa, intramuscular e subcutânea, um composto da presente invenção pode ser formulado em suspensão, solução ou emulsão em veículos oleosos ou aquosos, e pode conter adjuntos tais como agentes de suspensão, de estabilização e/ou de dispersão. Os compostos da presente invenção também podem ser formulados para injeção de bolos ou infusão contínua. Composições farmacêuticas para injeção incluem soluções aquosas preferivelmente em tampões fisiologicamente compatíveis contendo outros excipientes ou auxiliares como são conhecidos na tecnologia de formulação farmacêutica. Adicionalmente, suspensões dos compostos ativos podem ser preparadas em um veículo lipofílico. Veículos lipofílicos adequados incluem óleos graxos tais como óleo de gergelim, ésteres de ácido graxo sintéticos tais como oleato de etila e triglicerídeos, ou materiais tais como lipossomos. Suspensões aquosas de injeção podem conter substâncias que aumentam a viscosidade da

suspensão, tais como carboximetilcelulose de sódio, sorbitol ou dextran. Formulações para injeção podem ser apresentadas na forma de dosagem única, por exemplo, em ampolas ou em recipientes multidoses. Alternativamente, o ingrediente ativo pode estar na forma de pó para constituição com um veículo adequado, por exemplo, água sem pirogênio, estéril; antes do uso.

[00279] Além das formulações supradescritas, os compostos da presente invenção também podem ser formulados como uma preparação estoque. Tais formulações de ação prolongada podem ser administradas por implantação (por exemplo, subcutaneamente ou intramuscularmente) ou por injeção intramuscular ou subcutânea. Os compostos da presente invenção podem ser formulados para esta via de administração com materiais poliméricos ou hidrofóbicos adequados (por exemplo, em uma emulsão com um óleo farmacologicamente aceitável).

[00280] Para administração por inalação, os compostos da presente invenção podem ser distribuídos na forma de uma aspensão de aerossol usando uma embalagem pressurizada ou um nebulizador e um propulsor adequado, por exemplo, sem limitação, diclorodifluormetano, triclorofluormetano, diclorotetrafluoretano ou dióxido de carbono. No caso de um aerossol pressurizado, a dosagem única pode ser controlada fornecendo uma válvula para liberar uma quantidade métrica. Cápsulas e cartuchos, por exemplo, de gelatina para uso em um inalador ou insuflador podem ser formulados contendo uma mistura em pó do composto e uma base de pó adequada, tal como lactose ou amido.

[00281] Descobriu-se que os compostos da presente invenção têm propriedades farmacocinéticas e farmacodinâmicas favoráveis, fornecendo disponibilidade sistêmica a partir da administração oral e ingestão. Portanto, após a ingestão pelo animal a ser protegido, concentrações parasiticidas efetivas dos compostos da invenção na corrente sanguínea protegem o animal tratado das

pragas que sugam sangue, tais como pulgas, carrapatos e piolhos. Portanto, de nota, é uma composição para proteger um animal de uma praga parasítica invertebrada em uma forma para administração oral (isto é, compreendendo, além de uma quantidade parasiticida efetiva de um composto da invenção, um ou mais carreadores selecionados de aglutinantes e cargas adequados para administração oral e carreadores de concentrado de alimentação).

[00282] Para administração oral na forma de soluções (a forma mais facilmente disponível para absorção), emulsões, suspensões, pastas, géis, cápsulas, comprimidos, bolos, pós, grânulos, retenção no rúmen e blocos de alimento/água/sal, um composto da presente invenção pode ser formulado com aglutinantes/cargas conhecidos na tecnologia por serem adequados para composições de administração oral, tais como açúcares e derivados de açúcar (por exemplo, lactose, sacarose, manitol, sorbitol), amido (por exemplo, amido de milho, amido de trigo, amido de arroz, amido de batata), celulose e derivados (por exemplo, metilcelulose, carboximetilcelulose, etilidroxicelulose), derivados protéicos (por exemplo, zeína, gelatina) e polímeros sintéticos (por exemplo, álcool polivinílico, polivinilpirrolidona). Se desejado, lubrificantes (por exemplo, estearato de magnésio), agentes de desintegração (por exemplo, polivinilpirrolidona reticulada, ágar, ácido algínico) e corantes ou pigmentos podem ser adicionados. Pastas e géis também contêm frequentemente adesivos (por exemplo, acácia, ácido algínico, bentonita, celulose, goma xantana, silicato de alumínio e magnésio coloidal) para auxiliar na manutenção da composição em contato com a cavidade oral e não ser facilmente ejetada.

[00283] Uma modalidade preferida é uma composição formulada em um produto mastigável e/ou comestível (por exemplo, um petisco mastigável ou comprimido comestível). Um produto como este deveria ter de maneira ideal um gosto, textura e/ou aroma preferido pelo

animal a ser protegido de maneira a facilitar a administração oral do composto da fórmula 1.

[00284] Se as composições parasiticidas estão na forma de concentrados alimentícios, o carreador é tipicamente selecionado de alimento de alto desempenho, cereais alimentares ou concentrados protéicos. Tais composições contendo concentrados alimentícios podem, além dos ingredientes ativos parasiticidas, compreender aditivos promotores de saúde ou crescimento animal, melhorando a qualidade da carne de animais para abate ou usados de outra forma para criação animal. Estes aditivos podem incluir, por exemplo, vitaminas, antibióticos, quimioterápicos, bacteriostáticos, fungistáticos, coccidiostáticos e hormônios.

[00285] Os compostos da fórmula 1 também podem ser formulados em composições retais tais como supositórios ou enemas de retenção, usando, por exemplo, bases supositórias convencionais, tal como manteiga de cacau ou outros glicérides.

[00286] Formulações para administração tópica estão tipicamente sob a forma de pó, cremes, suspensão, aspensão, emulsão, espuma, pasta, aerossol, emplastro, pomada ou gel. Mais tipicamente, uma formulação tópica é uma solução solúvel em água, que pode estar na forma de um concentrado que é diluído antes do uso. As composições parasiticidas adequadas para administração tópica compreendem tipicamente um composto da presente invenção e um ou mais carreadores topicamente adequados. Em aplicações de uma composição parasiticida tópica em um animal como uma linha ou ponto (isto é, tratamento "em pontos"), o ingrediente ativo migra sobre a superfície do animal para cobrir a maioria ou toda a área da superfície externa. Como consequência, o animal tratado é particularmente protegido das pragas invertebradas que se alimentam da epiderme do animal, tais como carrapatos, pulgas e piolhos.

Portanto, formulações para administração tópica localizada compreendem frequentemente pelo menos um solvente orgânico para facilitar o transporte do ingrediente ativo sobre a pele e/ou penetração na epiderme do animal. Carreadores em tais formulações incluem propilenoglicol, parafinas, aromáticos, ésteres tais como miristato de isopropila, glicol éteres, álcoois tais como etanol, n-propanol, 2-octildodecanol ou álcool de oleíla; soluções em ésteres de ácidos monocarboxílicos, tal como miristato de isopropila, palmitato de isopropila, éster oxálico do ácido láurico, éster oleílico do ácido oléico, éster decila do ácido oléico, laurato de hexila, oleato de oleíla, oleato de decila, ésteres de ácido capríco de álcoois graxos saturados de comprimento de cadeias de C₁₂-C₁₈; soluções de ésteres de ácidos dicarboxílicos, tais como ftalato de dibutila, isoftalato de diisopropila, éster de diisopropila de ácido adípico, adipato de di-*n*-butila ou soluções de ésteres de ácidos alifáticos, por exemplo, glicóis. Pode ser vantajoso um inibidor de cristalização ou um dispersante conhecido da indústria farmacêutica ou cosmética também estar presente.

[00287] Uma formulação de aplicação direta também pode ser preparada para o controle de parasitas em um animal de valor agrícola. As formulações de aplicação direta desta invenção podem estar na forma de um líquido, pó, emulsão, espuma, pasta, aerossol, emplastro, pomada ou gel. Tipicamente, a formulação de aplicação direta é líquida. Estas formulações de aplicação direta podem ser aplicadas efetivamente em ovelha, gado, cabras, outros ruminantes, camelídeos, porcos e cavalos. A formulação de aplicação direta é tipicamente aplicada vertendo em uma ou diversas linhas ou em pontos na linha mediana dorsal (costas) ou ombro de um animal. Mais tipicamente, a formulação é aplicada vertendo-a ao longo do dorso do animal, próximo da espinha. A formulação também pode ser aplicada no animal por outros métodos convencionais, incluindo esfregar um

material impregnado por pelo menos uma pequena área do animal, ou aplicá-la usando um aplicador comercialmente disponível, por meio de uma seringa, por aspersão ou usando uma baia de aspersão. As formulações de aplicação direta incluem um carreador e podem também incluir um ou mais ingredientes adicionais. Exemplos de ingredientes adicionais adequados são estabilizantes tais como antioxidantes, agentes de expansão, conservantes, promotores de adesão, solubilizadores ativos tal como ácido oléico, modificadores de viscosidade, bloqueadores ou absorvedores de UV e corantes. Agentes ativos superficiais, incluindo agentes ativos superficiais aniônicos, catiônicos, não iônicos e anfólicos, também podem ser incluídos nestas formulações.

[00288] As formulações desta invenção incluem tipicamente um antioxidante, tal como BHT (hidroxitoluenobutilado). O antioxidante, em geral, está presente em quantidades de até 0,1 a 5% (peso/vol). Algumas das formulações exigem um solubilizador, tal como ácido oléico, para dissolver o agente ativo, particularmente se espinosade for usado. Os agentes de expansão comuns usados nestas formulações de aplicação direta incluem miristato de isopropila, palmitato de isopropila, ésteres de ácido caprílico/cáprico de álcoois graxos saturados C₁₂-C₁₈, ácido oléico, éster de oleíla, oleato de etila, triglicerídeos, óleos de silicone e éter de metil dipropileno glicol. As formulações de aplicação direta desta invenção são preparadas de acordo com técnicas conhecidas. Quando a formulação de aplicação direta é uma solução, o parasiticida/inseticida é misturado com o carreador ou veículo, usando aquecimento e agitação, se exigido. Ingredientes auxiliares ou adicionais podem ser adicionados à mistura de agente ativo e carreador, ou podem ser misturados com o agente ativo antes da adição do carreador. Se a formulação de aplicação direta for uma emulsão ou suspensão, as formulações podem ser preparadas de maneira

semelhante usando técnicas conhecidas.

[00289] Outros sistemas de liberação para compostos farmacêuticos relativamente hidrofóbicos podem ser empregados. Os lipossomas e emulsões são exemplos bem conhecidos de veículos ou carreadores de distribuição para medicamentos hidrofóbicos. Além do mais, solventes orgânicos tais como dimetilsulfóxido podem ser usados, se necessário.

[00290] Para aplicações agronômicas, a taxa de aplicação exigida para controle efetivo (isto é, "quantidade biologicamente efetiva") dependerá de tais fatores como a espécie de invertebrado a ser controlada, o ciclo de vida da praga, estágio de vida, seu tamanho, local, período do ano, plantação ou animal hospedeiros, comportamento alimentar, comportamento reprodutivo, umidade do ambiente, temperatura e similares. Em circunstâncias normais, taxas de aplicação de cerca de 0,01 a 2 kg de ingredientes ativos por hectare são suficientes para controlar pragas em ecossistemas agronômicas, mas apenas 0,0001 kg/hectare pode ser suficiente ou no máximo 8 kg/hectare pode ser exigido. Para aplicações não agronômicas, taxas de uso efetivo variarão de cerca de 1,0 a 50 mg/metro quadrado, mas apenas 0,1 mg/metro quadrado pode ser suficiente ou no máximo 150 mg/metro quadrado pode ser exigido. Os versados na técnica podem determinar facilmente a quantidade biologicamente efetiva necessária para o nível desejado de controle de pragas invertebradas.

[00291] Em geral, para uso veterinário, um composto da fórmula 1 é administrado em uma quantidade parasiticida efetiva em um animal a ser protegido das pragas parasíticas invertebradas. Uma quantidade parasiticida efetiva é a quantidade de ingrediente ativo necessária para atingir um efeito observável que diminui a ocorrência ou atividade das pragas parasíticas invertebradas-alvo.

[00292] Os versados na técnica perceberão que a dose parasiticamente efetiva pode variar para os vários compostos e composições da presente invenção, o efeito e duração parasítica desejada, a espécie de pragas parasíticas invertebradas alvo, o animal a ser protegido, o modo de aplicação e similares, e a quantidade necessária para atingir um resultado particular pode ser determinada por meio de experimento simples.

[00293] Para administração oral, subcutânea ou em pontos em animais homeotérmicos, uma dose de um composto da presente invenção administrada em intervalos adequados variam tipicamente de cerca de 0,01 mg/kg a cerca de 100 mg/kg e, preferivelmente, de cerca de 0,01 mg/kg a cerca de 30 mg/kg de peso corporal animal. Para outras administrações tópicas (por exemplo, dérmica), incluindo imersões e aspersões, uma dose contém tipicamente de cerca de 0,01 ppm a cerca de 150.000 ppm, mais tipicamente de cerca de 0,01 ppm a cerca de 100.000 ppm, preferivelmente de cerca de 0,01 ppm a cerca de 5.000 ppm, e acima de tudo preferivelmente de cerca de 0,01 ppm a cerca de 3.000 ppm, de um composto da presente invenção.

[00294] Intervalos adequados para a administração de compostos da presente invenção em animais homeotermos variam de cerca de diariamente a cerca de anualmente.

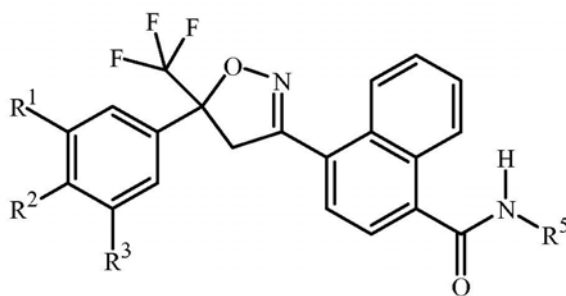
[00295] De nota são intervalos de administração que variam de cerca de semanalmente a cerca de uma vez a cada 6 meses. De particular nota são intervalos de administração mensais (isto é, administrar o composto ao animal uma vez a cada mês).

[00296] Os testes a seguir demonstram a eficiência de controle de compostos desta invenção em pragas específicas. "Eficiência de controle" representa a inibição de desenvolvimento de pragas parasíticas invertebradas (incluindo mortalidade) que causa alimentação

significativamente reduzida.

[00297] Entretanto, a proteção do controle de praga fornecida pelos compostos é não limitada a esta espécie. Ver tabelas de índice A-D para descrições do composto. As seguintes abreviações são usadas nas tabelas de índice a seguir: Pr é $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, *i*-Pr é $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ e *i*-Bu é $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$. (*R*) ou (*S*) denota a quiralidade absoluta do centro de carbono assimétrico. A abreviação “Ex.” significa “exemplo” e é seguida por um número que indica em qual exemplo síntese o composto é preparado.

TABELA ÍNDICE A



<u>COMPOSTO</u>	<u>R¹</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>m.p. (°C)</u>
1 (Ex. 4)	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	**
2	Cl	H	Cl	(S)-CH(<i>i</i> -Pr)C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
3	Cl	H	Cl	(S)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
4	Cl	H	Cl	C(CH ₃) ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
5	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH(CH ₃) ₂	*
6	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂	*
7	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)N(CH ₃)CH ₂ CH ₃	*
8	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₃	*
9	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
10	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	*
11	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OH	*
12	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	*
13	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	*
14	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	*
15	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
16	Cl	H	Cl	(R)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
17 (Ex. 1)	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	**
18 (Ex. 2)	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	**

<u>Composto</u>	<u>R¹</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>m.p. (°C)</u>
19	Cl	Cl	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
20 (Ex. 3)	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	**
21	Br	H	Br	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
22	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
23	Br	H	Br	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
24	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHC(CH ₃) ₃	*
25	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH(CH ₂ CH ₃) ₂	*
26	Cl	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
27	Cl	H	Cl	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	*
28	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	*
29	Cl	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	*
30	Cl	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	*
31	Cl	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)CH ₂ OH	*
32	Cl	H	Cl	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OH	*
33	Cl	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	*
34	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
35	CF ₃	H	H	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
36	CF ₃	H	H	CH ₂ CH(OH)CH ₃	*
37 (Ex. 5)	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	**
38	CF ₃	H	H	CH ₂ C(O)NHCH(CH ₃) ₂	*
39	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	*
40 (Ex. 6)	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ C(O)NHCH(CH ₃) ₂	**
41	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ OH	*
42	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	*
43	CF ₃	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ OH	*
44	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH(OH)CH ₃	*
45	CF ₃	H	H	CH ₂ C(OH)(CF ₃)CH ₃	*
46	CF ₃	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ OH	*
47	CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	*
48	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	*
49	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	*
50	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
51	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	*
52	CF ₃	H	Br	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
53	CF ₃	H	Br	CH ₂ C(O)NHCH(CH ₃) ₂	*
54	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	*
55	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ SCH(CH ₃) ₂	*

<u>Composto</u>	<u>R¹</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>m.p. (°C)</u>
56	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH(CH ₃) ₂	*
57	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ SC(CH ₃) ₃	*
58	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
59	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	*
60	CF ₃	H	CF ₃	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	*
61	CF ₃	H	H	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ OH	*
62	CF ₃	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	106-108
63	CF ₃	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH(CH ₃) ₂	*
64	CF ₃	H	H	CH ₂ CH(OH)CH ₂ CH ₃	*
65	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
66	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	*
67	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH(OH)CH ₃	*
68	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)CH ₂ OH	*
69	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OH	*
70	Br	H	H	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
71	OCF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
72	OCF ₃	H	H	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
73	F	H	F	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
74	F	H	H	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
75	F	H	F	CH ₂ C(O)NHCH(CH ₃) ₂	*
76	F	H	H	CH ₂ C(O)NHCH(CH ₃) ₂	*
77	F	H	F	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	156-160
78	F	H	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	146-150
79	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	*
80	F	H	F	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	171-175
81	F	H	H	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	152-156
82	Cl	H	Cl	CH ₂ OH	*
83	CF ₃	H	CF ₃	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	*
84	CF ₃	H	CF ₃	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHPr	*
85	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CF ₃	95-96
86	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)C(O)NHCH ₃	145-146
87	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	162-163
88	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CH ₃	168-170
89	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)C(O)NHPr	135-136
90	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	83-84
91	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃)CH ₃	101-102
92	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	*

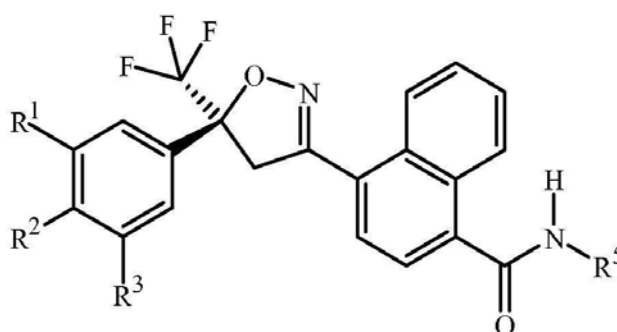
<u>Composto</u>	<u>R¹</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>m.p. (°C)</u>
93	CF ₃	H	CF ₃	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	*
94	CF ₃	H	CF ₃	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
95	CF ₃	H	CF ₃	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₃	*
96	CF ₃	H	CF ₃	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CH ₃	*
97	CF ₃	H	CF ₃	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ C(CH ₃) ₃	*
98	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₃	*
99	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CH ₃	*
100	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₃	92-97
101	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ CH ₃	*
102	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	94-99
103	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(CH ₃) ₃	102-105
104	CF ₃	H	CF ₃	(<i>S</i>)-CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃)CH ₃	100-105
105	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ C(O)NHCH ₃	*
106	CF ₃	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
107	CF ₃	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	*
108	CF ₃	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHPr	*
109	CF ₃	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₃	*
110	CF ₃	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CH ₃	*
111	CF ₃	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	*
112	CF ₃	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ C(CH ₃) ₃	*
113	CF ₃	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃)CH ₃	101-102
114	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	78-79
115	CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)C(O)NHCH(CF ₃)CH ₃	96-97
116	CF ₃	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₃	95-96
117	CF ₃	H	Cl	CH ₂ C(O)NHPr	101-102
118	CF ₃	H	Cl	CH ₂ C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	99-100
119	CF ₃	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₃	182-183
120	CF ₃	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ C(CH ₃) ₃	101-102
121	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)C(O)NHCH(CF ₃)CH ₃	93-94
122	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH(CF ₃)CH ₃	99-100
123	Cl	H	Cl	CH(CH ₃)C(O)NHCH(CF ₃)CH ₃	118-119
124	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ C(CH ₃) ₃	96-98
125	CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)C(O)NHCH ₃	104-105
126	CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CH ₃	85-86
127	CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CF ₃	90-92
128	CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)C(O)NH(<i>i</i> -Pr)	93-94
129	CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)C(O)NHPr	84-85

<u>Composto</u>	<u>R¹</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>m.p. (°C)</u>
130	CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)C(O)NH(<i>i</i> -Bu)	143-144
131	CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ C(CH ₃) ₃	91-92
132	CF ₃	H	F	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	*
133	CF ₃	H	F	CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₃	*
134	CF ₃	H	F	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃	*
135	CF ₃	H	F	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
136	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
137	CF ₃	H	F	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CH ₃	*
138	CF ₃	H	F	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₃	*
139	CF ₃	H	F	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
140	CF ₃	H	Br	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CF ₃	*
141	CF ₃	H	Br	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₃	*
142	CF ₃	H	Br	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)C(O)NHCH ₂ CH ₃	*
143	CF ₃	H	Br	CH ₂ C(O)NHCH ₃	*
144	CF ₃	H	Br	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₃	*
145	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CH ₂ Cl	*

* Ver Tabela D de Índice para dados RNM H1.

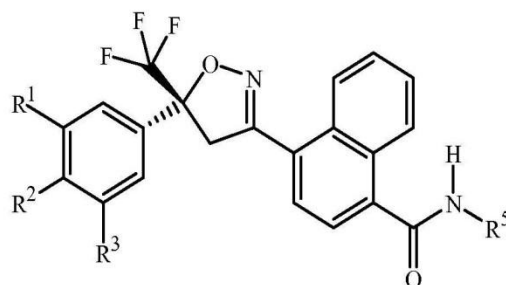
** Ver exemplo de síntese para dados RNM H1 .

TABELA ÍNDICE B



<u>Composto</u>	<u>R¹</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>m.p. (°C)</u>
173	Cl	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	84-86
174	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*

* Ver Tabela D de Índice para dados RNM H1.

TABELA ÍNDICE C

<u>Composto</u>	<u>R¹</u>	<u>R²</u>	<u>R³</u>	<u>R⁵</u>	<u>m.p.</u> <u>(°C)</u>
176	Cl	H	Cl	(<i>R</i>)-CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	*
177	Cl	H	Cl	CH ₂ C(O)NHCH ₂ CF ₃	*

*Ver Tabela D de Índice para dados RNMH1.

TABELA ÍNDICE D

<u>Composto</u>	Dados RNMH1 (solução CDCl ₃ a menos que de outra forma indicada) ^a
2	δ 8,82 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 7,44–7,67 (m, 7H), 6,96 (br t, 1H), 6,82 (d, 1H), 4,67 (t, 1H), 4,23 (d, 1H), 4,07 (m, 1H), 3,83 (m, 2H), 2,26 (m, 1H), 1,09 (d, 3H), 1,08 (d, 3H).
3	δ 8,81 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 7,41–7,66 (m, 7H), 7,21 (br t, 1H), 6,82 (m, 1H), 4,88 (m, 1H), 4,23 (d, 1H), 3,94 (m, 2H), 3,87 (d, 1H), 1,56 (d, 3H).
4	δ 8,77 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,39–7,67 (m, 7H), 6,63 (br s, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,98 (m, 2H), 3,88 (d, 1H), 1,74 (s, 6H).
5	δ 8,83 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,46–7,67 (m, 7H), 7,1 (br s, 1H), 6,20 (br s, 1H), 4,25 (d, 1H), 4,17 (d, 2H), 4,10 (m, 1H), 3,89 (d, 1H), 1,19 (d, 6H).
6	δ 8,83 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 7,46–7,67 (m, 7H), 7,08 (br s, 1H), 6,35 (br s, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,22 (d, 2H), 3,89 (d, 1H), 3,14 (t, 2H), 0,93 (d, 3H).
7	δ 8,85 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 7,46–7,70 (m, 7H), 7,20 (m, 1H), 4,37 & 4,33 (d, 2H), 4,27 (d, 1H), 3,91 (d, 1H), 3,49 & 3,39 (q, 2H), 3,04 & 3,00 (s, 3H), 1,27 & 1,16 (t, 3H).
8	δ 8,83 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,45–7,67 (m, 7H), 7,06 (br s, 1H), 6,26 (br s, 1H), 4,25 (d, 1H), 4,19 (d, 2H), 3,88 (d, 1H), 3,34 (m, 2H), 1,17 (t, 3H).
9	δ 8,75 (d, 1H), 8,14 (d, 1H), 7,46–7,59 (m, 5H), 7,37 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 7,02 (br t, 1H), 6,97 (br t, 1H), 4,21 (d, 1H), 3,71–3,88 (m, 5H), 2,64 (t, 2H).
10	δ 8,83 (d, 1H), 8,32 (d, 1H), 7,46–7,68 (m, 7H), 6,97 (br s, 1H), 6,72 (br s, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,24 (d, 2H), 3,89 (d, 1H), 3,65 (m, 4H).
11	δ 8,65 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,44–7,52 (m, 7H), 7,27 (d, 1H), 7,19 (d, 1H), 6,93 (br t, 1H), 4,16 (d, 1H), 3,81 (d, 1H), 3,73 (s, br, 2H), 3,53 (m, 2H), 3,27 (br s, 1H).

- 12 δ 8,82 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,46–7,67 (m, 7H), 6,98 (br s, 1H), 6,65 (br s, 1H), 4,58 (t, 1H), 4,46 (t, 1H), 4,25 (d, 1H), 4,24 (d, 2H), 3,88 (d, 1H), 3,67 (q, 2H), 3,60 (q, 2H).
- 13 δ 8,82 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,44–7,67 (m, 7H), 7,15 (m, 2H), 4,29 (d, 2H), 4,23 (d, 1H), 4,04 (dt, 2H), 3,87 (d, 1H).
- 14 δ 8,80 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 7,41–7,65 (m, 7H), 7,30 (t, 1H), 7,23 (t, 1H), 4,27 (d, 2H), 4,23 (d, 1H), 3,98 (dt, 2H), 3,87 (d, 1H).
- 15 δ 8,76 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,70 (s, 2H), 7,59 (m, 2H), 7,47 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 6,60 (br t, 1H), 4,23 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 3,71 (q, 2H), 2,78 (t, 2H), 2,15 (s, 3H).
- 16 δ 8,80 (d, 1H), 8,19 (d, 1H), 7,39–7,66 (m, 7H), 7,31 (t, 1H), 6,92 (m, 1H), 4,90 (m, 1H), 4,23 (d, 1H), 3,93 (m, 2H), 3,87 (d, 1H), 1,56 (d, 3H).
- 19 δ 8,80 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,69 (s, 2H), 7,63 (m, 2H), 7,54 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,19 (br t, 1H), 7,14 (br t, 1H), 4,28 (d, 2H), 4,24 (d, 1H), 3,94 (m, 2H), 3,87 (d, 1H).
- 21 δ 8,74 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 7,76 (s, 2H), 7,56 (m, 3H), 7,42 (d, 1H), 7,33 (d, 1H), 6,69 (br t, 1H), 4,21 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 3,67 (q, 2H), 2,76 (t, 2H), 2,14 (s, 3H).
- 22 δ 8,81 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,46–7,67 (m, 7H), 6,32 (br t, 1H), 4,25 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,65 (q, 2H), 2,64 (t, 2H), 2,13 (s, 3H), 1,99 (m, 2H).
- 23 δ 8,78 (d, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,34–7,76 (m, 9H), 4,25 (d, 2H), 4,21 (d, 1H), 3,89 (m, 2H), 3,85 (d, 1H).
- 24 δ 8,84 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 7,46–7,66 (m, 7H), 7,05 (t, 1H), 6,08 (d, 1H), 4,25 (d, 1H), 4,14 (d, 2H), 3,89 (d, 1H), 1,38 (s, 9H).
- 25 δ 8,83 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,46–7,66 (m, 7H), 7,18 (t, 1H), 6,17 (d, 1H), 4,25 (d, 1H), 4,22 (d, 2H), 3,88 (d, 1H), 3,80 (m, 1H), 1,57 (m, 2H), 1,40 (m, 2H), 0,90 (t, 6H).
- 26 δ 8,80 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,46–7,67 (m, 7H), 6,04 (d, 1H), 4,43 (m, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 2,64 (dt, 2H), 2,14 (s, 3H), 1,91 (q, 2H), 1,34 (d, 3H).
- 27 δ 8,81 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,46–7,66 (m, 7H), 6,02 (br s, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,14 (s, 2H), 2,21 (s, 3H), 1,58 (s, 6H).
- 28 δ 8,65 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,445–7,52 (m, 7H), 7,27 (d, 1H), 7,19 (d, 1H), 6,93 (br t, 1H), 4,16 (d, 1H), 3,81 (d, 1H), 3,73 (s, br, 2H), 3,53 (m, 2H), 3,27 (br s, 1H).
- 29 δ 8,79 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,44–7,66 (m, 7H), 6,18 (d, 1H), 4,52 (m, 1H), 4,25 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 2,79 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 1,40 (d, 3H).
- 30 δ 8,81 (d, 1H), 8,32 (d, 1H), 7,46–7,67 (m, 7H), 6,13 (d, 1H), 4,52 (m, 1H), 4,25 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 2,79 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 1,40 (d, 3H).
- 31 δ 8,78 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,40–7,64 (m, 7H), 6,31 (d, 1H), 4,37 (m, 1H), 4,23 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 3,83 (m, 1H), 3,66 (m, 1H), 2,65 (br t, 1H), 1,32 (d, 3H).
- 32 δ 8,81 (d, 1H), 8,23 (d, 1H), 7,46–7,68 (m, 7H), 6,09 (s, 1H), 4,31 (t, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,78 (d, 2H), 1,47 (s, 6H).
- 33 δ 8,82 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,43–7,66 (m, 7H), 7,00 (br t, 1H), 6,33 (br d, 1H), 4,77 (m, 1H), 4,24 (d, 1H), 4,07 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,54 (d, 3H), 1,18 (d, 6H).

- 34 δ 8,91 (d, 1H), 8,3 (m, 1H), 7,9 (m, 1H), 7,85 (m, 1H), 7,7–7,6 (m, 5H), 7,54 (d, 1H), 6,39 (br s, 1H), 4,32 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,78 (m, 2H), 2,83 (m, 2H), 2,17 (s, 3H).
- 35 δ 8,82 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,59–7,66 (m, 3H), 7,56 (d, 1H), 7,47 (d, 1H), 7,13 (br t, 1H), 7,09 (br t, 1H), 4,30 (d, 1H), 4,28 (d, 2H), 3,95 (m, 2H), 3,93 (d, 1H).
- 36 δ 8,90 (d, 1H), 8,28 (d, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,88 (m, 1H), 7,72 (m, 1H), 7,65–7,5 (m, 4H), 7,48 (m, 1H), 7,45 (m, 1H), 6,46 (br s, 1H), 4,32 (d, 1H), 4,1 (m, 1H), 3,94 (d, 1H), 3,77 (m, 1H), 3,4 (m, 1H), 1,3 (t, 3H).
- 38 δ 8,84 (d, 1H), 8,32 (d, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,63 (m, 4H), 7,50 (d, 1H), 7,01 (br t, 1H), 6,05 (br d, 1H), 4,32 (d, 1H), 4,17 (d, 1H), 3,94 (d, 1H), 1,19 (d, 1H).
- 39 δ ($\text{CD}_3\text{C}(\text{O})\text{CD}_3$) 8,90 (d, 1H), 8,40 (d, 1H), 8,1–8,0 (m, 3H), 7,9–7,8 (m, 3H), 7,7–7,6 (m, 3H), 4,65 (d, 1H), 4,45 (d, 1H), 3,97 (m, 2H), 3,53 (m, 2H), 3,07 (s, 3H).
- 41 δ ($\text{CD}_3\text{C}(\text{O})\text{CD}_3$) 8,85 (d, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,06 (s, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,85 (m, 1H), 7,8 (m, 1H), 7,75 (m, 1H), 7,7–7,5 (m, 3H), 4,59 (d, 1H), 4,40 (d, 1H), 4,25 (m, 1H), 4,1 (br s, 1H), 3,82 (m, 2H), 1,25 (d, 2H).
- 42 δ ($\text{CD}_3\text{C}(\text{O})\text{CD}_3$) 8,9 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 8,1–8,0 (m, 2H), 7,9–7,78 (m, 4H), 7,7–7,6 (m, 3H), 4,63 (d, 1H), 4,49 (d, 1H), 3,8 (m, 1H), 3,7 (m, 2H), 3,6 (m, 2H), 1,9–1,8 (m, 2H).
- 43 x δ ($\text{CD}_3\text{S}(\text{O})\text{CD}_3$) 8,9 (d, 1H), 8,5 (m, 1H), 8,22 (d, 1H), 8,0–7,9 (m, 4H), 7,8 (m, 1H), 7,7–7,6 (m, 3H), 4,6 (d, 1H), 4,38–4,32 (m, 2H), 3,4–3,3 (m, 2H, obscurecido parcialmente pela faixa de H_2O), 1,19 (s, 6H).
- 44 δ ($\text{CD}_3\text{C}(\text{O})\text{CD}_3$) 8,92 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 8,1–8,0 (m, 2H), 7,9–7,78 (m, 4H), 7,7–7,6 (m, 3H), 4,63 (d, 1H), 4,46 (d, 1H), 3,95 (m, 1H), 3,70 (m, 1H), 3,52 (m, 1H), 2,8 (br s, 1H), 1,8 (m, 1H), 1,66 (m, 1H), 1,20 (d, 3H).
- 45 δ 8,78 (d, 1H), 8,2 (d, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,86 (m, 1H), 7,72 (m, 1H), 7,68–7,52 (m, 3H), 7,5 (m, 1H), 7,4 (m, 1H), 6,68 (br s, 1H), 4,4 (br s, 1H), 4,28 (d, 1H), 3,9 (d, 1H), 3,75–3,85 (m, 2H), 1,44 (s, 3H).
- 46 δ ($\text{CD}_3\text{C}(\text{O})\text{CD}_3$) 8,9 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 8,05 (m, 2H), 7,88 (m, 1H), 7,82–7,78 (m, 2H), 7,7–7,6 (m, 3H), 7,47 (br d, 1H), 4,61 (d, 1H), 4,43 (d, 1H), 4,16 (m, 1H), 4,0 (m, 1H), 3,7 (m, 2H), 1,78 (m, 1H), 1,59 (m, 1H), 1,03 (t, 3H).
- 47 δ ($\text{CD}_3\text{C}(\text{O})\text{CD}_3$) 8,9 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 8,05 (m, 2H), 7,9–7,8 (m, 3H), 7,7–7,6 (m, 3H), 7,5 (br d, 1H), 4,62 (d, 1H), 4,5 (d, 1H), 4,42 (m, 1H), 3,58 (m, 1H), 3,46 (m, 1H), 3,37 (s, 3H), 1,22 (d, 3H).
- 48 δ ($\text{CD}_3\text{C}(\text{O})\text{CD}_3$) 8,91 (m, 1H), 8,35 (m, 1H), 8,04–8,08 (m, 2H), 7,78–7,90 (m, 4H), 7,62–7,71 (m, 3H), 4,64 (d, 1H), 4,48 (d, 1H), 3,60 (m, 2H), 2,68 (m, 2H), 2,57 (m, 2H), 1,97 (m, 2H), 1,23 (t, 3H).
- 49 δ 8,81 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,63 (m, 2H), 7,58 (d, 1H), 7,46 (d, 1H), 6,93 (br t, 1H), 4,36 (d, 1H), 4,05 (q, 2H), 3,94 (d, 1H), 3,41 (t, 2H), 3,01 (s, 3H).

- 50 δ 8,73 (d, 1H), 8,20 (d, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,87 (s, 2H), 7,55 (m, 2H), 7,39 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 6,75 (br t, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,89 (d, 1H), 3,66 (q, 2H), 2,75 (t, 2H), 2,13 (s, 3H).
- 51 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,92 (m, 1H), 8,41 (m, 1H), 8,05–8,07 (m, 2H), 7,63–7,90 (m, 7H), 4,64 (d, 1H), 4,48 (d, 1H), 3,68 (m, 2H), 2,86 (m, 2H), 2,64 (q, 2H), 1,27 (t, 3H).
- 52 δ 8,78 (d, 1H), 8,19 (d, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,87 (m, 2H), 7,35–7,63 (m, 6H), 4,28 (d, 1H), 4,25 (d, 2H), 3,89 (m, 3H).
- 53 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,91 (d, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,07 (s, 2H), 7,89 (br t, 1H), 7,86 (d, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,66 (m, 2H), 7,17 (br d, 1H), 4,66 (d, 1H), 4,56 (d, 1H), 4,09 (d, 2H), 4,03 (m, 1H), 1,14 (d, 6H).
- 54 δ 8,77 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,87 (s, 2H), 7,58 (m, 2H), 7,51 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,07 (br t, 1H), 4,27 (d, 1H), 3,99 (q, 2H), 3,37 (t, 2H), 2,99 (s, 3H).
- 55 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,91 (m, 1H), 8,40 (m, 1H), 8,04–8,08 (m, 2H), 7,62–7,90 (m, 7H), 4,64 (d, 1H), 4,47 (d, 1H), 3,65 (m, 2H), 3,07 (m, 1H), 2,86 (m, 2H), 1,26 (d, 6H).
- 56 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,91 (m, 1H), 8,35 (m, 1H), 8,04–8,07 (m, 2H), 7,61–7,91 (m, 7H), 4,63 (d, 1H), 4,47 (d, 1H), 3,59 (m, 2H), 2,97 (m, 1H), 2,69 (m, 2H), 1,95 (m, 2H), 1,24 (d, 6H).
- 57 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,92 (m, 1H), 8,41 (m, 1H), 8,04–8,08 (m, 2H), 7,62–7,90 (m, 7H), 4,64 (d, 1H), 4,48 (d, 1H), 3,64 (m, 2H), 2,90 (m, 2H), 1,36 (s, 9H).
- 58 δ 8,82 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,64 (m, 2H), 7,56 (d, 1H), 7,49 (d, 1H), 6,47 (br t, 1H), 4,37 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,75 (q, 2H), 2,81 (t, 2H), 2,16 (s, 3H).
- 59 δ 8,82 (d, 1H), 8,33 (d, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,65 (m, 2H), 7,58 (d, 1H), 7,50 (d, 1H), 6,11 (br d, 1H), 4,53 (m, 1H), 4,37 (d, 1H), 3,94 (d, 1H), 2,79 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 1,41 (d, 3H).
- 60 δ 8,81 (d, 1H), 8,32 (d, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,64 (m, 2H), 7,56 (d, 1H), 7,48 (d, 1H), 6,15 (br d, 1H), 4,52 (m, 1H), 4,37 (d, 1H), 3,94 (d, 1H), 2,79 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 1,40 (d, 3H).
- 61 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,91 (m, 1H), 8,35 (m, 1H), 8,0–8,08 (m, 3H), 7,80–7,91 (m, 3H), 7,65–7,75 (m, 3H), 4,65 (d, 1H), 4,50 (d, 1H), 4,23 (t, 1H), 3,40 (m, 2H), 3,34 (m, 2H), 0,97 (s, 6H).
- 63 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,92 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,08 (s, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,85 (br t, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,67 (m, 2H), 7,15 (br s, 1H), 4,67 (d, 1H), 4,57 (d, 1H), 4,09 (d, 2H), 4,05 (m, 1H), 1,15 (d, 6H).
- 64 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,91 (m, 1H), 8,38 (m, 1H), 8,04–8,08 (m, 2H), 7,62–7,90 (m, 7H), 4,64 (d, 1H), 4,48 (d, 1H), 4,04 (m, 1H), 3,76 (m, 1H), 3,62 (m, 1H), 3,42 (m, 1H), 1,60 (m, 1H), 1,51 (m, 1H), 1,01 (t, 3H).
- 65 δ 8,80 (d, 1H), 8,29 (d, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,62 (m, 2H), 7,53 (d, 1H), 7,45 (d, 1H), 6,51 (br t, 1H), 4,30 (d, 1H), 3,91 (d, 1H), 3,74 (q, 2H), 2,80 (t, 2H), 2,16 (s, 3H).
- 66 δ 8,80 (d, 1H), 8,29 (d, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,55–7,66 (m, 3H), 7,45 (d, 1H), 6,98 (br t, 1H), 4,29 (d, 1H), 4,04 (m, 2H), 3,91 (d, 1H), 3,41 (dd, 2H), 3,01 (s, 3H).
- 67 δ 8,70 (m, 1H), 8,12–8,19 (m, 3H), 8,01 (s, 1H), 7,23–7,57 (m, 4H), 6,87 (br m, 1H), 4,27 (d, 1H), 4,05 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,67 (m, 1H), 3,5 (br m, 1H), 3,32 (m, 1H), 1,25 (d, 3H).

- 68 δ 8,62 (m, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,05 (m, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,09–7,49 (m, 4H), 6,85 (br m, 1H), 4,24 (d, 1H), 4,18 (br m, 1H), 3,86 (d, 1H), 3,67 (m, 1H), 3,42–3,62 (br m, 2H), 1,24 (d, 3H).
- 69 δ 8,84 (m, 1H), 8,32 (m, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,50–7,70 (m, 4H), 6,47 (br m, 1H), 4,38 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,92 (m, 2H), 3,74 (m, 2H).
- 70 δ 8,78 (d, 1H), 8,24–8,12 (m, 1H), 8,18 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,66–7,30 (m, 9H), 4,29–4,18 (m, 3H), 3,95–3,84 (m, 3H).
- 71 δ 8,84–8,74 (m, 1H), 8,34–8,17 (m, 1H), 7,64–7,29 (m, 8H), 6,61 (s, 1H), 4,34–3,81 (m, 2H), 3,71 (q, 2H), 2,79 (t, 2H), 2,15 (s, 3H).
- 72 δ 8,80 (d, 1H), 8,30–8,17 (m, 1H), 7,67–7,49 (m, 7H), 7,44 (d, 1H), 7,32–7,19 (m, 2H), 4,35–4,15 (m, 3H), 4,01–3,82 (m, 3H).
- 79 δ 8,82 (m, 1H), 8,33 (m, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,46–7,68 (m, 4H), 7,29 (br m, 1H), 4,36 (d, 1H), 4,05 (m, 2H), 3,94 (d, 1H), 3,21 (m, 1H), 2,93 (m, 1H), 2,65 (s, 3H).
- 82 δ 8,80 (m, 1H), 8,27 (m, 1H), 7,64–7,52 (m, 5H), 7,45–7,40 (m, 2H), 7,13 (m, 1H), 5,01 (m, 2H), 4,20 (m, 1H), 3,88 (m, 2H).
- 83 δ 8,83 (m, 1H), 8,26 (m, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,43–7,66 (m, 4H), 7,04 (t, 1H), 6,34 (br d, 1H), 4,77 (m, 1H), 4,35 (d, 1H), 4,06 (m, 1H), 3,92 (d, 1H), 1,54 (d, 3H), 1,18 (d, 6H).
- 84 δ 8,82 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,40–7,65 (m, 4H), 7,09 (br t, 1H), 6,61 (br s, 1H), 4,82 (m, 1H), 4,34 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,25 (m, 2H), 1,55 (m, 5H), 0,92 (t, 3H).
- 92 δ 8,77 (m, 1H), 8,25 (m, 1H), 8,15 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,36–7,62 (m, 4H), 6,67 (br m, 1H), 4,34 (d, 1H), 3,93 (d, 1H), 3,68 (m, 2H), 2,81 (m, 2H), 2,58 (m, 2H), 1,29 (t, 3H).
- 93 δ 8,81 (m, 1H), 8,24 (m, 1H), 8,13 (s, 2H), 8,01 (s, 1H), 7,39–7,65 (m, 4H), 7,10 (m, 1H), 6,67 (m, 1H), 4,84 (m, 1H), 4,34 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,12 (m, 2H), 1,78 (m, 1H), 1,56 (d, 3H), 0,91 (d, 6H).
- 94 δ 8,80 (m, 1H), 8,19 (m, 1H), 8,13 (s, 2H), 8,01 (s, 1H), 7,30–7,65 (m, 5H), 6,95 (m, 1H), 4,90 (m, 1H), 4,33 (d, 1H), 3,91 (m, 3H), 1,57 (d, 3H).
- 95 δ 8,82 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,42–7,65 (m, 4H), 7,01 (br s, 1H), 6,51 (br s, 1H), 4,79 (m, 1H), 4,35 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 2,87 & 2,86 (s, 3H), 1,55 (d, 3H).
- 96 δ 8,82 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,43–7,66 (m, 4H), 7,00 (br s, 1H), 6,44 (br s, 1H), 4,78 (m, 1H), 4,36 (d, 1H), 3,93 (d, 1H), 3,33 (m, 2H), 1,55 (d, 3H), 1,17 (t, 3H).
- 97 δ 8,82 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 8,14 (s, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,41–7,66 (m, 4H), 7,05 (br t, 1H), 6,61 (br t, 1H), 4,87 (m, 1H), 4,35 (m, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,16 (m, 1H), 3,04 (m, 1H), 1,57 (d, 3H), 0,92 (s, 9H).
- 98 δ ($\text{CD}_3\text{C}(\text{O})\text{CD}_3$) 8,89 (m, 1H), 8,40 (s, 2H), 8,29–8,36 (m, 2H), 8,26 (s, 1H), 7,80 (m, 1H), 7,58–7,67 (m, 3H), 4,72 (d, 1H), 4,62 (d, 1H), 3,85 (m, 2H), 3,13 (m, 1H), 2,91 (m, 1H), 2,81 (m, 1H), 2,67 (m, 1H), 1,21 (t, 3H).
- 99 δ ($\text{CD}_3\text{C}(\text{O})\text{CD}_3$) 8,92 (m, 1H), 8,42 (m, 1H), 8,37 (s, 2H), 8,26 (s, 1H), 7,97 (br s, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,63–7,73 (m, 2H), 4,74 (d, 1H), 4,64 (d, 1H), 3,96 (m, 2H), 3,49 (m, 2H), 3,19 (m, 2H), 1,36 (t, 3H).

- 106 δ 8,78 (m, 1H), 8,18 (m, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,33–7,65 (m, 5H), 6,97 (m, 1H), 4,91 (m, 1H), 4,28 (d, 1H), 3,86–3,99 (m, 3H), 1,56 (d, 3H).
- 107 δ 8,82 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,45–7,65 (m, 4H), 6,96 (m, 1H), 6,24 (m, 1H), 4,75 (m, 1H), 4,30 (d, 1H), 4,10 (m, 1H), 3,91 (d, 1H), 1,54 (d, 3H), 1,20 (d, 6H).
- 108 δ 8,82 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,42–7,66 (m, 4H), 7,02 (br s, 1H), 6,52 (br s, 1H), 4,81 (m, 1H), 4,29 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,25 (m, 2H), 1,56 (m, 5H), 0,92 (t, 3H).
- 109 δ 8,83 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,45–7,67 (m, 4H), 6,88 (br s, 1H), 6,34 (br s, 1H), 4,78 (m, 1H), 4,30 (d, 1H), 3,91 (d, 1H), 2,89 & 2,87 (s, 3H), 1,55 (d, 3H).
- 110 δ 8,82 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,43–7,66 (m, 4H), 6,98 (br s, 1H), 6,44 (br s, 1H), 4,79 (m, 1H), 4,29 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,33 (m, 2H), 1,55 (d, 3H), 1,17 (t, 3H).
- 111 δ 8,82 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,41–7,65 (m, 4H), 7,08 (br t, 1H), 6,65 (br t, 1H), 4,84 (m, 1H), 4,29 (d, 1H), 3,89 (d, 1H), 3,12 (m, 2H), 1,55 (d, 3H), 0,91 (d, 6H).
- 112 δ 8,82 (m, 1H), 8,24 (m, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,40–7,65 (m, 4H), 7,10 (br t, 1H), 6,68 (br t, 1H), 4,88 (m, 1H), 4,28 (d, 1H), 3,89 (d, 1H), 3,17 (dd, 1H), 3,03 (dd, 1H), 1,57 (d, 3H), 0,91 (s, 9H).
- 132 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,90 (m, 1H), 8,41 (m, 1H), 7,62–7,93 (m, 8H), 4,65 (d, 1H), 4,52 (d, 1H), 3,69 (m, 2H), 2,81 (m, 2H), 2,17 (s, 3H).
- 133 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,88 (m, 1H), 8,36 (m, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,58–7,88 (m, 7H), 4,63 (d, 1H), 4,51 (d, 1H), 3,86 (m, 2H), 3,16 (m, 1H), 2,94 (m, 1H), 2,58 (s, 3H).
- 134 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,91 (m, 1H), 8,42 (m, 1H), 7,63–8,0 (m, 8H), 4,66 (d, 1H), 4,53 (d, 1H), 3,98 (m, 2H), 3,52 (m, 2H), 3,08 (s, 3H).
- 135 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,91 (m, 1H), 8,50 (m, 1H), 8,04 (br m, 1H), 7,64–8,0 (m, 8H), 4,67 (d, 1H), 4,54 (d, 1H), 4,25 (m, 2H), 4,02–4,11 (m, 2H).
- 136 δ 8,81 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,71–7,53 (m, 4H), 7,45 (d, 2H), 7,35 (s, 1H), 7,20–7,08 (m, 2H), 4,32–4,22 (m, 3H), 4,00–3,82 (m, 3H).
- 137 δ 8,78 (m, 1H), 8,20 (m, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,32–7,65 (m, 7H), 6,94 (br m, 1H), 4,80 (m, 1H), 4,27 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,28 (m, 2H), 1,50 (t, 3H), 1,12 (m, 3H).
- 138 δ 8,76 (m, 1H), 8,18 (m, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,31–7,64 (m, 7H), 7,04 (br m, 1H), 4,81 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 2,79 (m, 3H), 1,49 (m, 3H).
- 139 δ 8,75 (m, 1H), 8,13 (m, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,30–7,64 (m, 7H), 7,11 (br m, 1H), 4,88 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,83–3,96 (m, 3H), 1,52 (d, 3H).
- 140 δ 8,79 (m, 1H), 8,18 (m, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,87 (m, 2H), 7,36–7,64 (m, 5H), 7,02 (m, 1H), 4,90 (m, 1H), 4,27 (d, 1H), 3,85–3,98 (m, 3H), 1,54 (d, 3H).

- 141 δ 8,81 (d, 1H), 8,23 (d, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,87 (s, 2H), 7,37–7,63 (m, 4H), 7,12 (br t, 1H), 6,69 (br s, 1H), 4,81 (m, 1H), 4,28 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 2,84 (s, 3H), 1,54 (d, 3H).
- 142 δ 8,78 (d, 1H), 8,19 (d, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,87 (s, 2H), 7,32–7,62 (m, 5H), 6,96 (br s, 1H), 4,82 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,89 (d, 1H), 3,26 (m, 2H), 1,52 (d, 3H), 1,11 (t, 3H).
- 143 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,90 (m, 1H), 8,47 (m, 1H), 8,23 (s, 1H), 8,08 (s, 2H), 7,59–7,84 (m, 4H), 7,42 (br m, 1H), 6,87 (br m, 1H), 4,65 (d, 1H), 4,55 (d, 1H), 4,12 (m, 2H), 2,75 (d, 3H).
- 144 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,92 (m, 1H), 8,51 (m, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,06–8,10 (m, 2H), 7,85–7,93 (m, 2H), 7,63–7,80 (m, 3H), 7,31 (br m, 1H), 4,68 (d, 1H), 4,57 (d, 1H), 4,11 (m, 2H), 3,29 (m, 2H), 1,12 (t, 3H).
- 145 δ (CD₃C(O)CD₃) 8,89 (m, 1H), 8,46 (m, 1H), 8,40 (s, 2H), 8,25 (s, 1H), 8,07 (m, 1H), 7,59–7,83 (m, 5H), 4,71 (d, 1H), 4,62 (d, 1H), 4,17 (m, 2H), 3,65 (m, 2H), 3,58 (m, 2H).
- 173 δ 8,77 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,56–7,63 (m, 4H), 7,51 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 7,41 (d, 1H), 6,24 (d, 1H), 4,50 (m, 1H), 4,23 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 2,77 (m, 2H), 2,20 (s, 3H), 1,39 (d, 3H).
- 174 δ 8,82 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,56–7,68 (m, 5H), 7,46 (m, 2H), 7,04 (br s, 2H), 4,28 (d, 2H), 4,24 (d, 1H), 3,96 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
- 176 δ 8,82 (d, 1H), 8,35 (d, 1H), 7,62–7,69 (m, 2H), 7,60 (d, 1H), 7,56 (d, 2H), 7,51 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 6,06 (d, 1H), 4,54 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,89 (d, 1H), 2,80 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 1,41 (d, 3H).
- 177 δ 8,81 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,54–7,67 (m, 5H), 7,46 (m, 2H), 7,19 (br t, 1H), 7,13 (br t, 1H), 4,28 (d, 2H), 4,24 (d, 1H), 3,95 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).

a dados de ¹H NMR estão em campo baixo de ppm de tetrametilsilano. Ligações são designadas por (s)-simples, (d)-dupla, (t)-tripla, (q)-quádrupla, (dd)-duplete de dupletes, (dt)-duplete de tripletes, (br)-picos amplos, (m) – múltipla.

EXEMPLOS BIOLÓGICOS DA INVENÇÃO

[00298] Os testes a seguir demonstram a eficiência de controle de compostos desta invenção em pragas específicas. A "eficiência de controle" representa a inibição do desenvolvimento da praga de invertebrados (incluindo mortalidade) que causa alimentação significativamente reduzida. Entretanto, a proteção de controle de praga fornecida pelos compostos não é limitada a esta espécie. Ver tabelas de índice A-G para descrições do composto.

TESTE A

[00299] Para avaliar controle de traça das crucíferas (*Plutella xylostella*) a unidade teste consistiu em um pequeno recipiente aberto com uma planta de rabanete de 12 a 14 dias dentro. A planta foi pré-infestada com cerca de 50 larvas recém criadas que foram dispensadas na unidade teste por meio

de grão de sabugo de milho usando uma bazuca inoculadora. A larva mudou para a planta teste após ser dispensada na unidade teste.

[00300] Os compostos testes foram formulados usando uma solução contendo 10% de acetona, 90% de água e 300 ppm da agente tensoativo não iônico fórmula X-77™ Spreader Lo-Espuma contendo alquilarilpolioxietileno, ácidos graxos livres, glicóis e isopropanol (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA). Os compostos formulados foram aplicados em 1 mL de líquido por meio de um bico atomizador SUJ2 com corpo habitual 1/8 JJ (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA) posicionado a 1,27 cm (0,5 polegada) acima do topo de cada unidade teste.

[00301] Todos os compostos experimentais nestes testes foram aspergidos em 50 ppm, e o teste foi repetido três vezes. Após aspensão do composto teste formulado, cada unidade teste secou naturalmente por 1 h e então uma proteção de tela preta foi colocada por cima. As unidades testes foram mantidas por 6 dias em uma câmara de crescimento a 25 °C e 70% de umidade relativa. O dano à alimentação da planta foi então determinado visualmente com base na folhagem consumida e uma variação na mortalidade da praga também foi estimada e calculada para cada unidade teste.

[00302] Dos compostos da Fórmula 1 testados os seguintes forneceram níveis de eficiência de controle muito boa a excelente: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143 e 144.

TESTE B

[00303] Para avaliar controle de lagarta do cartucho (*Spodoptera frugiperda*) a unidade teste consistiu em um pequeno recipiente aberto com um pé de milho de 4 a 5 dias (milho) dentro. A amostra foi pré-infestada (usando um núcleo amostrador) com 10-15 larvas de 1 dia em um pedaço da dieta de inseto. Os compostos testes foram formulados e aspergidos em 50 ppm da maneira descrita para o teste A e repetidos três vezes. Após a aspersão, as unidades teste foram mantidas em uma câmara de crescimento e então a eficiência de controle foi calculada para cada unidade teste da maneira descrita para o teste A.

[00304] Dos compostos da Fórmula 1 testados os seguintes forneceram níveis de eficiência de controle muito boa a excelente: 1, 4, 5, 6, 7, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 43, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 58, 59, 60, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 79, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143 e 144.

TESTE C

[00305] Para avaliar controle de cigarrinha da batata (*Empoasca fabae*) através de meios de contato e/ou sistêmicos, a unidade teste consistiu em um pequeno recipiente aberto com um pé de feijão Soleil de 5 a 6 dias dentro (folhas primárias emergidas). Areia branca foi adicionada na superfície do solo e uma das folhas primárias foi cortada antes da aplicação. Os compostos testes foram formulados e aspergidos da maneira descrita para o teste A. Todos compostos experimentais nestes testes foram aspergidos em 250 ou 50 ppm de maneira observada, e o teste foi repetido três vezes. Após

aspersão, as unidades testes secaram naturalmente por 1 hora antes de serem pós-infestadas com 5 cigarrinhas da batata (adultos de 18 a 21 dias). Uma proteção de tela preta foi colocada por cima do cilindro. As unidades teste foram mantidas por 6 dias em uma câmara de crescimento a 19-21 °C e 50-70% de umidade relativa. A eficiência de controle de cada unidade teste foi então determinada visualmente pela mortalidade de insetos.

[00306] Dos compostos da Fórmula 1 testados a 250 ppm, os seguintes forneceram níveis de eficiência de controle muito boa a excelente (80% ou mais mortalidade): 3, 4, 5, 7, 8, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 26, 27, 29, 30, 33, 34, 35, 37, 38, 39, 40, 45, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 62, 63, 65, 66, 67, 68, 71, 72, 79, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134 e 135.

[00307] Dos compostos da Fórmula 1 testados a 50 ppm, os seguintes forneceram níveis de eficiência de controle muito boa a excelente (80% ou mais mortalidade): 3, 4, 5, 7, 8, 10, 12, 40, 45, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 57, 58, 59, 60, 62, 63, 65, 66, 71, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 26, 27, 29, 30, 33, 34, 35, 37, 38, 39, 72, 79, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 125, 126, 127, 128, 129, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143 e 144.

TESTE D

[00308] Para avaliar controle de cigarrinha do milho (*Peregrinus maidis*) através de meio de contato ou sistêmico, a unidade teste consistiu em um pequeno recipiente aberto com um pé de milho de 3 a 4 dias dentro (espiga). Areia branca foi adicionada na superfície do solo antes da aplicação.

Os compostos testes foram formulados e aspergidos em 250 ppm e repetidos três vezes da maneira descrita para o teste A. Após aspersão, as unidades testes secaram naturalmente por 1 hora antes de serem pós-infestadas com 10 a 20 cigarrinhas de milho (ninfas de 18 a 20 dias) espalhando-as na areia com um agitador de sal. Uma proteção de tela preta foi colocada na superfície do cilindro. As unidades testes foram mantidas por 6 dias em uma câmara de crescimento a 19-21 °C e 50-70% de umidade relativa. Cada unidade teste foi então determinada visualmente pela mortalidade de insetos.

[00309] Dos compostos testados, os seguintes resultaram em pelo menos 80% mortalidade: 4, 16, 21, 33, 50, 63, 65, 67, 68, 88, 95, 96, 100, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 119, 125, 126, 129, 132, 137, 138, 139, 140, 141 e 142.

TESTE E

[00310] Para avaliar o controle de tripídeos (*Frankliniella occidentalis*) através de meio de contato ou sistêmico, a unidade teste consistiu em um pequeno recipiente aberto com um pé de feijão Soleil de 5 a 7 dias dentro. Os compostos testes foram formulados e aspergidos da maneira descrita para o teste A. Todos os compostos experimentais nestes testes foram aspergidos em 250 ou 50 ppm da maneira observada, e o teste foi repetido três vezes. Após aspersão, as unidades testes secaram naturalmente por 1 hora e então 22 a 27 tripídeos adultos foram adicionados em cada unidade e então uma proteção de tela preta foi colocada por cima. As unidades testes foram mantidas por 6 dias a 25 °C e 45-55% de umidade relativa. Uma variação na mortalidade foi determinada junto com uma variação de dano à planta para cada unidade teste.

[00311] Dos compostos da Fórmula 1 testados a 250 ppm, os seguintes forneceram níveis de eficiência de controle muito boa a excelente (20% ou menos dano à alimentação ou 80% ou mais mortalidade): 1, 3, 4, 5,

6, 7, 8, 11, 12, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 58, 59, 60, 62, 63, 65, 66, 67, 73, 77, 79, 80, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 92, 94, 95, 96, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134 e 135.

[00312] Dos compostos da Fórmula 1 testados a 50 ppm, os seguintes forneceram níveis de eficiência de controle muito boa a excelente (20% ou menos dano à alimentação ou 80% ou mais mortalidade): 1, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 11, 12, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 44, 47, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 58, 59, 60, 62, 63, 65, 66, 67, 79, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 117, 119, 120, 122, 123, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 132, 133, 134, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143 e 144.

TESTE F

[00313] Para avaliar controle de pulgão (*Myzus persicae*) através de meio de contato ou sistêmico, a unidade teste consistiu em um pequeno recipiente aberto com uma planta de rabanete de 12 a 15 dias dentro. A amostra foi pré-infestada colocando 30 a 40 pulgões da folha da planta teste em um pedaço da folha cortada de uma planta de cultura (método de folha cortada). A larva mudou para a planta teste a medida em que o pedaço da folha foi dissecado. Após pré-infestação, o solo da unidade teste foi coberto com uma camada de areia.

[00314] Os compostos testes foram formulados e aspergidos da maneira descrita para o teste A. Todos compostos experimentais nestes testes foram aspergidos em 250 ppm, e o teste foi repetido três vezes. Após aspersão do composto teste formulado, cada unidade teste secou naturalmente por 1 hora e então uma proteção de tela preta foi colocada por

cima. As unidades testes foram mantidas por 6 dias em uma câmara de crescimento a 19-21 °C e 50-70% de umidade relativa. Cada unidade teste foi então determinada visualmente pela mortalidade de insetos.

[00315] Dos compostos da fórmula 1 testados, os seguintes resultaram em pelo menos 80% mortalidade: 1, 4, 5, 6, 7, 8, 10, 12, 15, 16, 40, 47, 50, 52, 92, 94, 95, 96, 19, 21, 22, 23, 27, 30, 33, 67, 68, 79, 83, 34, 35, 37, 38, 86, 88, 89, 91, 53, 54, 58, 60, 62, 63, 65, 66, 98, 100, 101, 102, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 113, 114, 116, 117, 118, 119, 122, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 132, 133, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143 e 144.

TESTE G

[00316] Para avaliar controle de pulgões de algodoeiro (*Aphis gossypii*) através de meio de contato ou sistêmico, a unidade teste consistiu em um pequeno recipiente aberto com uma planta de algodão de 6 a 7 dias dentro. A amostra foi pré-infestada com 30 a 40 insetos em um pedaço de folha de acordo com o método de folha cortada descrito para o teste F, e o solo da unidade teste foi coberto com uma camada de areia.

[00317] Os compostos testes foram formulados e aspergidos em 250 ppm e o teste foi repetido três vezes. Após aspersão, as unidades teste foram mantidas em uma câmara de crescimento e então determinados visualmente pela mortalidade de insetos.

[00318] Dos compostos testados, os seguintes resultaram em pelo menos 80% de mortalidade: 1, 8, 10, 19, 21, 23, 30, 33, 34, 38, 40, 47, 50, 52, 53, 55, 58, 60, 63, 65, 67, 68, 69, 79, 84, 88, 95, 96, 100, 101, 106, 107, 108, 109, 110, 117, 119, 125, 126, 132, 133, 135, 137, 138, 139, 141, 142, 143 e 144.

TESTE H

[00319] Para avaliar o controle de mosca branca (*Bemisia*

tabaci), a unidade teste consistiu em um pé de algodão de 14 a 21 dias crescido em meios de Redi-earth® (Scotts Co.) com pelo menos duas folhas verdadeiras infestadas com ninfas de 2º e 3º estágios larvais no lado inferior das folhas.

[00320] Os compostos testes foram formulados em não mais que 2 mL de acetona e então diluídos com água em 25-30 mL. Os compostos formulados foram aplicados usando um jato de ar plano assistido (Spraying Systems 122440) a 69 kPa.

[00321] As plantas foram aspergidas para escorrer em um aspersor de mesa rotatória (publicação de patente EP-1110617-AI). Todos os compostos experimentais nesta triagem foram aspergidos a 250 ppm e repetidos três vezes.

[00322] Após aspersão do composto teste, as unidades testes foram mantidas por 6 dias em uma câmara de crescimento a 50-60% de umidade relativa e temperatura de 28 °C durante o dia e 24 °C a noite. Então as folhas foram removidas e então ninfas mortas e vivas foram contadas para calcular a mortalidade percentual.

[00323] Dos compostos da fórmula 1 testados, os seguintes resultaram em pelo menos 80% de mortalidade: 1, 7, 8, 16, 33, 35, 40, 47, 52, 53, 62, 63, 65, 67, 68, 70, 84, 85, 86, 88, 89, 94, 95, 96, 100, 101, 106, 107, 108, 109, 110, 117, 119, 122, 125, 126, 127, 129, 135, 136, 137, 139, 140, 141 e 142.

TESTE I

[00324] Para avaliar o controle da pulga de gato (*Ctenocephalides felis*), um camundongo CD-1® (cerca de 30 g, macho, obtido do Charles River Laboratories, Wilmington, MA) foi dosado oralmente com um composto teste em uma quantidade de 10 mg/kg solubilizado em propilenoglicol/glicerol formal (60:40). Duas horas após a administração oral

do composto teste, aproximadamente 8 a 16 pulgas adultas foram aplicadas em cada camundongo. As pulgas foram então avaliadas pela mortalidade 48 horas após a aplicação da pulga no camundongo.

[00325] Dos compostos da fórmula 1 testados, os seguintes compostos causaram 50% ou mais mortalidade: 1, 4, 5, 7, 8, 10, 11, 12, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 26, 27, 29, 30, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 44, 49, 50, 52, 53, 54, 58, 59, 60, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 69, 70, 71, 72, 75, 79, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 94, 95, 96, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 110, 111, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 125, 126, 127, 128, 129, 132, 133, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 165, 168, 170, 172, 173, 174 e 177.

TESTE J

[00326] Para avaliar o controle da pulga de gato (*Ctenocephalides felis*), um camundongo CD-1[®] (cerca de 30 g, macho, obtido do Charles River Laboratories, Wilmington, MA) foi dosado oralmente com um composto teste em uma quantidade de 10 mg/kg solubilizado em propileno glicol/glicerol formal (60:40). Vinte e quatro horas após a administração oral do composto teste, aproximadamente 8 a 16 pulgas adultas foram aplicadas em cada camundongo. As pulgas foram então avaliadas pela mortalidade 48 horas após a aplicação da pulga no camundongo.

[00327] Dos compostos da fórmula 1 testados, os seguintes compostos causaram 50% ou mais mortalidade: 1, 4, 5, 11, 12, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 23, 27, 29, 30, 34, 35, 37, 40, 49, 50, 52, 53, 54, 58, 60, 62, 63, 65, 66, 68, 70, 79, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 91, 92, 95, 96, 98, 99, 100, 101, 102, 104, 105, 106, 107, 108, 110, 111, 112, 113, 114, 116, 125, 126, 127, 128, 132, 133, 135, 136, 137, 138, 140, 141, 142, 173, 174 e 177.

TESTE K

[00328] Para avaliar o controle da pulga de gato (*Ctenocephalides felis*), um camundongo CD-1[®] (cerca de 30 g, macho, obtido do Charles River Laboratories, Wilmington, MA) foi dosado subcutaneamente com um composto teste em uma quantidade de 10 mg/kg solubilizado em propilenoglicol/glicerol formal (60:40). Duas horas após a administração do composto teste, aproximadamente 8 a 16 pulgas adultas foram aplicadas em cada camundongo. As pulgas foram então avaliadas pela mortalidade 48 horas após a aplicação da pulga no camundongo.

[00329] Dos compostos da fórmula 1 testados, os seguintes compostos causaram 50% ou mais mortalidade: 1, 4 e 11.

TESTE L

[00330] Para avaliar o controle da pulga de gato (*Ctenocephalides felis*), um composto teste foi solubilizado em acetona/água (75:25) para fornecer uma concentração teste final de 500 ppm. Então 20 µL da solução 500 ppm foram aplicados em papel filtro no fundo de um tubo. O tubo secou naturalmente por 3 horas. Então aproximadamente 10 pulgas adultas foram adicionadas ao tubo e o tubo foi tampado. As pulgas foram avaliadas pela mortalidade após 48 horas.

[00331] Dos compostos da fórmula 1 testados, os seguintes compostos causaram 50% ou mais mortalidade: 1, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 28, 34, 35, 37, 40, 52, 58, 62 e 66.

TESTE M

[00332] Para avaliar controle do carrapato da febre recorrente (*Ornithodoros turicata*), um composto teste foi solubilizado em propilenoglicol/glicerol formal (60:40) e então diluído em sangue bovino para fornecer uma concentração teste final de 30 ppm. O sangue tratado foi colocado em um tubo, e o topo do tubo foi coberto com uma membrana.

Aproximadamente 5 ninfas de *Ornithodoros turicata* foram colocadas na membrana e alimentadas naturalmente no sangue tratado até devorarem completamente. Os carrapatos foram então avaliados pela mortalidade após 48 horas.

[00333] Dos compostos da fórmula 1 testados, os seguintes compostos causaram 50% ou mais mortalidade: 1, 5, 15, 16 e 20.

TESTE N

[00334] Para avaliar o controle da pulga de gato (*Ctenocephalides felis*), um *beagle* de seis meses de idade ou mais foi infestado com 100 pulgas adultas. Um dia depois, o *beagle* foi oralmente dosado com um composto teste em uma quantidade de 2,5 mg/kg solubilizado em propilenoglicol/glicerol formal (60:40). O cão foi infestado novamente com 100 pulgas adultas 6, 13, 20 e 27 dias após a administração oral do composto teste. O cão foi escovado um dia após a administração oral do composto teste, e novamente um dia após cada de a infestação subsequente (isto é, 7, 14, 21 e 28 dias após a administração oral do composto teste) para remover as pulgas. As pulgas coletadas foram contadas e avaliadas pela mortalidade.

[00335] Dos compostos da fórmula 1 testados, os seguintes resultaram em pelo menos 90% de mortalidade por 29 dias: 1, 37, 40, 49, 52, 58, 62, 66 e 94.

TESTE O

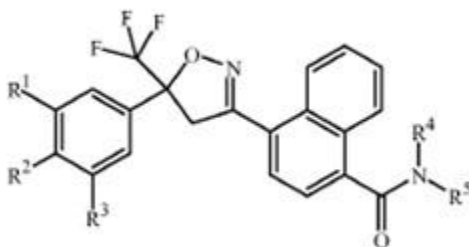
[00336] Para avaliar o controle do carrapato de cão Americano (*Dermacentor variabilis*), um *beagle* de seis meses de idade ou mais foi oralmente dosado com um composto teste em uma quantidade de 2,5 mg/kg solubilizada em propilenoglicol/glicerol formal (60:40). O cão foi infestado em seguida com 50 carrapatos de cão Americanos adultos 2, 9, 16, 23 e 30 dias após a administração oral do composto teste. O cão foi escovado 2 dias

após cada infestação (isto é, 4, 11, 18, 25 e 32 dias após a administração oral do composto teste) para remover os carrapatos. Os carrapatos coletados foram contados e avaliados pela mortalidade.

[00337] Dos compostos da fórmula 1 testados, os seguintes resultaram em pelo menos 90% de mortalidade por 32 dias: 1, 37 e 62.

REIVINDICAÇÕES

1. COMPOSTO, caracterizado pelo fato de ser de fórmula 1,



1

em que

R¹ é CF₃;

R² é H;

R³ é Cl;

R⁴ é H; e

R⁵ é CH₂C(O)NHCH₂CF₃.

2. MÉTODO PARA CONTROLE DE UMA PRAGA INVERTEBRADA, caracterizado pelo fato de que compreende contactar a praga invertebrada ou seu ambiente com uma quantidade biologicamente efetiva de um composto, conforme definido na reivindicação 1, com a condição de que o método não é um método de tratamento do corpo humano ou animal.

3. USO DE UM COMPOSTO DE FÓRMULA 1, conforme definido na reivindicação 1, caracterizado pelo fato de ser na fabricação de medicamento para proteger um animal contra uma praga parasítica invertebrada.

4. USO, de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que o medicamento é um medicamento oral.

5. USO, de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que o medicamento é um medicamento parenteral.

6. USO, de acordo com a reivindicação 5, caracterizado pelo

fato de que o medicamento é um medicamento injetável.

7. USO, de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que o medicamento é um medicamento tópico.

8. USO, de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que o animal é um mamífero, ave ou peixe.

9. USO, de acordo com a reivindicação 8, caracterizado pelo fato de que o animal é um animal de criação doméstica.

10. USO, de acordo com a reivindicação 8, caracterizado pelo fato de que o animal é um canino.

11. USO, de acordo com a reivindicação 8, caracterizado pelo fato de que o animal é um felino.

12. USO, de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que a praga parasítica invertebrada é um ectoparasita.

13. USO, de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que a praga parasítica invertebrada é um artrópode.

14. USO, de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que a praga parasítica invertebrada é uma mosca, mosquito, ácaro, carrapato, piolho, pulga, larva de mosca, percevejo ou barbeiro.

15. USO, de acordo com a reivindicação 14, caracterizado pelo fato de que o animal é um gato ou cão e a praga parasítica invertebrada é uma pulga, carrapato ou ácaro.