



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

(21) **PI0806214-5 A2**

(22) Data de Depósito: 18/01/2008
(43) Data da Publicação: 30/08/2011
(RPI 2121)



(51) *Int.Cl.:*
C07D 401/14
C07D 417/04
C07D 417/14
C07D 409/14
C07D 405/14
C07D 413/14
A01N 43/78
A01P 3/00

(54) Título: **COMPOSTO, MÉTODO PARA O CONTROLE DAS DOENÇAS VEGETAIS CAUSADAS POR PATÓGENOS VEGETAIS FÚNGICOS OOMYCETE E COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS**

(30) Prioridade Unionista: 25/01/2007 US 60/897,792

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

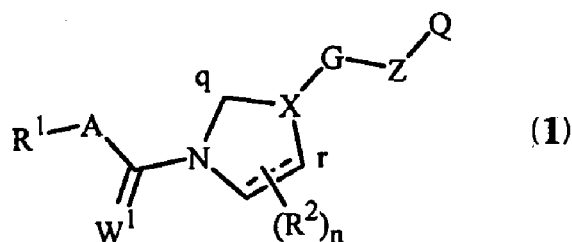
(72) Inventor(es): GEORGE PHILIP LAHM, Robert James Pasteris

(74) Procurador(es): Cristiane Araújo Rodrigues

(86) Pedido Internacional: PCT US2008000786 de 18/01/2008

(87) Publicação Internacional: WO 2008/091580 de 31/07/2008

(57) Resumo: COMPOSTO, MÉTODO PARA O CONTROLE DAS DOENÇAS VEGETAIS CAUSADAS POR PATÓGENOS VEGETAIS FÚNGICOS OOMYCETE E COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS. A presente invenção se refere aos compostos de Fórmula 1, incluindo todos os isômeros geométricos e estereoisômeros, N-óxidos e seus sais, à Fórmula 1 do presente em que R₁, R₂, A, G, W¹, Q, X, Z e n são conforme definidos no presente relatório descritivo. Também estão descritas as composições contendo os compostos de Fórmula 1 e os métodos para o controle de doenças vegetais causadas por um patógeno fúngico que compreende a aplicação de uma quantidade eficaz de um composto ou uma composição da presente invenção.



**“COMPOSTO, MÉTODO PARA O CONTROLE DAS DOENÇAS VEGETAIS
CAUSADAS POR PATÓGENOS VEGETAIS FÚNGICOS OOMYCETE E
COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS”**

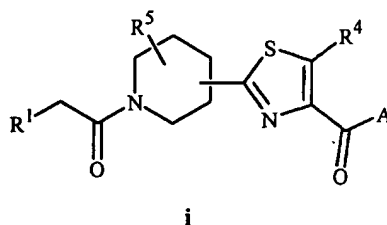
CAMPO DA INVENÇÃO

5 A presente invenção se refere a certas carboxamidas, seus N-
óxidos, sais e composições, e aos métodos para sua utilização como fungicidas.

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

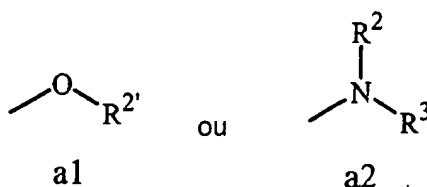
O controle das doenças vegetais causadas por patógenos
vegetais fúngicos é extremamente importante na obtenção de uma alta
10 eficiência da colheita. Os danos das doenças vegetais em culturas
ornamentais, de vegetais, de campo, cereais e frutas podem causar uma
redução significativa na produtividade e, desta forma, resultar em um aumento
de custos para o consumidor. Muitos produtos estão disponíveis
comercialmente com estes propósitos, mas permanece a necessidade de novos
15 compostos que sejam mais eficazes, menos dispendiosos, menos tóxicos,
ambientalmente mais seguros ou possuam diferentes mecanismos de ação.

A patente WO 05/003128 descreve os derivados de
tiazolilpiperidina de Fórmula i, como os inibidores de MTP (proteína de
transferência de triglicerídeo microssomal).



20 em que:

A é um radical selecionado a partir dos radicais a1 e a2 abaixo:



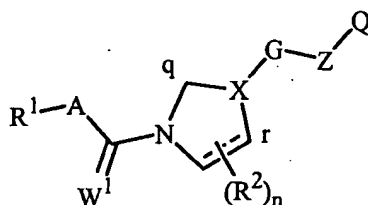
e R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são conforme definido no relatório descritivo.

A patente WO 04/058751 descreve os derivados de piperidiniltiazol carboxamida para alterar o tônus vascular.

5

DESCRIÇÃO RESUMIDA DA INVENÇÃO

A presente invenção está direcionada aos compostos de Fórmula 1, incluindo todos os isômeros geométricos e estereoisômeros, N-óxidos e seus sais, às composições agrícolas contendo os mesmos e à sua utilização como fungicidas:



1

10

em que:

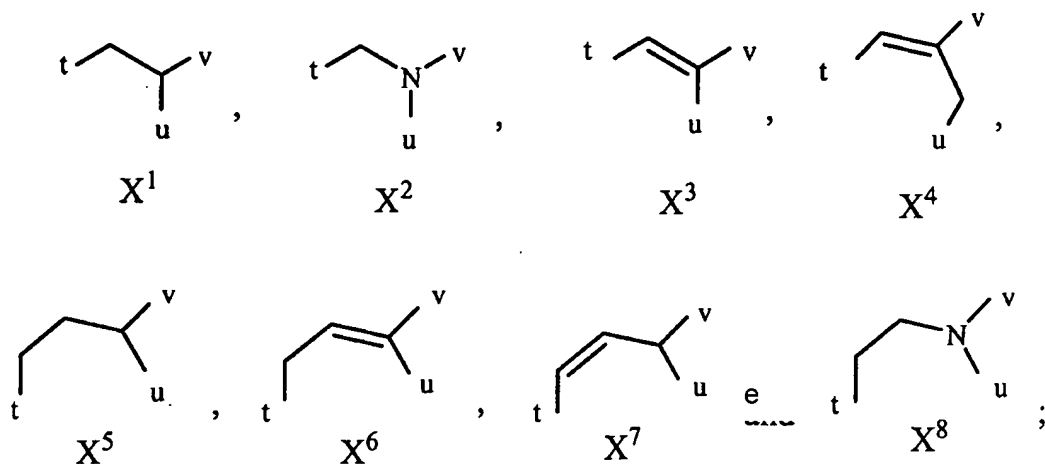
- R^1 é uma fenila ou um anel heteroarômático de 5 ou 6 membros opcionalmente substituídos;

- A é NR^{18} ou alquilenos C_1 - C_3 opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes independentemente selecionados a partir de R^{17} ;

15

- W^1 é O ou S;

- X é um radical selecionado a partir de:



- em que a ligação de X que é identificada com a letra "t" está ligada ao átomo de carbono identificado por "q" de Fórmula 1, a ligação que é identificada com "u" está ligada ao átomo de carbono identificados por "r" de Fórmula 1, bem como a ligação que é identificada por "v" está ligado a G;

5 - cada R^2 é independentemente alquila C_1-C_4 , alquenila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 , halogênio, ciano ou hidróxi;

- n é 0, 1 ou 2, ou

- dois R^2 são empregados em conjunto como alquilenos C_1-C_3 ou alquilenos C_2-C_3 para formar um sistema de anéis bicíclico em ponte, ou

10 - dois R^2 apenas aos átomos de carbono adjacentes do anel unidos por uma ligação dupla são empregados em conjunto como $-CH=CH-CH=CH-$ opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes selecionados a partir de alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , halogênio, hidróxi, aminoácidos, ciano e nitro;

15 - G é um anel heteroaromático de 5 membros opcionalmente substituído ou um anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado de 5 membros;

- Z é $C=W^2$ ou alquilenos C_1-C_3 opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes independentemente selecionados a partir de R^{19} ;

20 - W^2 é O ou S;

- Q é $-NQ^aQ^b$;

- Q^a é H, $-CHO$, alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , ciano, hidróxi, alcóxi C_1-C_3 , alcoxialquila C_2-C_3 , hidroxialquila C_1-C_3 , alquilcarbonila C_2-C_3 , alcoxycarbonila C_2-C_3 , alquilaminocarbonila C_2-C_3 ou dialquilaminocarbonila C_3-C_5 ;

- Q^b é um sistema de anel bicíclico saturado ou parcialmente saturado de 8 a 11 membros opcionalmente substituídos ou um sistema de

anéis tricíclicos parcialmente saturado de 10 a 15 membros opcionalmente substituídos, cada sistema de anel contendo opcionalmente de 1 a 3 heteroátomos selecionados de até 1 O, até 1 S e até 3 N, e, opcionalmente, incluindo de 1 a 3 membros do anel selecionados a partir do grupo constituído em C(=O), C(=S), S(O) ou S(F)₂; ou

- Q^b é CR⁵R⁶R¹⁵; ou

- Q^a e Q^b são empregados em conjunto com o átomo de nitrogênio ao qual estão ligados de modo a formar um anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado de 5 a 7 membros opcionalmente substituídos;

- R⁵ é H, alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, ciano, nitro, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;

- R⁶ é um anel heteroaromático de 5 ou 6 membros opcionalmente substituído por fenila, benzila, naftalenila, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquenila C₃-C₆; e

- R¹⁵ é H, alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquila C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄, halocicloalquila C₃-C₄ ou alcoxialquila C₂-C₄; ou

- Q^a e R⁵ são empregados em conjunto com os átomos que os conectam para formar um anel de 5 a 7 membros opcionalmente substituído contendo como membros do anel de 2 a 7 átomos de carbono e, opcionalmente, de 1 a 3 heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S e até 2 N; ou

- Q^a e R^6 são empregados em conjunto com os átomos que os conectam para formar um anel de 5 a 7 membros opcionalmente substituído contendo como membros do anel de 2 a 7 átomos de carbono e, opcionalmente, de 1 a 3 heteroátomos selecionados de até 1 O, até 1 S e até 2 N; ou

- R^5 e R^{15} são empregados em conjunto com o átomo de carbono ao qual estão ligados de modo a formar um anel de 5 a 7 membros opcionalmente substituído contendo como membros do anel de 2 a 7 átomos de carbono e, opcionalmente, de 1 a 3 heteroátomos selecionados de até 1 O, até 1 S, e até 1 N; ou

- R^5 e R^6 são empregados em conjunto com o átomo de carbono ao qual estão ligados de modo a formar um anel de 5 a 7 membros opcionalmente substituído contendo como membros do anel de 2 a 7 átomos de carbono e, opcionalmente, de 1 a 3 heteroátomos selecionados de até 1 O, até 1 S e até 1 N;

- R^{17} é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 , haloalquila C_2-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 , haloalquinila C_2-C_4 , alcoxialquila C_2-C_4 , alquiltioalquila C_2-C_4 , alquilsulfinilalquila C_2-C_4 , alquilsulfonilalquila C_2-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , haloalquilcarbonila C_2-C_4 , alcóxicarbonila C_2-C_5 , alcóxicarbonilalquila C_3-C_5 , alquilaminocarbonila C_2-C_5 , dialquilaminocarbonila C_3-C_5 , alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou haloalquilsulfonila C_1-C_4 ;

- R^{18} é H, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 , haloalquinila C_2-C_4 , alcoxialquila C_2-C_4 , alquiltioalquila C_2-C_4 , alquilsulfinilalquila C_2-C_4 , alquilsulfonilalquila C_2-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , haloalquilcarbonila C_2-C_4 , alcóxicarbonila C_2-C_5 , alcóxicarbonilalquila C_3-C_5 , alquilaminocarbonila C_2-C_5 ,

dialquilaminocarbonila C₃-C₅, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alcoialcóxi C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou haloalquilsulfonila C₁-C₄; e

- R¹⁹ é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C₁-C₄, alquenila
 5 C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, haloalquila C₁-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄, alcoialquila C₃-C₄, alquiltioalquila C₂-C₄, alquilsulfinilalquila C₂-C₄, alquilsulfonilalquila C₂-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, haloalquilcarbonila C₂-C₅, alcóxicarbonila C₂-C₅, alquilaminocarbonila C₂-C₅, dialquilaminocarbonila C₃-C₅, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila
 10 C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou haloalquilsulfonila C₁-C₄;

desde que:

(a) quando X for X², X³, X⁴, X⁶ ou X⁸, então G não está ligado a X através de um heteroátomo do anel G, e

(b) quando Z for C=W², então A é diferente NH ou CH₂.

15 Mais particularmente, a presente invenção se refere a um composto de Fórmula 1, incluindo todos os isômeros geométricos e estereoisômeros, um N-óxido ou um sal do mesmo.

A presente invenção também se refere a uma composição fungicida que compreende uma quantidade fungicida eficaz de um composto
 20 de Fórmula 1 e pelo menos um componente adicional selecionado do grupo que consiste em tensoativos, diluentes sólidos ou diluentes líquidos.

A presente invenção também se refere a uma composição fungicida que compreende uma mistura de um composto de Fórmula 1 e pelo menos outro fungicida.

25 A presente invenção ainda se refere a um método para controlar doenças vegetais causadas por patógenos vegetais fúngicos, que compreende a aplicação no vegetal ou parte do mesmo, ou nas sementes ou mudas do vegetal, de uma quantidade fungicida eficaz de um composto da presente

invenção (isto é, como uma composição descrita no presente).

DESCRIÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO

Conforme utilizados no presente, os termos “compreende”, “compreendendo”, “inclui”, “incluindo”, “possui”, “possuindo” ou qualquer outra de suas variações, pretendem abranger uma inclusão não exclusiva. Por exemplo, uma composição, processo, método, artigo ou equipamento que compreende uma lista de elementos não está necessariamente limitado a apenas aqueles elementos, mas podem incluir outros elementos não expressamente listados ou inerentes a tal composição, processo, método, artigo ou equipamento. Ainda, salvo indicações em contrário, “ou” se refere a uma inclusão e não a uma exclusão. Por exemplo, uma condição A ou B é satisfeita por qualquer um dos seguintes: 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 ambos A e B são verdadeiros (ou presentes).

Também, os artigos indefinidos “um” e “uma” são empregados para descrever os elementos e componentes da presente invenção. Isto é realizado meramente por conveniência e para fornecer um sentido geral da presente invenção. Esta descrição deve ser interpretada pela inclusão de um ou pelo menos um e o singular também inclui o plural salvo esteja óbvio que signifique o contrário.

Nas citações acima, o termo “alquila”, utilizado sozinho ou em palavras compostas, tais como “alquiltio” ou “haloalquila” inclui uma alquila de cadeia linear ou ramificada, por exemplo, metila, etila, *n*-propila, *i*-propila ou isômeros de butila, pentila ou hexila diferentes. O termo “1-2 alquila” indica que uma ou duas das posições disponíveis para aquele substituinte pode ser alquila que são independentemente selecionadas. “Alquenila” inclui os alcenos de cadeia linear ou ramificada, tal como a etenila, 1-propenila, 2-propenila e os isômeros de butenila, pentenila e hexenila diferentes. “Alquenila” também inclui

os polienos, tais como o 1,2-propadienil e 2,4-hexadienil. "Alquinila" inclui os alcinos de cadeia linear ou ramificada ou alcinos, tais como a etinila, 1-propinila, 2-propinila e os isômeros de butinila, pentinila e hexinila diferentes. "Alquinila" também pode incluir uma parte da molécula compostas de várias

5 ligações triplas, tal como a 2,5-hexadiinila. "Alquilenos" denota uma cadeia linear ou ramificada ou alcanodiila. Os exemplos de "alquilenos" incluem o CH_2 , CH_2CH_2 , $\text{CH}(\text{CH}_3)$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ e os diferentes isômeros de butilenos. "Alquenilenos" denota uma alquenodiila de cadeia linear ou ramificada contendo uma ligação olefínica. Os exemplos de "alquenilenos" incluem $\text{CH}=\text{CH}$,

10 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$, $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ e os isômeros diferentes de butenileno. "Alquinilenos" denota uma cadeia linear e ramificada ou alquinodiila contendo uma tripla ligação. Os exemplos de "alquinilenos" incluem $\text{C}\equiv\text{C}$, $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}$, $\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ e os isômeros de butinileno diferentes. "Alcóxi" inclui, por exemplo, metóxi, etóxi, n-propilóxi, isopropilóxi e os isômeros de butóxi, pentóxi e hexilóxi diferentes.

15 "Alcoxialquila" denota a substituição do alcóxi na alquila. Os exemplos de "alcoxialquila" incluem CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ e $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$. "Alcoxialcóxi" denota a substituição do alcóxi no alcóxi. "Alquenilóxi" inclui as porções alquenilóxi de cadeia linear ou ramificada. Os exemplos de "alquenilóxi" incluem $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$,

20 $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ e $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. "Alquinilóxi" inclui as porções alquinilóxi de uma cadeia linear ou ramificada. Os exemplos de "alquinilóxi" incluem $\text{HC}=\text{CCH}_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ e $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. "Alquiltio" inclui porções alquiltio de uma cadeia linear ou ramificada, tal como o metiltio, etiltio e os isômeros de propiltio, butiltio, pentiltio e hexiltio diferentes.

25 "Alquilsulfinila" inclui ambos os enantiômeros de um grupo alquilsulfinila. Os exemplos de "alquilsulfinila" incluem $\text{CH}_3\text{S}(\text{F})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{F})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{F})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{F})$ e os isômeros de butilsulfinila, pentilsulfinila e hexilsulfinila diferentes. Os exemplos de

“alquilsulfonila” incluem $\text{CH}_3\text{S}(\text{F})_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{F})_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{F})_2$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{F})_2$ e os isômeros de butilsulfonila, pentilsulfonila e hexilsulfonila diferentes. “Alquilamino”, “dialquilamino”, “alqueniltio”, “alquenilsulfonila”, “alquenilsulfonila”, “alquiniltio”, “alquinilsulfonila”, “alquinilsulfonila” e outros
 5 semelhantes, são definidos analogamente aos exemplos acima. “Triquilsilila” inclui três radicais alquila de cadeia linear e/ou ramificada apensos e ligados através de um átomo de silício, tais como trimetilsilil, trietilsilil e *t*-butil-dimetilsilila.

Conforme é geralmente entendido, o termo “membro do anel” se refere a um átomo ou outra porção (por exemplo, $\text{C}(=\text{O})$, $\text{C}(=\text{S})$, $\text{S}(\text{O})$ ou $\text{S}(\text{P})_2$)
 10 que forma a cadeia principal de um anel ou sistema de anéis.

“Aromático” se refere a um anel em que cada um dos átomos do anel está essencialmente no mesmo plano e possui um orbital *p* perpendicular ao plano do anel, e em que $(4n + 2)$ π elétrons, onde *n* é um número inteiro positivo, estão associados ao anel de acordo com regra de Hückel. A
 15 expressão “sistema de anel aromático” denota um sistema de anel heterocíclico ou carbocíclico em que pelo menos um anel do sistema de anel é aromático. O termo “sistema de anéis carbocíclicos aromáticos” designa um sistema de anéis carbocíclicos em que pelo menos um anel do sistema de anel é aromático. O termo “sistema de anéis heterocíclicos aromáticos” designa um
 20 sistema de anel heterocíclico, em que pelo menos um anel do sistema de anel é aromático. Conforme é geralmente entendido, o termo “anel saturado” denota um anel em que nenhum membro do anel está ligado a um membro do anel adjacente através de uma ligação dupla. Analogamente, o termo “sistema de anéis saturados” designa um sistema de anéis em que nenhum membro anel
 25 está ligado a um membro do anel adjacente através de uma ligação dupla. Com relação ao grau de saturação, um “anel parcialmente saturado” (descrito alternativamente como um “anel parcialmente insaturado”) é intermediário entre um anel saturado e um anel totalmente insaturado (que pode ser aromático).

Portanto, o termo “anel parcialmente saturado” (que pode ser carbocíclico ou heterocíclico, salvo indicação em contrário) indica um anel que compreende pelo menos um membro do anel ligado a um membro do anel adjacente através de uma ligação dupla e também que compreende pelo menos um membro ligado a um membro do anel adjacente através de uma ligação simples que poderia ser conceitualmente substituída por uma ligação dupla para formar um anel menos saturado. Analogamente, o termo “sistema de anéis bicíclicos parcialmente saturados” denota um sistema de anéis bicíclicos (que pode ser carbocíclico ou heterocíclico, salvo indicação em contrário) compreendendo pelo menos um membro do anel ligado a um membro do anel adjacente através de uma ligação dupla e também compreendendo pelo menos um membro do anel ligado a um membro do anel adjacente através de uma ligação simples que conceitualmente poderia ser substituída por uma ligação dupla para formar um sistema de anéis menos saturado. Os exemplos de “sistema de anel bicíclico parcialmente saturados” incluem o tetrahidronaftaleno, tetrahydroquinolina e tetrahydroisoquinolina. O termo “sistema de anel tricíclico parcialmente saturado” denota um sistema de anel tricíclico (que pode ser carbocíclico ou heterocíclico, salvo indicação em contrário) compreendendo pelo menos um membro do anel ligado ao membro do anel adjacente através de uma ligação dupla e também compreendendo pelo menos um membro do anel ligado a um membro do anel adjacente através de uma ligação simples que conceitualmente poderia ser substituída por uma ligação dupla para formar um sistema de anéis menos saturado. Em um sistema de anéis bicíclicos parcialmente saturados, um anel componente pode ser anel aromático, e em um sistema de anel tricíclico parcialmente saturado, um ou dois anéis componentes podem ser aromáticos, desde que, em um componente do anel não aromático, pelo menos, um membro do anel esteja ligado a um membro do anel adjacente através de uma ligação simples

que conceitualmente poderia ser substituída por uma ligação dupla para formar um sistema de anéis menos saturado.

Tal conforme é geralmente entendido, o termo “sistema de anéis bicíclicos” designa um sistema de anéis contendo dois anéis que dividem dois ou mais átomos comuns. Se os átomos comuns são adjacentes (ou seja, existe uma ligação entre os carbonos da cabeça de ponte), o sistema de anéis bicíclicos é um “sistema de anéis bicíclicos fundido”. Se os átomos comuns não são adjacentes (ou seja, não há qualquer vínculo entre os carbonos da cabeça de ponte), o sistema de anéis é um “sistema de anéis bicíclicos em ponte”. A presente Realização 50 mostra uma variedade de sistemas de anéis bicíclicos e tricíclicos fundidos ilustrativos como o componente Q^b de Q . No entanto, Q^b também pode ser um sistema de anéis bicíclicos ou tricíclicos em ponte.

As definições dos substituintes podem permitir que anéis, sistemas de anéis bicíclicos e sistemas tricíclicos sejam componentes dos sistemas que anéis mais extensivos. Por exemplo, o Q -59 representado na Realização 50 é formado a partir de Q sendo NQ^aQ^b onde Q^b é $CR^5R^6R^{15}$ e R^6 é um anel fenila opcionalmente substituído. Um substituinte no anel fenila R^6 empregado em conjunto com Q^a e os átomos que ligam Q^a e R^6 para formar o anel de seis membros contendo átomo de nitrogênio. Outro substituinte no anel fenila R^6 é empregado em conjunto com R^5 e o átomo de carbono ao qual R^5 e R^6 estão ligados para formar o anel de cinco membros opcionalmente substituído por os substituintes selecionados a partir R^8 .

Os termos “anel carbocíclico”, “carbociclo” ou “sistema de anel carbocíclico” denotam um anel ou sistema de anéis, em que os átomos que formam a cadeia principal do anel são selecionados apenas a partir do carbono. “Cicloalquila” inclui, por exemplo, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila e ciclohexila. Salvo indicação em contrário, um anel carbocíclico pode ser um anel saturado, parcialmente saturado ou totalmente insaturado anel. Quando um

anel carbocíclico totalmente insaturado satisfaz a regra de Hückel, então dito anel também é denominado um “anel aromático”. Um anel carbocíclico que não satisfaz a regra de Hückel é descrito como um “anel carbocíclico não aromático”.

Os termos “anel heterocíclico”, “heterociclo” ou “sistema de anel heterocíclico” denotam um anel ou sistema de anéis em que, pelo menos, um átomo que forma a cadeia principal do anel não é carbono, por exemplo, nitrogênio, oxigênio e enxofre. Tipicamente, um anel heterocíclico não contém mais de 4 nitrogênios, não mais de 2 oxigênios e não mais de 2 enxofres. Salvo indicação em contrário, um anel heterocíclico pode ser saturado, parcialmente saturado ou totalmente insaturado. Quando um anel heterocíclico totalmente insaturado satisfaz a regra de Huckel, então dito anel é também denominado um “anel heteroaromático” ou “anel heterocíclico aromático”. Um anel heterocíclico que não satisfaz a regra de Hückel é descrito como um “anel heterocíclico não aromático”. O termo “anel heterocíclico saturado” denota um anel heterocíclico em que nenhum membro anel está ligado a um membro do anel adjacente através de uma ligação dupla. O termo “anel heterocíclico parcialmente saturado” denota um anel heterocíclico que compreende, pelo menos, um membro do anel ligado a um anel adjacente através de uma ligação dupla e também compreendendo pelo menos um membro do anel ligado ao membro do anel adjacente através de uma ligação simples que poderia ser conceitualmente substituída por uma ligação dupla para formar um anel heterocíclico menos saturado. Salvo indicação em contrário, os anéis e sistema de anel heterocíclicos podem ser ligados através de qualquer carbono ou nitrogênio disponível por substituição de um hidrogênio em dito carbono ou nitrogênio. Nas citações acima, quando um composto de Fórmula 1 é compreendido por um ou mais anéis heterocíclicos, todos os substituintes são ligados a estes anéis através de qualquer carbono ou nitrogênio disponível por substituição de um hidrogênio em dito carbono ou nitrogênio.

Um técnico no assunto irá considerar que nem todos os heterociclos contendo nitrogênio podem formar N-óxidos uma vez que o nitrogênio requer um par de elétrons isolado disponível para a oxidação no óxido; um técnico no assunto irá reconhecer estes heterocíclicos contendo

5 nitrogênio que pode formar N-óxidos. Um técnico no assunto também irá reconhecer que as aminas terciárias podem formar N-óxidos. Os métodos sintéticos para a preparação dos N-óxidos de heterocíclicos e aminas terciárias são muito bem conhecidas por um técnico no assunto, incluindo a oxidação dos heterociclos e das aminas terciárias com peroxiácidos, tais como ácidos

10 peracéticos e *m*-cloroperbenzóicos (ácido MCPBA), peróxido de hidrogênio, alquil hidroperóxidos, tais como *t*-butil hidroperóxido, perborato de sódio e dioxiranos, tais como a dimetidioxirano. Esses métodos para a preparação dos N-óxidos têm sido extensivamente descritos e revistos na literatura, vide, por exemplo: T. L. Gilchrist em *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pág 748

15 – 750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik em *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pág 18 – 20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene em *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pág 149 – 161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik em *Advances in Heterocyclic*

20 *Chemistry*, vol. 9, pág 285 – 291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; e G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk em *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pág 390 – 392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

O termo “halogênio”, isoladamente ou em palavras compostas

25 como “haloalquila”, inclui flúor, cloro, bromo ou iodo. O termo “1 – 2 halogênio” indica que uma ou duas das posições disponíveis para aquele substituinte pode ser halogênio, que são independentemente selecionados. Além disso, quando utilizado em palavras compostas como “haloalquila”, dita alquila pode ser

parcialmente ou totalmente substituída por átomos de halogênios que podem ser os mesmos ou diferentes. Os exemplos de “haloalquila” incluem F_3C , $ClCH_2$, CF_3CH_2 e CF_3CCl_2 . Os termos “haloalquenila”, “haloalquinila”, “halocicloalquila”, “haloalcóxi”, “haloalquiltio”, e similares, são definidos analogamente ao termo “haloalquila”. Os exemplos de “haloalquenila” incluem $(Cl)_2C=CHCH_2$ e $CF_3CH_2CH=CHCH_2$. Os exemplos de “haloalquinila” incluem $HC=CCHCl$, $CF_3C=C$, $CCl_3C=C$ e $FCH_2C=CCH_2$. Os exemplos de “haloalcóxi” incluem CF_3O , CCl_3CH_2O , $HCF_2CH_2CH_2O$ e CF_3CH_2O . Os exemplos de “haloalquiltio” incluem CCl_3S , CF_3S , CCl_3CH_2S e $ClCH_2CH_2CH_2S$. Os exemplos de “haloalquilsulfinila” incluem $CF_3S(F)$, $CCl_3S(F)$, $CF_3CH_2S(O)$ e $CF_3CF_2S(O)$. Os exemplos de “haloalquilsulfonila” incluem $CF_3S(F)_2$, $CCl_3S(F)_2$, $CF_3CH_2S(F)_2$ e $CF_3CF_2S(F)_2$.

O número total de átomos de carbono em um grupo substituinte é indicado pelo prefixo “ C_i-C_j ” onde i e j são números de 1 a 10. Por exemplo, a alquilsulfonila C_1-C_4 designa de uma metilsulfonila até uma butilsulfonila; C_2 alcoxialquila designa CH_3OCH_2 ; C_3 alcoxialquila designa, por exemplo, $CH_3CH(OCH_3)$, $CH_3OCH_2CH_2$ ou $CH_3CH_2OCH_2$; e C_4 alcoxialquila designa os diversos isômeros de um grupo alquila substituído por um grupo alcóxi contendo um total de quatro átomos de carbono, os exemplos incluem $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ e $CH_3CH_2OCH_2CH_2$. O C_2 alquilaminoalquila designa - CH_3NHCH_2 ; C_3 alquilaminoalquila designa, por exemplo, $CH_3(CH_3NH)CH-$, $CH_3NHCH_2CH_2-$ ou $CH_3CH_2NHCH_2-$; e os exemplos de “alquilcarbonila” incluem $C(O)CH_3$, $C(O)CH_2CH_2CH_3$ e $C(O)CH(CH_3)_2$. Os exemplos de “alcoxicarbonila” incluem $CH_3OC(=O)$, $CH_3CH_2OC(=O)$, $CH_3CH_2CH_2OC(=O)$, $(CH_3)_2CHOC(=O)$ e os diferentes isômeros de butóxi ou pentóxi-carbonila. Os exemplos de “alquilaminocarbonila” incluem $CH_3NHC(=O)-$, $CH_3CH_2NHC(=O)-$, $CH_3CH_2CH_2NHC(=O)-$, $(CH_3)_2CHNHC(=O)-$ e os diferentes isômeros de butilamino- ou pentilaminocarbonila. Os exemplos de “dialquilaminocarbonila”

incluem $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})-$ e $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})-$.

A linha pontilhada na Fórmula 1 representa que a ligação indicada pode ser uma ligação simples ou uma ligação dupla.

5 Quando um composto é substituído por um substituinte que possui um subscrito que indica o número de ditos substituintes variáveis, e quando o número de dito substituintes for superior a 1, ditos substituintes são independentemente selecionados a partir do grupo definido de substituintes. Ainda, quando o subscrito indica um intervalo, por exemplo, $(\text{R})_{i-j}$, então o
10 número de substituintes podem ser selecionado a partir dos números inteiros entre i e j inclusive. Além disso, um técnico no assunto reconhece que o número de pontos de ligação disponíveis estabelece um limite no número de substituintes possíveis que podem ser menores do que a ampla definição; por exemplo, o subscrito “k” em U-16, U-17, U-18, U-19, U-32, U-33 e U-35
15 mostrado na Realização 14 não pode ser superior a 1.

Quando um grupo contém um substituinte que pode ser o hidrogênio, por exemplo, Q^a , R^5 , R^{15} , R^{17} , R^{18} ou R^{19} , então, quando este substituinte é empregado como o hidrogênio, é reconhecido que este é equivalente a dito grupo sendo não substituído. Quando um grupo variável se
20 revelou estar opcionalmente ligado a uma posição, por exemplo, $(\text{R}^2)_n$ em que n pode ser 0, então o hidrogênio pode estar na posição, mesmo se não citado na definição de grupo variável. Quando uma posição em um grupo é considerada “não substituída” ou “que não pode ser substituída”, então os átomos de hidrogênio são ligados ocupando qualquer valência livre. O termo
25 “opcionalmente substituído”, em conjunto com os grupos listados para R^1 , R^2 , R^5 , R^6 , R^{15} , R^{16} , R^{16a} , G , Q^a e Q^b , se refere aos grupos que não são substituídos ou possuem pelo menos 1 substituinte não-hidrogênio. Estes grupos podem ser substituídos com tantos substituintes opcionais quanto

puderem ser acomodados através da substituição de um átomo de hidrogênio por um substituinte não-hidrogênio em qualquer átomo de carbono ou nitrogênio disponível. Comumente, o número de substituintes opcionais (quando presentes), varia de 1 a 3.

5 Tal conforme referido acima, R^1 é uma fenila opcionalmente substituída ou um anel heteroaromático de 5 ou 6 membros; G é um anel heteroaromático de 5-membros opcionalmente substituído ou um anel heterocíclico de 5 membros saturado ou parcialmente saturado; Q^a e Q^b são empregados em conjunto com o átomo de nitrogênio ao qual estão ligados de modo a formar um anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado de 5 a 10 7 membros opcionalmente substituído; e R^6 é um anel heteroaromático de fenila, benzila, naftalenila, cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquenila C_3-C_6 ou 5 ou 6 membros opcionalmente substituído; e Q-2 até Q-85 são opcionalmente substituídos. O termo "substituído", em relação com estes grupos R^1 , G, R^6 , Q^a e Q^b se refere aos grupos que possuem pelo menos um substituinte não-15 hidrogênio que não extingue a atividade fungicida. Uma vez que estes grupos são opcionalmente substituídos, eles não precisam possuir quaisquer substituintes de hidrogênio.

A denominação dos substituintes no presente relatório descritivo utiliza a terminologia reconhecida apresentando exatidão, ao transmitir20 precisamente aos técnicos no assunto, a estrutura química. Por exemplo, como é utilizado na nomenclatura, o prefixo "per" significa "completamente", e "perhidro" significa que o referido anel ou sistema de anéis heteroaromáticos (por exemplo, quinolina, isoquinolina) foi totalmente hidrogenado, de modo que25 esteja totalmente saturado. Além disso, finalizando o nome do substituinte heterocíclico com a letra "o" (por exemplo, "piperidino", "pirrolidino", "isoquinolino", "isoindolo") significa que o substituinte heterocíclico está ligado ao restante da molécula através do átomo de nitrogênio do heterociclo. Por

razões de concisão, o local do descritor pode ser omitido; o “pirazol-1-il” significa “1H-pirazol-1-il”, de acordo com o sistema de nomenclatura Chemical Abstracts. O termo “piridil” é sinônimo de “piridinil”. A ordem de listagem dos substituintes pode ser diferente do sistema Chemical Abstracts se a diferença não afetar o significado.

A. Os exemplos dos compostos de Fórmula 1 incluem os compostos em que

- R^1 é uma fenila ou um anel heteroaromático de 5 ou 6 membros, opcionalmente substituído por 1 a 2 substituintes independentemente selecionados a partir de R^4 ;

- cada R^4 é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, aminoácidos, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcóxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialkilsilila C_3-C_6 ;

- G é um anel heteroaromático de 5 membros ou um anel heterocíclico 5-membros saturados ou parcialmente saturados, cada anel opcionalmente substituído por até 2 substituintes selecionados a partir de R^3 nos membros do anel de carbono e selecionados a partir de R^{11} nos membros do anel de nitrogênio;

- cada R^3 é independentemente alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 ou halogênio;

- R^{11} é alquila C_1-C_3 ; e

- Q é um radical selecionado de Q-1 até Q-85, conforme descrito em conjunto com a Realização 50 descrito a seguir.

B. São importantes os compostos do Parágrafo A acima, em que R¹ é de U-1 até U-50, conforme descrito em conjunto com a Realização 14 descrita a seguir; G é um de G-1 até G-55, tal conforme descrito em conjunto com a Realização 36 descrita a seguir, cada R^{3a} é independentemente H, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃ ou halogênio (mais particularmente H, alquila C₁-C₃ ou halogênio, e mais particularmente H ou alquila C₁-C₃); R^{11a} é H ou alquila C₁-C₃; R⁶ é um de H-1 até H-46, conforme descrito em conjunto com a Realização 65 descrita a seguir; e R¹² é H ou alquila C₁-C₃. Entre estes compostos são importantes os compostos em que cada R⁴ é independentemente alquila C₁-C₃, alquenila C₂-C₃, alquinila C₂-C₃, ciclopropila, haloalquila C₁-C₃, haloalquenila C₂-C₃, haloalquinila C₂-C₃, halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂; R⁵ é alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, haloalquila C₁-C₄, C₂-C₄ haloalquenila, haloalquinila C₂-C₄, halocicloalquila C₃-C₄, ciano ou alcóxi C₁-C₄ e cada R⁷ é independentemente alquila C₁-C₃, alquenila C₂-C₃, alquinila C₂-C₃, ciclopropila, haloalquila C₁-C₃, haloalquenila C₂-C₃, haloalquinila C₂-C₃, halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂; cada R⁸ é independentemente H, alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₃-C₄, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄ ou alquilcarbonilóxi C₂-C₄; cada R⁹ é independentemente alquila C₁-C₃, ciclopropila, haloalquila C₁-C₃, halociclopropila, halogênio, hidróxi, alquilcarbonilóxi C₂-C₃, alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂; R¹⁰ é H ou metila; cada R¹⁶ é independentemente alquila C₁-C₃, alquenila C₂-C₃, alquinila C₂-C₃, ciclopropila, haloalquila C₁-C₃, haloalquenila C₂-C₃, haloalquinila C₂-C₃, halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂; ou um

anel fenila ou benzila, opcionalmente substituído por até 3 substituintes selecionados a partir de R^{13} ; R^{16a} é H, alquila C_1-C_3 , alila, propargila, ciclopropila ou haloalquila C_1-C_3 , ou um anel fenila ou benzila, opcionalmente substituído por até 3 substituintes selecionados a partir de R^{13} , e cada R^{13} é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , haloalquinila C_2-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ; A é NR^{18} ou alquilenos C_1-C_2 opcionalmente substituído por R^{17} , R^{17} é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C_1-C_4 , alcoxialquila C_2-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 ou alcóxicarbonila C_2-C_5 ; e R^{18} é H, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C_1-C_4 , alcoxialquila C_2-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcóxicarbonila C_2-C_5 ou alquilsulfonila C_1-C_4 ; Z é $C=W^2$ ou alquilenos C_1-C_2 opcionalmente substituído por R^{19} e R^{19} é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 ou alcóxicarbonila C_2-C_5 .

15 C. Os exemplos dos compostos do Parágrafo B acima incluem os compostos em que X é um dentre X^1 , X^2 e X^3 , e cada R^2 é independentemente alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , alcóxi C_1-C_2 , halogênio, ciano ou hidróxi; Q^a é H ou CH_3 ; e R^{15} é H ou CH_3 ; A é NR^{18} ou metileno opcionalmente substituído por R^{17} , R^{17} é H, halogênio, ciano, -CHO, alquila C_1-C_2 , alcoxialquila C_2-C_3 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou alcóxicarbonila C_2-C_3 e R^{18} é H, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C_1-C_2 , alcoxialquila C_2-C_3 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou alcóxicarbonila C_2-C_3 ; Z é $C=W^2$ ou metileno opcionalmente substituído por R^{19} ; e R^{19} é H, halogênio, ciano, alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 .

25 D. Os exemplos dos compostos do Parágrafo C acima incluem os compostos em que R^1 é um dentre U-1 até U-3, U-11, U-13, U-20, U-22, U-23, U-36, U-37 até U-39 e U-50, e cada R^4 é independentemente halogênio, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 . Estão também inclusos os compostos em que G é G1, G-2, G-3, G-7, G-8, G-10, G-11, G-14,

G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-28, G-30, G-36, G-37, G-38 ou G-49 até G-55; R^{3a} é H, CH_3 , Cl ou Br; R^{11} é CH_3 e R^{11} é H ou CH_3 . São importantes os compostos em que G é G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-36, G-37, G-38, G-49 ou G-50 (incluindo, por exemplo, onde G é não substituído); R^{17} é H, alquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou alcóxicarbonila C_2-C_3 ; R^{18} é H, -CHO, alquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou alcóxicarbonila C_2-C_3 e R^{19} é H, alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 .

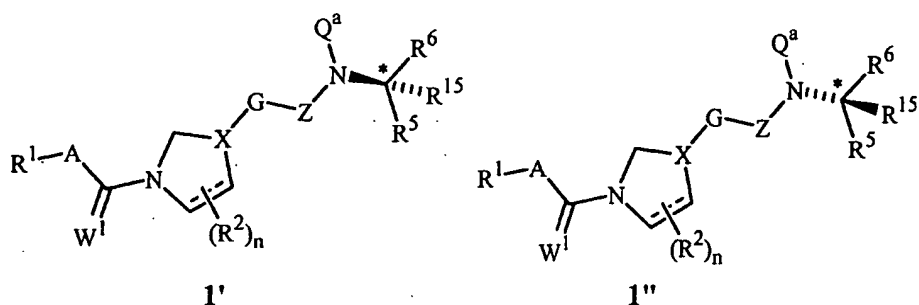
E. Outros exemplos dos compostos do Parágrafo C incluem os compostos em que Q é Q-1, Q-2, Q-3, Q-4, Q-8, Q-9, Q-10, Q-12, Q-14, Q-22, Q-23, Q-24, Q-40, Q-41, Q-59, Q-62, Q-74 ou Q-84; R_5 é alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 , cicloalquila C_3-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 , haloalquinila C_2-C_4 , halocicloalquila C_3-C_4 , ciano ou alcóxi C_2-C_4 ; R^6 é H-1, H-20, H-32, H-45 ou H-46; cada R^7 é independentemente halogênio, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ; cada R^8 é independentemente alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , alcóxi C_1-C_2 , haloalcóxi C_1-C_2 , alquilcarbonilóxi C_2-C_4 ou hidróxi; e cada R^9 é independentemente halogênio, hidróxi, OCH_3 ou CH_3 . Estão inclusos os compostos em que Q é Q-1, Q-2, Q-8, Q-14, Q-23, Q-41, Q-59 ou Q-62; Q^a é metil; R^5 é alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 ou ciano; R^6 é H-1 ou H-45; R^{12} é H ou CH_3 ; cada R^7 é independentemente F, Cl, Br, OCH_3 ou metila; R^{15} é H; R^8 é CH_3 , OCH_3 ou OH; e R^{10} é H ou CH_3 .

F. Os exemplos adicionais dos compostos do Parágrafo C incluem os compostos em que W^1 e W^2 são independentemente O; Q^a é CH_3 ; m, j, n e p são todos independentemente 0 ou 1; R^{3a} é H, cada R^7 é independentemente F, Cl, Br, OCH_3 ou metila; cada R^8 é independentemente alquila C_1-C_2 , alcóxi C_1-C_2 ou hidróxi; e cada R^9 é independentemente F, Cl, Br, hidróxi, OCH_3 ou CH_3 . Estão inclusos os compostos em que R^1 é U-1 ou U-50; cada R^4 é independentemente halogênio, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 ou

alcóxi C₁-C₂; G é G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 ou G-38, Q é Q-1, Q-2, Q-8, Q-23 ou Q-41; R⁵ é alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄ ou ciano; R⁶ é H-45, e cada R⁴ está independentemente ligado na posição 3 ou 5 de U-1, cada R⁴ está independentemente ligado na posição 3 e 5 de U-1, cada R⁴ está independentemente ligado na posição 2 ou 3 de U-50, ou cada R⁴ está independentemente ligado na posição 2 e 5 de U-50 (por exemplo, os compostos em que X é X¹ é G-1 e G; X é X¹ e G é G-2, X é X¹ e G é G-15, X é X¹ e G é G-26, X é X¹ e G é G-36, X é X² e G é G-1, ou X é X² e G é G-2). Anteriormente, "cada R⁴ está independentemente ligado na posição 3 ou 5 de U-1" significa que k é 1 e R⁴ está ligado na posição 3 ou 5 de U-1, "cada R⁴ está independentemente ligado na posição 3 e 5 de U-1" significa que k é 2 e um R⁴ independentemente selecionados está ligado a cada uma das posições 3 e 5 de U-1, "cada R⁴ está independentemente ligado na posição 2 ou 3 de U-50" significa que k é 1 e R⁴ está ligado na posição 3 ou 5 de U-50, e "cada R⁴ está independentemente ligado na posição 2 e 5 de U-50" significa que k é 2 e um R⁴ independentemente selecionado está ligado a cada uma das posições 2 e 5 de U-50.

Os compostos da presente invenção podem existir como um ou mais estereoisômeros. Os vários estereoisômeros incluem os enantiômeros, diastereômeros, atropisômeros e isômeros geométricos. Um técnico no assunto irá considerar que um estereoisômero pode ser mais ativo e/ou pode apresentar efeitos benéficos quando enriquecido com relação aos outros estereoisômero(s) ou quando separado dos outros estereoisômero(s). Além disso, o técnico no assunto sabe como separar, enriquecer e/ou preparar seletivamente ditos estereoisômeros. Consequentemente, a presente invenção compreende os compostos de Fórmula 1, seus N-óxidos e sais. Os compostos da presente invenção podem estar presentes como uma mistura de estereoisômeros, estereoisômeros individuais, ou como uma forma opticamente ativa. Por exemplo, quando Q é Q-1, e R⁵, R⁶ e R¹⁵ de Q-1 na

Fórmula 1 são diferentes, então a Fórmula 1 possui um centro quiral no átomo de carbono no qual ela está comumente ligada. A presente invenção compreende as misturas racêmicas. Além disso, a presente invenção inclui os compostos que são enriquecidos, em comparação com a mistura racêmica em um enantiômero de Fórmula 1.



Estão incluídos os enantiômeros essencialmente puros dos compostos de Fórmula 1, por exemplo, de Fórmula 1' e Fórmula 1'', em que Q é Q-1.

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

Para os compostos de Fórmula 1 em que Q é Q-1 até Q-74, acredita-se que o enantiômero fungicida mais ativo seja aquele em que R¹⁵ é hidrogênio, o átomo de hidrogênio ligado ao átomo de carbono identificado por um asterisco (*) está abaixo do plano definido pelos 3 átomos de não hidrogênio ligados ao átomo de carbono identificado pelo asterisco (*) como na Fórmula 1' (com o anel aromático de Q-2 até Q-74 posicionado em relação ao átomo de carbono identificado por um asterisco (*) de um modo análogo a R⁶ em Q-1 na Fórmula 1'). Por exemplo, quando R⁵ for CH₃, R⁶ for fenila e R¹⁵ for H, a Fórmula 1' possui a configuração R no átomo de carbono em que R⁵, R⁶ e

R¹⁵ estão comumente ligados.

De preferência, as composições da presente invenção possuem pelo menos um excesso enantiomérico de 50%, de maior preferência, pelo menos um excesso enantiomérico 75%, de maior preferência, ainda, pelo menos um excesso enantiomérico 90%, e de maior preferência, ainda, pelo menos um excesso enantiomérico de 94% do isômero mais ativo. São de interesse particular as realizações enantiomericamente puras do isômero mais ativo.

Os compostos de Fórmula 1 podem compreender os centros quirais adicionais. Por exemplo, os substituintes R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹, R¹³, R¹⁵, R¹⁶, R^{16a}, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, Q^a, Q^b e X¹ até X⁸ poderão conter centros quirais. A presente invenção compreende misturas racêmicas, bem como estereoconfigurações enriquecidas e essencialmente puras nesses centros quirais adicionais.

Os compostos da presente invenção podem existir como um ou mais isômeros conformacionais devido às ligações amida na Fórmula 1 conforme conhecido pelo técnico no assunto. A presente invenção compreende as misturas de isômeros conformacionais. Além disso, a presente invenção inclui os compostos que são enriquecidos, em comparação com a mistura de um confômero de Fórmula 1.

Um técnico no assunto reconhece que, pelo fato de no ambiente e em condições fisiológicas os sais dos compostos químicos estão em equilíbrio com suas respectivas formas de não sal, os sais compartilham a utilidade biológicas das formas não sais. Assim, uma ampla variedade de sais dos compostos de Fórmula 1 é útil para o controle das doenças vegetais causadas por patógenos vegetais fúngicos (isto é, são agricolamente adequadas). Os sais dos compostos de Fórmula 1 incluem os sais de adição ácida com os ácidos inorgânicos ou orgânicos, tais como o ácido hidrobromico, hidrocloreídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico,

maléico, malônico, oxálico, propiônico, salicílico, tartárico, 4-toluenossulfônico ou valérico. Quando um composto de Fórmula 1 contém uma porção ácida, tal como um ácido carboxílico ou fenol, os sais também incluem aqueles formados por bases orgânicas ou inorgânicas, tais como a piridina, trietilamina ou amônia, ou amidas, hidretos, hidróxidos ou carbonatos de sódio, potássio, lítio, cálcio, magnésio ou bário. Consequentemente, a presente invenção compreende os compostos selecionados a partir da Fórmula 1, seus N-óxidos e sais agricolamente adequados.

As realizações da presente invenção incluem:

10 Realização 1. Um composto de Fórmula 1 em que A é NR^{18} .

Realização 1a. Um composto da Realização 1 em que R^{18} é H, ciano, hidróxi, -CHO, alquila $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxialquila $\text{C}_2\text{-C}_4$, alquilcarbonila $\text{C}_2\text{-C}_4$, alcoxicarbonila $\text{C}_2\text{-C}_5$ ou alquilsulfonila $\text{C}_1\text{-C}_4$.

15 Realização 1b. Um composto da Realização 1a em que R^{18} é H, ciano, hidróxi, -CHO, alquila $\text{C}_1\text{-C}_2$, alcoxialquila $\text{C}_2\text{-C}_3$, alquilcarbonila $\text{C}_2\text{-C}_3$ ou alcoxicarbonila $\text{C}_2\text{-C}_3$.

Realização 1c. Um composto da Realização 1b em que R^{18} é H, -CHO, alquila $\text{C}_1\text{-C}_2$, alquilcarbonila $\text{C}_2\text{-C}_3$ ou alcoxicarbonila $\text{C}_2\text{-C}_3$.

20 Realização 2. Um composto de Fórmula 1 em que A é alquilenos $\text{C}_1\text{-C}_3$ opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes independentemente selecionados a partir de R^{17} .

25 Realização 2a. Um composto da Realização 2 em que A é alquilenos $\text{C}_1\text{-C}_2$ opcionalmente substituído por R^{17} e R^{17} é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxialquila $\text{C}_2\text{-C}_4$, alquilcarbonila $\text{C}_2\text{-C}_4$ ou alcoxicarbonila $\text{C}_2\text{-C}_5$.

Realização 2b. Um composto da Realização 2a em que A é metileno opcionalmente substituído por R^{17} e R^{17} é H, halogênio, ciano, -CHO, alquila $\text{C}_1\text{-C}_2$, alcoxialquila $\text{C}_2\text{-C}_3$, alquilcarbonila $\text{C}_2\text{-C}_3$ ou alcoxicarbonila $\text{C}_2\text{-C}_3$.

Realização 2c. Um composto da Realização 2b em que R^{17} é H, alquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou alcóxicarbonila C_2-C_3 .

Realização 3. Um composto de Fórmula 1 em que W^1 é O.

Realização 4. Um composto de Fórmula 1 em que W^1 é S.

5 Realização 5. Um composto de Fórmula 1 em que Z é $C=W^2$.

Realização 5a. Um composto da Realização 5 em que W^2 é O.

Realização 5b. Um composto da Realização 5 em que W^2 é S.

10 Realização 6. Um composto de Fórmula 1 em que Z é alqueno C_1-C_3 opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes independentemente selecionados a partir de R^{19} .

Realização 6a. Um composto da Realização 6 em que Z é alqueno C_1-C_2 opcionalmente substituído por R^{19} e R^{19} é H, halogênio, ciano, hidróxi, $-CHO$, alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 ou alcóxicarbonila C_2-C_5 .

15 Realização 6b. Um composto da Realização 6a em que Z é metileno opcionalmente substituído por R^{19} e R^{19} é H, halogênio, ciano, alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 .

Realização 6c. Um composto da Realização 6b em que R^{19} é H, alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 .

20 Realização 7. Um composto de Fórmula 1 em que R^2 é metila.

Realização 8. Um composto de Fórmula 1 em que n é 0 ou 1.

Realização 9. Um composto da Realização 8 em que n é 0.

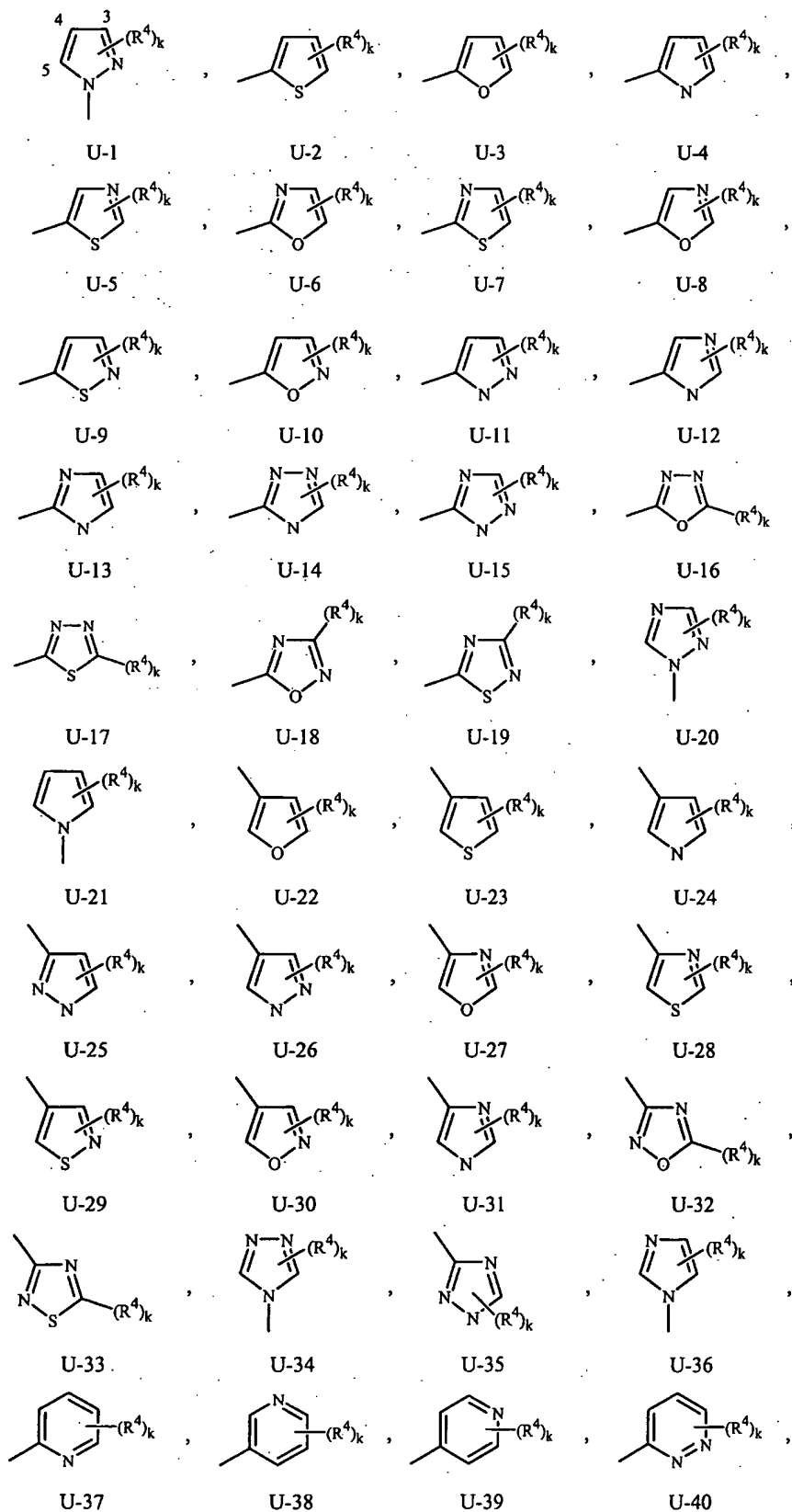
Realização 10. Um composto de Fórmula 1 em que X é X^1 , X^2 e X^3 .

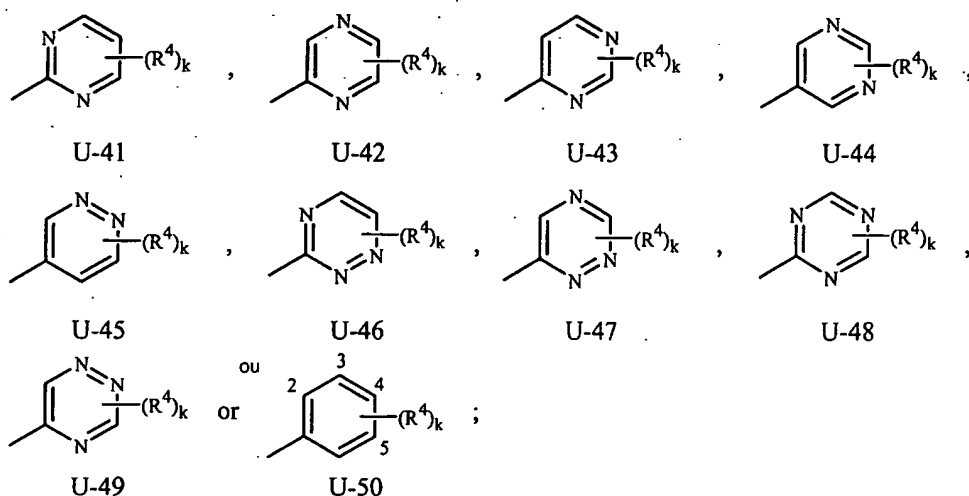
25 Realização 11. Um composto da Realização 10 em que X é X^1 ou X^2 e cada anel é saturado.

Realização 12. Um composto da Realização 10 em que X é X^1 .

Realização 13. Um composto da Realização 12 em que X é X^1 e o anel é saturado.

Realização 14. Um composto de Fórmula 1 em que R^1 é um dentre U-1 até U-50;





em que k é 0, 1 ou 2,

desde que, quando U for U-4, U-11 até U-15, U-24 até U-26, U-31 e U-35, e um radical R^4 está ligado a um átomo de nitrogênio do anel e, então, dito radical R^4 é a alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 ou alcoialquila C_2-C_4 .

Realização 15. Um composto da Realização 14 em que R^1 é selecionado a partir de U-1 até U-5, U-8, U-11, U-13, U-15, U-20 até U-28, U-31, U-36 até U-39 e U-50.

Realização 16. Um composto da Realização 15 em que R^1 é selecionado de U-1 até U-3, U-5, U-8, U-13, U-20, U-22, U-23, U-25 através do U-28, U-36 até U-39 e U-50.

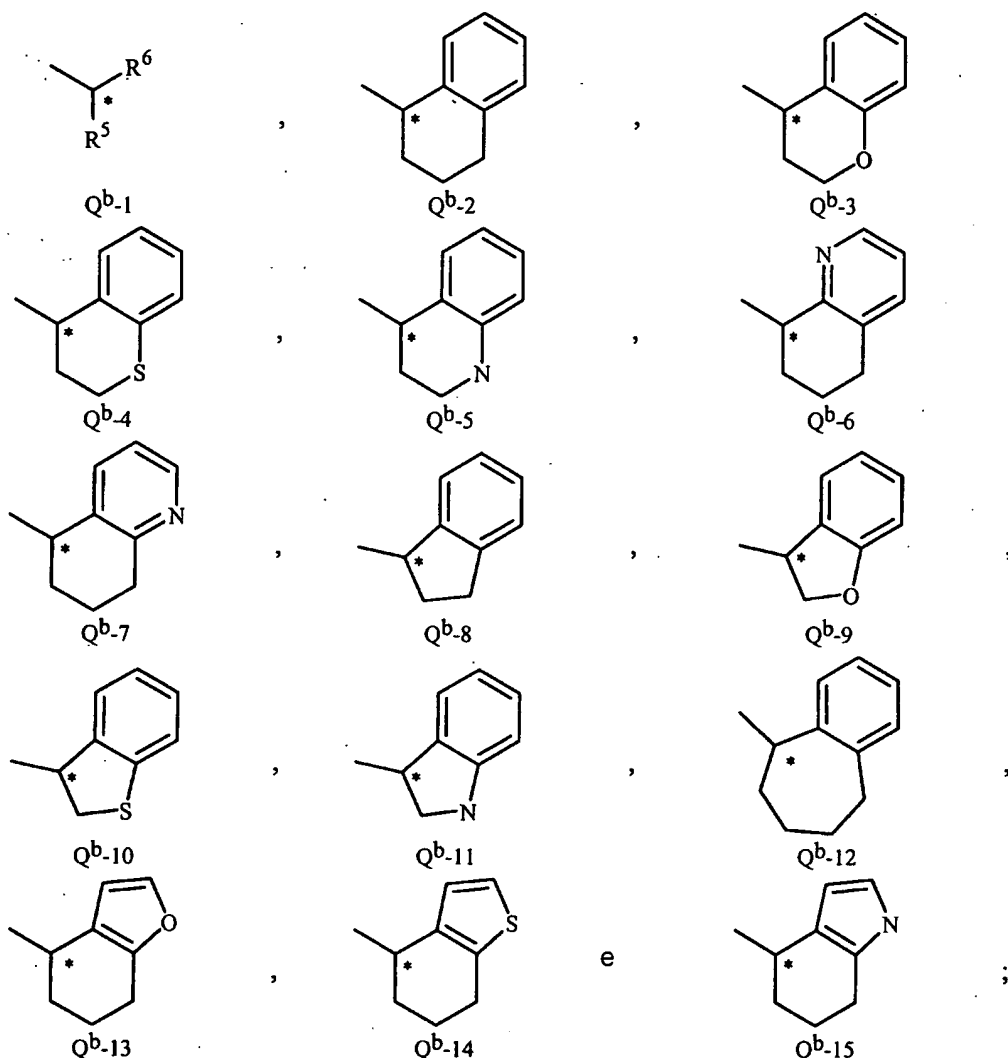
Realização 17. Um composto da Realização 16 em que R^1 é selecionado de U-1 até U-3, U-13, U-20, U-22, U-23, U-36 até U-39 e U-50.

Realização 18. Um composto da Realização 17 em que R^1 é U-1 ou U-50.

Realização 19. Um composto da Realização 18 em que R^1 é U-1.

Realização 19a. Um composto de qualquer um da Fórmula 1 e das Realizações 18 em que X é X^1 , X^2 ou X^3 ; cada R^2 é independentemente alquila C_1-C_3 ; G é um anel heteroarômico de 5 membros opcionalmente

substituído contendo de 1 a 3 heteroátomos selecionados de 0 a 1 O, 0 a 1 S e de 0 a 3 N; Q^a é CH_3 ; e Q^b é um radical selecionado a partir de



em que Q^b-2 até Q^b-15 são opcionalmente substituídos exceto no átomo de carbono identificado com um asterisco (*); R⁵ é alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, ciano, nitro, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilil C₃-C₆; e R⁶ é uma fenila opcionalmente substituído, naftalenila ou anel heteroaromático de 5 ou 6 membros.

Realização 20. Um composto da Realização 18 em que R¹ é U-

50.

Realização 21. Um composto de Fórmula 1 em que R^1 é uma fenila ou anel heteroaromático de 5 ou 6 membros, cada um opcionalmente substituído por 1 a 2. substituintes independentemente selecionados a partir de R^4 , e cada R^4 é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , haloalquinila C_2-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_2 , haloalcóxi C_1-C_2 , alquiltio C_1-C_2 , haloalquiltio C_1-C_2 , alcoxialquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 , alcoxycarbonila C_2-C_3 , alquilaminocarbonila C_2-C_3 ou dialquilaminocarbonila C_3-C_4 .

Realização 22. Um composto da Realização 21 em que cada R^4 é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , haloalquinila C_2-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

Realização 23. Um composto da Realização 22 em que cada R^4 é independentemente halogênio, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

Realização 24. Um composto da Realização 23 em que cada R^4 é independentemente halogênio, alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 ou alcóxi C_1-C_2 .

Realização 25. Um composto da Realização 24 em que cada R^4 é independentemente Cl, Br, I, metila, etila, trifluorometila ou metóxi.

Realização 26. Um composto da Realização 25 em que pelo menos um R^4 é Cl.

Realização 27. Um composto da Realização em que pelo menos um R^4 é Br.

Realização 28. Um composto da Realização 25 em que pelo menos um R^4 é metila.

Realização 29. Um composto da Realização 25 em que pelo

menos um R^4 é etila.

Realização 30. Um composto da Realização 25 em que pelo menos um R^4 é trifluorometila.

Realização 31. Um composto da Realização 25 em que pelo menos um R^4 é metóxi.

Realização 32. Um composto da Realização 19 em que cada R^4 está independentemente ligado na posição 3 ou 5 de U-1 (isto é, k é 1, e R^4 está ligado na posição 3 ou 5 de U-1).

Realização 32a. Um composto da Realização 19a em que cada R^4 está independentemente ligado na posição 3 ou 5 de U-1 (isto é, k é 1, e R^4 está ligado na posição 3 ou 5 de U-1), e cada R^4 é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcóxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialquilsilil C_3-C_6 .

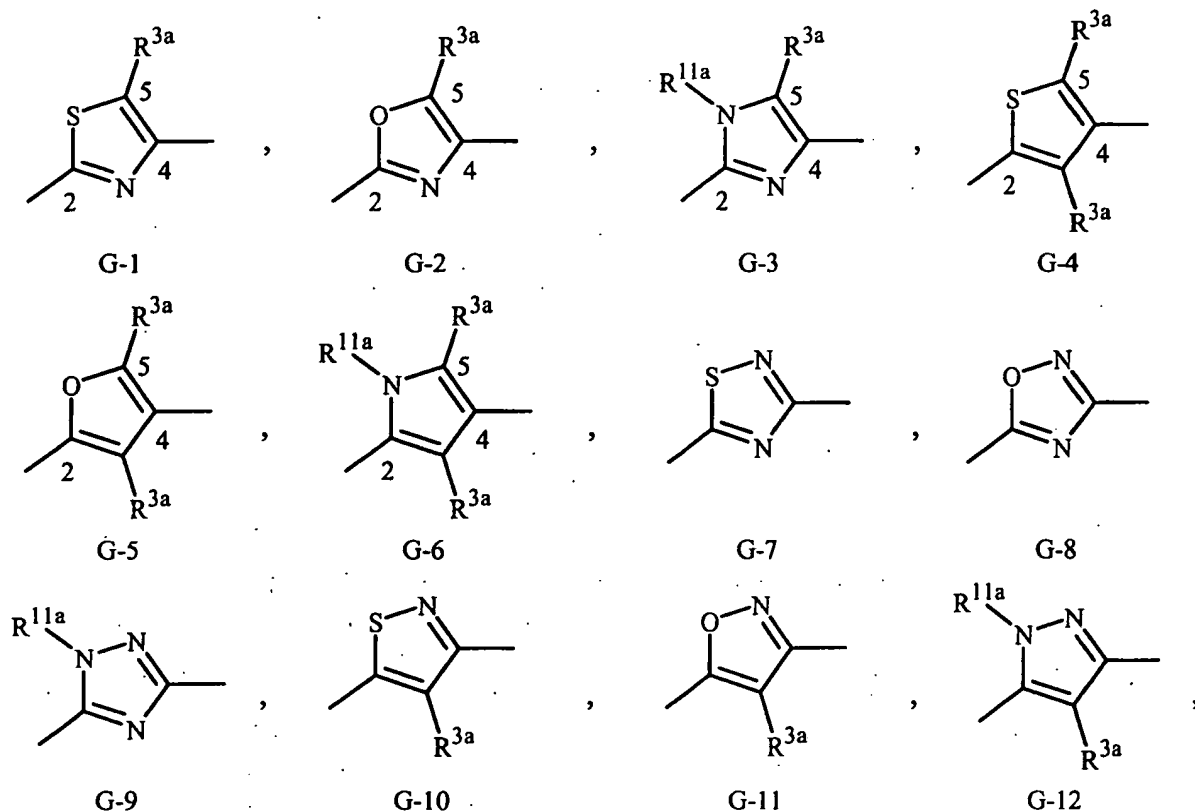
Realização 33. Um composto da Realização 19 em que cada R^4 está independentemente ligado na posição 3 ou 5 de U-1 (isto é, k é 2, e um R^4 independentemente selecionado está ligado na posição 3 ou 5 de U-1). São importantes os compostos da Realização 33, que correspondem aos compostos importantes para a Realização 19 acima em que cada R^4 é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 ,

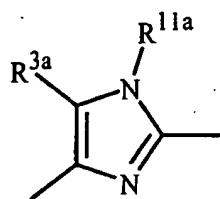
haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfina C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfina C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₃, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcóxicarbonila C₂-C₆,
 5 alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilil C₃-C₆.

Realização 34. Um composto da Realização 20 em que cada R⁴ está independentemente ligado na posição 2 ou 3 de U-50 (isto é, k é 1, e R⁴ está ligado na posição 2 ou 3 de U-50).

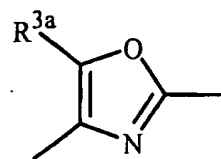
10 Realização 35. Um composto da Realização 20 em que cada R⁴ está independentemente ligado na posição 2 e 5 de U-50 (isto é, k é 2, e um R⁴ independentemente selecionado está ligado na posição 2 e 5 de U-50).

15 Realização 36. Um composto de Fórmula 1 em que G é um dentre G-1 até G-55;

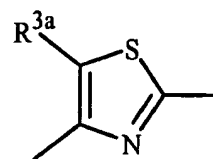




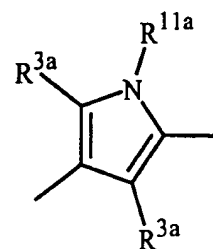
G-13



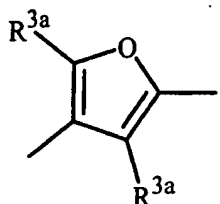
G-14



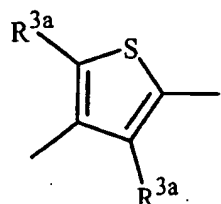
G-15



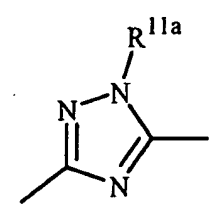
G-16



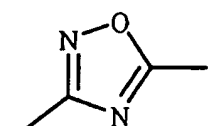
G-17



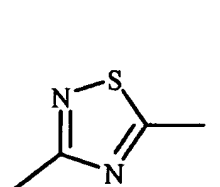
G-18



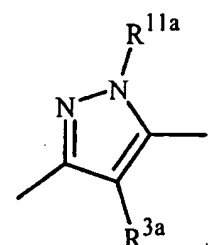
G-19



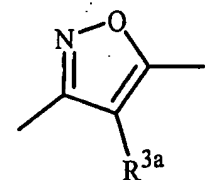
G-20



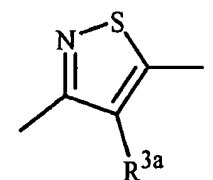
G-21



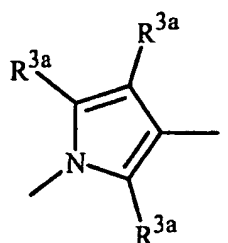
G-22



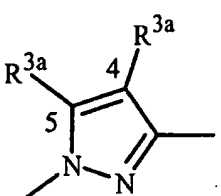
G-23



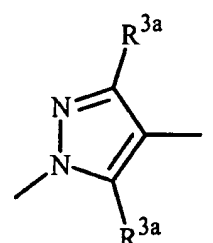
G-24



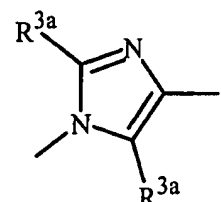
G-25



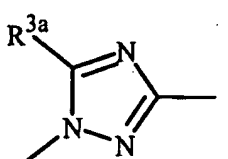
G-26



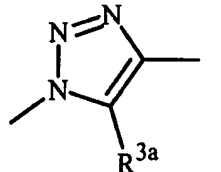
G-27



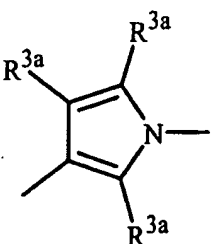
G-28



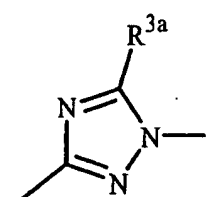
G-29



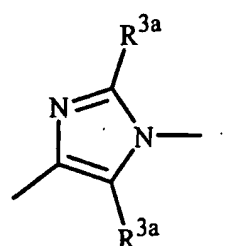
G-30



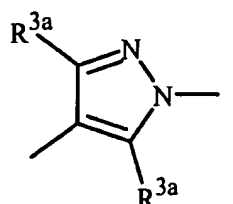
G-31



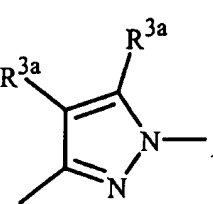
G-32



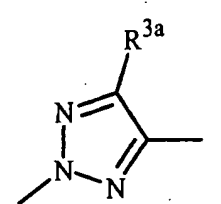
G-33



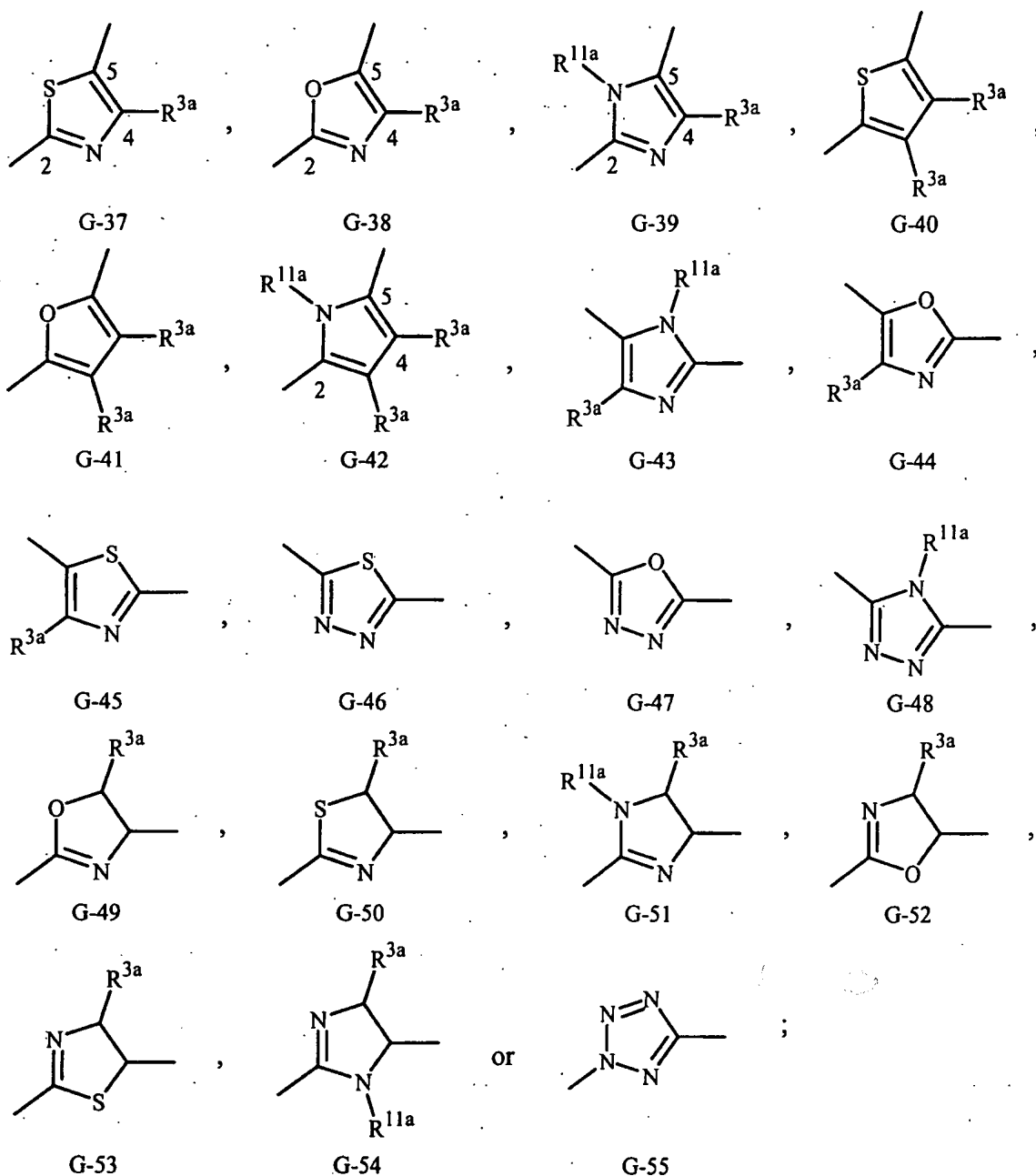
G-34



G-35



G-36



em que cada R^3 é independentemente alquila C_1 - C_3 , haloalquila C_1 - C_3 ou halogênio; cada R^{3a} é independentemente selecionado de H ou R^3 , R^{11} é alquila C_1 - C_3 ; R^{11a} é selecionado de H ou R^{11} ; e a ligação que se projeta para a esquerda está ligada ao X, e a ligação que se projeta para a direita está ligada a Z.

Realização 37. Um composto da Realização 36 em que G é selecionado a partir de G-1 até G-3, G-7, G-8, G-10, G-11, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26 até G-28, G-30, G-36 até G-38 e G-49 até G-55.

Realização 38. Um composto da Realização 37 em que G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-36 até G-38, G-49, G-50 e G-55.

Realização 39. Um composto da Realização 38 em que G é
5 selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 e G-38.

Realização 40. Um composto da Realização 39 em que G é selecionado a partir de G-1, G-2, G-15, G-26 e G-36.

Realização 41. Um composto da Realização 36 em que G é G-1.
São importantes as realizações destes compostos das Realizações de 1 a 35,
10 Realizações de 46 a 96, Realizações de A1 a A4, e Realizações de A6 a A13.

Realização 42. Um composto da Realização 36 em que G é G-2.
São importantes as realizações destes compostos nas Realizações de 1 a 35,
Realizações de 46 a 96, Realizações de A1 a A4, e Realizações de A6 a A13.

Realização 43. Um composto de 36 realização onde G é o G-15.
15 São importantes as realizações destes compostos nas Realizações de 1 a 35,
Realizações 46 a 96, Realizações de A1 a A4, e Realizações de A6 a A13.

Realização 44. Um composto da Realização 36 em que G é G-26.
São importantes as realizações destes compostos nas Realizações de 1 a 35,
Realizações de 46 a 96, Realizações de A1 a A4 e Realizações de A6 a A13.

20 Realização 45. Um composto da Realização 36 em que G é G-36.
São importantes as realizações destes compostos nas Realizações de 1 a 35,
Realizações de 46 a 96, Realizações de A1 a A4, e Realizações de A6 a A13.

Realização 46. Um composto de Fórmula 1 em que G é um anel
heteroaromático de 5-membros ou um anel heterocíclico saturado ou
25 parcialmente saturado de 5 membros, cada anel opcionalmente substituído por
até 2 substituintes selecionados a partir de R^3 nos membros do anel de
carbono e selecionados a partir de R^{11} nos membros do anel de nitrogênio;
cada R^{11} é independentemente alquila C_1 - C_3 ; cada R^3 é independentemente

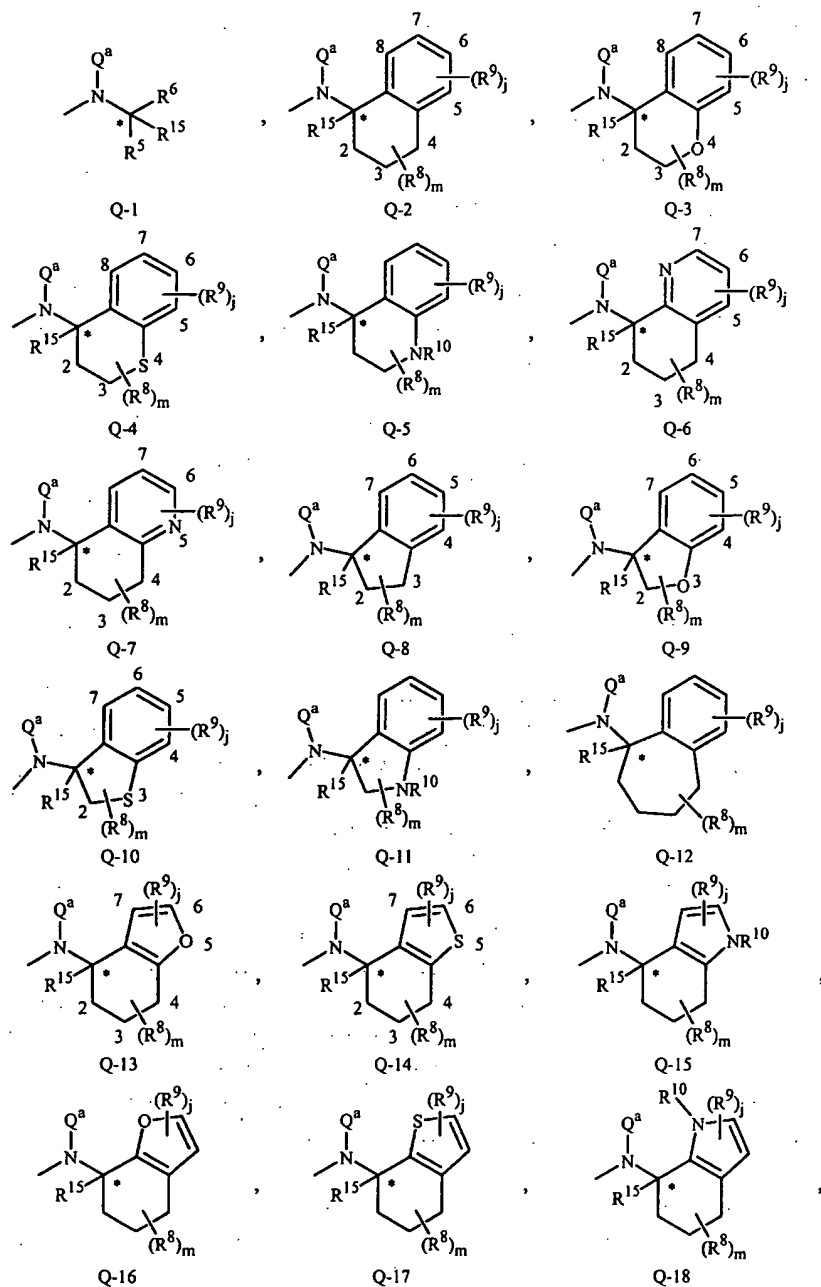
alquila C₁-C₃ ou halogênio.

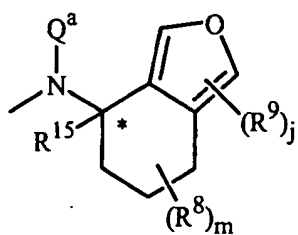
Realização 47. Um composto da Realização 46 em que R³ é metila.

Realização 48. Um composto de qualquer uma das Realização de 36 a 45 em que G não é substituído.

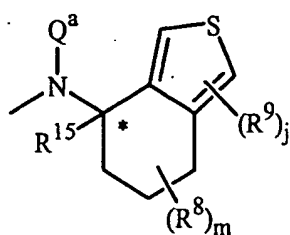
5 Realização 49. Um composto da Realização 36 em que R^{3a} é H e R^{11a} é H ou metila.

Realização 50. Um composto de Fórmula 1 em que Q é selecionado de Q1 a Q-85;

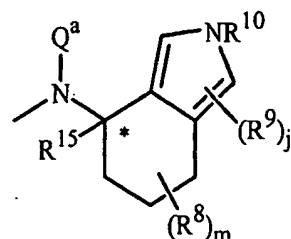




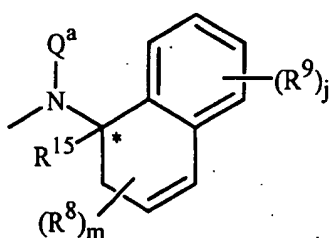
Q-19



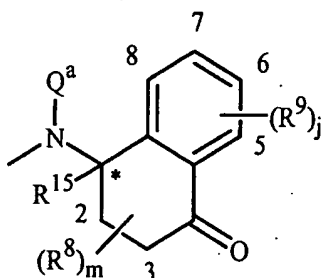
Q-20



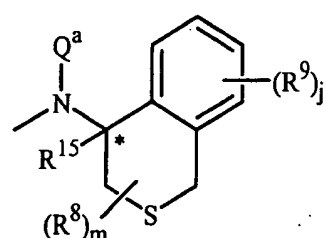
Q-21



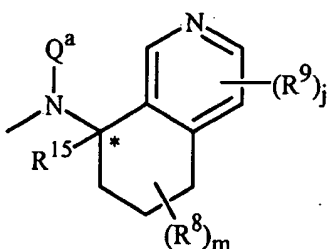
Q-22



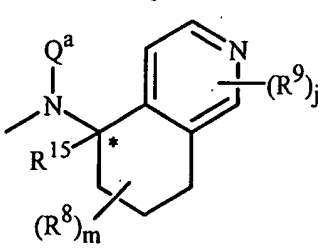
Q-23



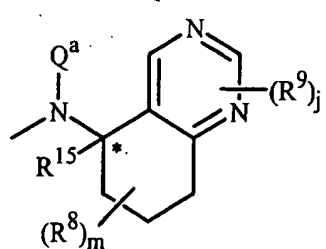
Q-24



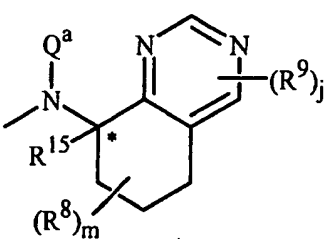
Q-25



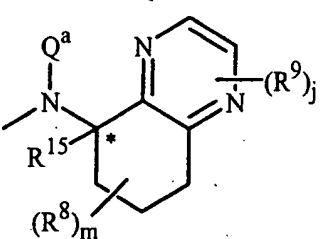
Q-26



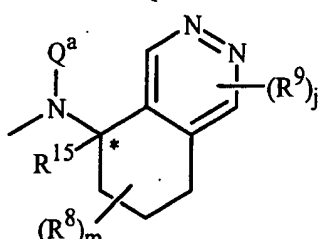
Q-27



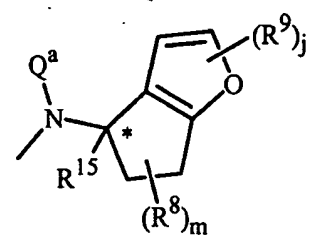
Q-28



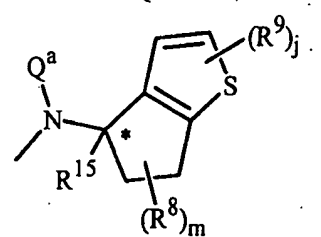
Q-29



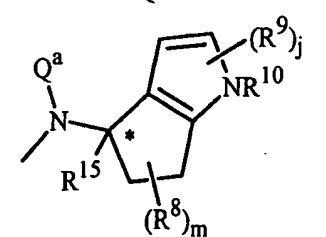
Q-30



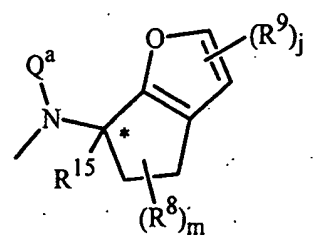
Q-31



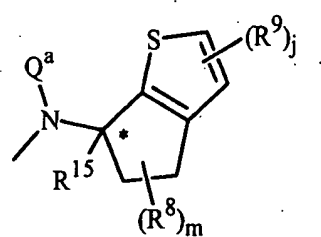
Q-32



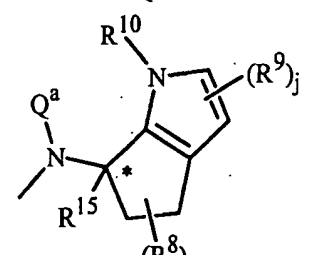
Q-33



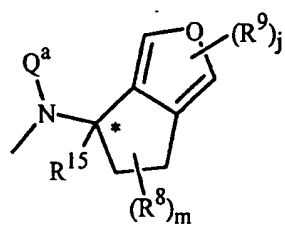
Q-34



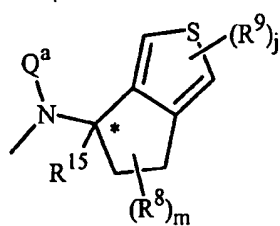
Q-35



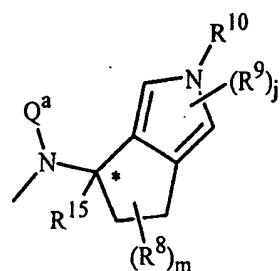
Q-36



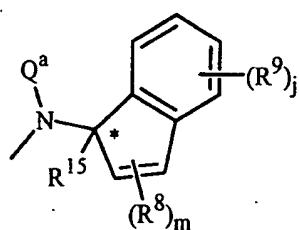
Q-37



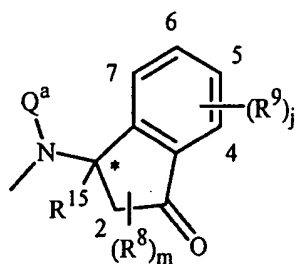
Q-38



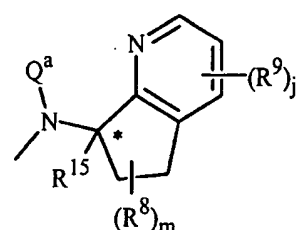
Q-39



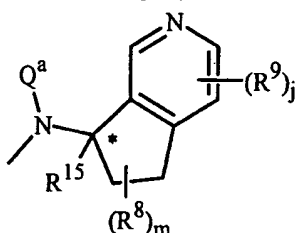
Q-40



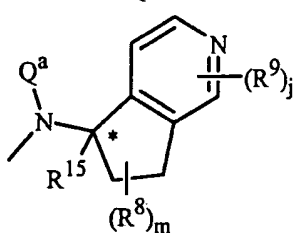
Q-41



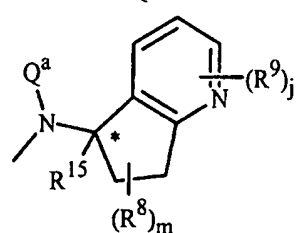
Q-42



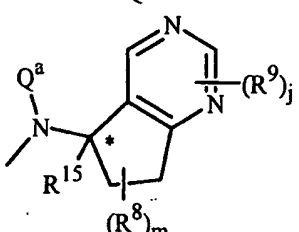
Q-43



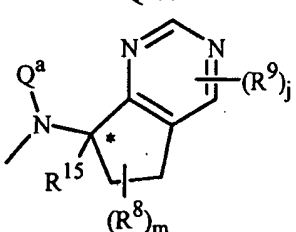
Q-44



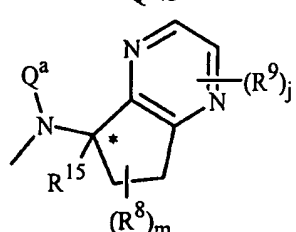
Q-45



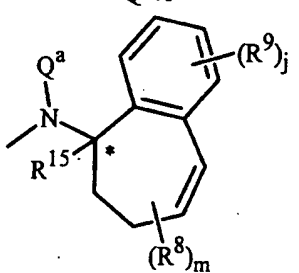
Q-46



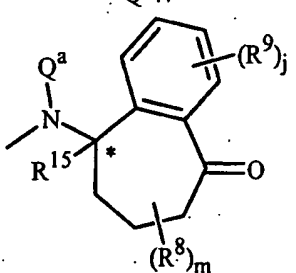
Q-47



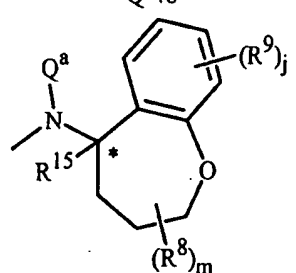
Q-48



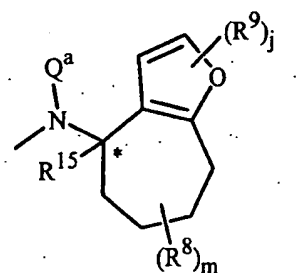
Q-49



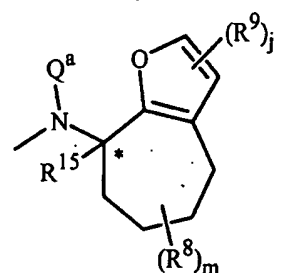
Q-50



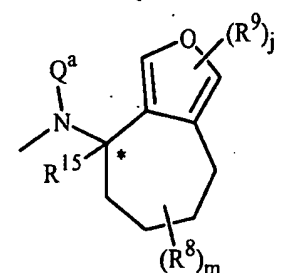
Q-51



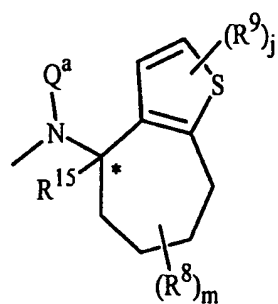
Q-52



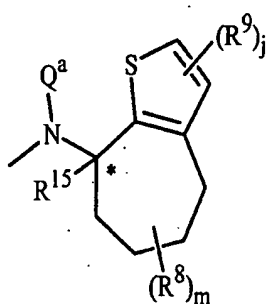
Q-53



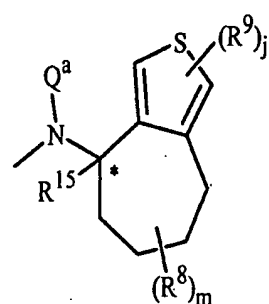
Q-54



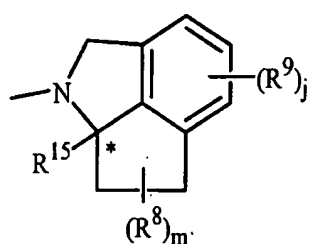
Q-55



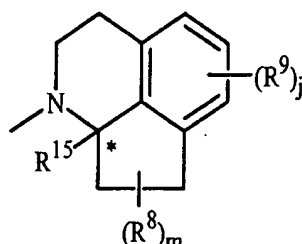
Q-56



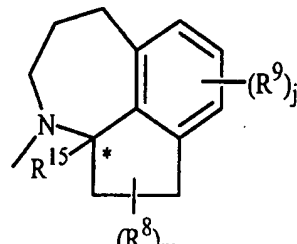
Q-57



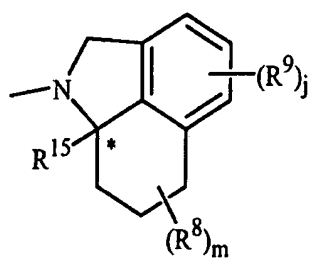
Q-58



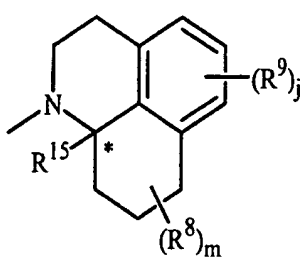
Q-59



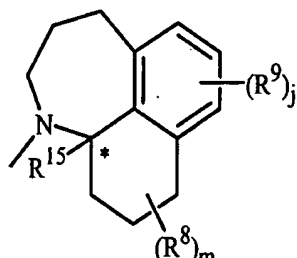
Q-60



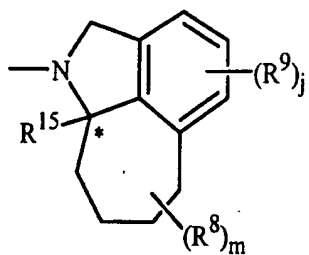
Q-61



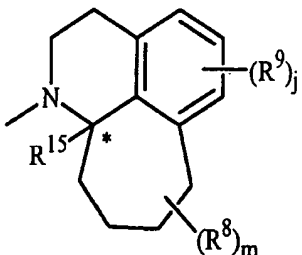
Q-62



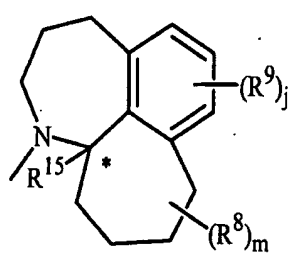
Q-63



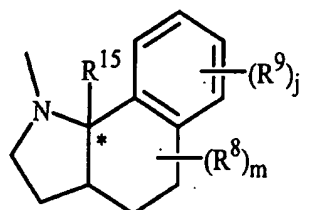
Q-64



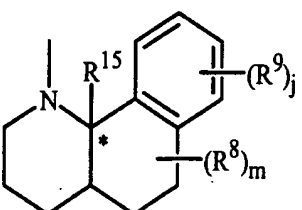
Q-65



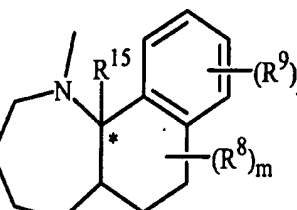
Q-66



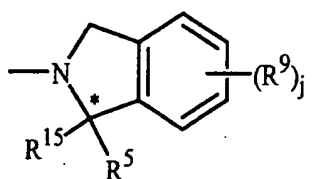
Q-67



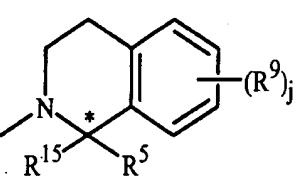
Q-68



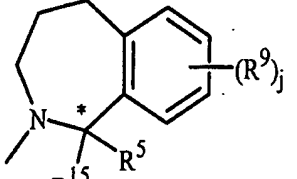
Q-69



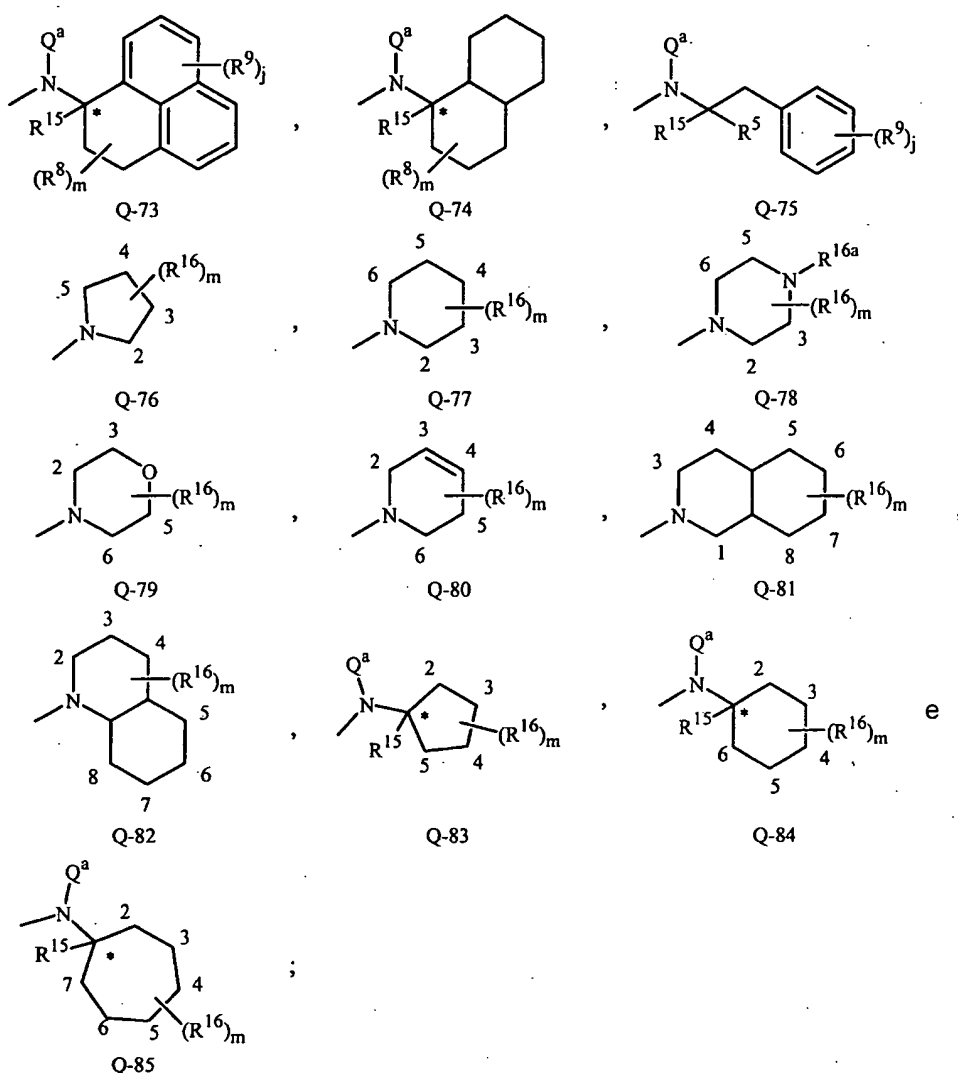
Q-70



Q-71



Q-72



em que o átomo de carbono identificados com asterisco (*) contém um estereocentro; R^{15} é conforme descrito acima, e para Q-2 até Q-75, cada R^8 está independentemente ligado nos átomos de carbono do anel carbocíclico não aromático ou anel heterocíclico do grupo Q, e cada R^9 está independentemente ligado nos átomos de carbono da fenila ou do anel heteroaromático do grupo Q,

cada R^8 é independentemente H, alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_3-C_4 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 , haloalquinila C_2-C_4 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 ,

haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₆,
 cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₁-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila
 C₂-C₄, alcóxicarbonila C₂-C₄, alquilcarbonilóxi C₂-C₄, alquilcarboniltio C₂-C₄,
 alquilaminocarbonila C₂-C₄, alquilaminocarbonilóxi C₂-C₄,
 5 dialquilaminocarbonila C₃-C₆ ou trialquilsilil C₃-C₆;

cada R⁹ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆,
 alquinila C₃-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆,
 haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano,
 nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄,
 10 alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄,
 haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈,
 cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila
 C₂-C₄, alcóxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆,
 alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilil C₃-C₆;

15 - R¹⁰ é H ou alquila C₁-C₃;

- m é 0, 1 ou 2;

- j é 0, 1 ou 2;

- cada R¹⁶ é independentemente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆,
 alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-
 20 C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆,
 haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano,
 nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄,
 alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄,
 haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈,
 25 cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila
 C₂-C₄, alcóxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆,
 alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₆ ou trialquilsilil C₃-C₆,
 ou um anel fenila ou benzila, opcionalmente substituído por até 3 substituintes

selecionados a partir de R^{13} , ou

- dois R^{16} ligados nos átomos de carbono do anel adjacentes são empregados em conjunto como $-(CH_2)_3-$ ou $-(CH_2)_4-$ opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes selecionados a partir de alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , halogênio, hidróxi, amino, ciano e nitro;

- R^{16a} é H, alquila C_1-C_6 , alquenila C_3-C_6 , alquinila C_3-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_3-C_6 , haloalquinila C_3-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , amino, alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 ou dialquilaminocarbonila C_3-C_8 , ou um anel fenila ou benzila, opcionalmente substituído por até 3 substituintes selecionados a partir de R^{13} ,

- cada R^{13} é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialquilsilil C_3-C_6 ;

- R^6 é uma fenila, benzila, naftalenila, cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquenila C_3-C_6 ou um anel heteroaromático de 5 ou 6 membros, cada um opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes selecionados a partir de R^7 nos membros do anel de carbono e R^{12} nos membros do anel de nitrogênio;

- cada R^7 é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialquilsilil C_3-C_6 ; e
- R^{12} é H ou alquila C_1-C_3 .

Realização 51. Um composto de Fórmula 1 em que Q é selecionado a partir de Q-1 até Q-4, Q-8 até Q-10, Q-12, Q-14, Q-22 até Q-24, Q-40, Q-41, Q-59, Q-62, Q-74 e Q-84.

- Realização 52. Um composto da Realização 51 em que Q é Q-1, Q-2, Q-8, Q-14, Q-23, Q-41, Q-59 ou Q-62.

Realização 53. Um composto da Realização 52 em que Q é Q-1, Q-2, Q-8, Q-23 ou Q-41.

Realização 54. Um composto da Realização 53 em que Q é Q-1.

- Realização 55. Um composto da Realização 53 em que Q é Q-2.

Realização 56. Um composto da Realização 53 em que Q é Q-8.

Realização 57. Um composto da Realização 53 em que Q é Q-23.

Realização 58. Um composto da Realização 53 em que Q é Q-41.

- Realização 59. Um composto de Fórmula 1 em que R^5 é alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 , cicloalquila C_3-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 , haloalquinila C_2-C_4 , halocicloalquila C_3-C_4 , ciano, nitro, alcoxialquila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 ou dialquilaminocarbonila C_3-C_8 .

Realização 60. Um composto da Realização 59 em que R^5 é alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 , cicloalquila C_3-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 , haloalquinila C_2-C_4 , halocicloalquila C_3-C_4 , ciano ou alcóxialquila C_2-C_4 .

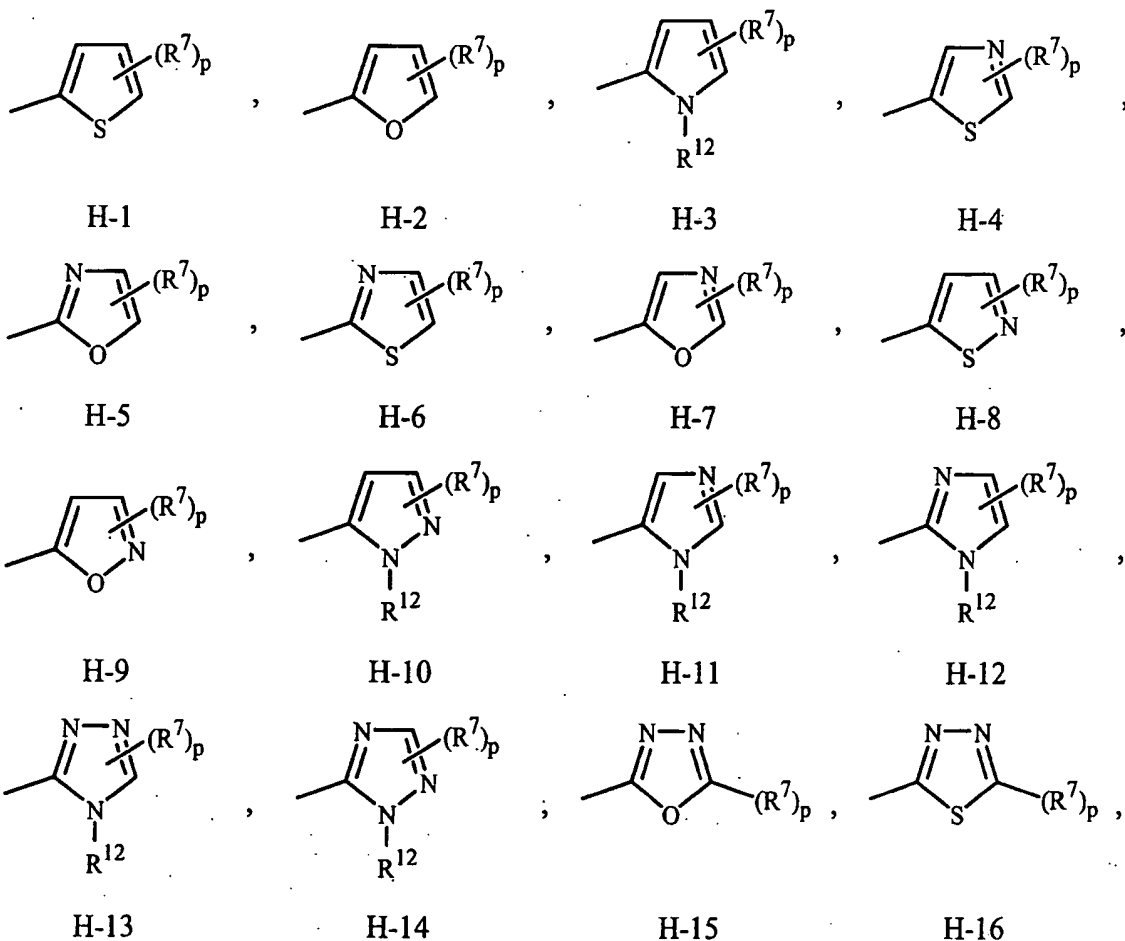
5 Realização 61. Um composto da Realização 60 em que R^5 é alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 ou ciano.

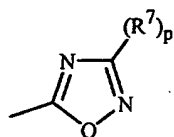
Realização 62. Um composto da Realização 61 em que R^5 é alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 ou ciano.

10 Realização 63. Um composto da Realização 62 em que R^5 é alquila C_1-C_3 .

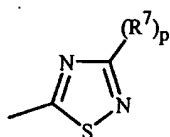
Realização 64. Um composto da Realização 63 em que R^5 é etila.

Realização 65. Um composto da Realização 50 em que R^6 é um dentre H-1 até H-46;

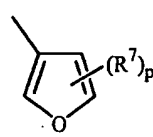




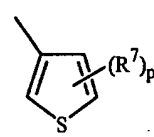
H-17



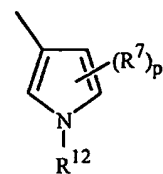
H-18



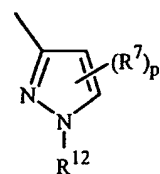
H-19



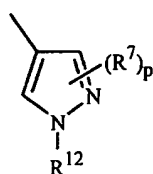
H-20



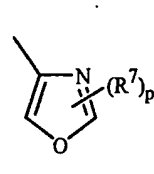
H-21



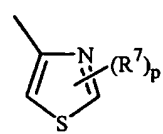
H-22



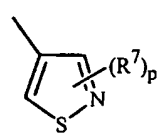
H-23



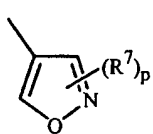
H-24



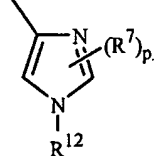
H-25



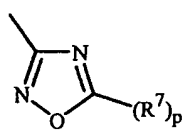
H-26



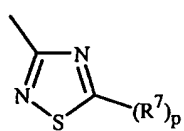
H-27



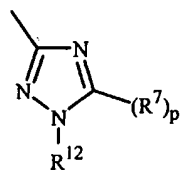
H-28



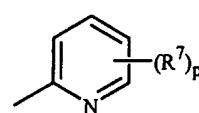
H-29



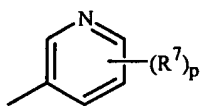
H-30



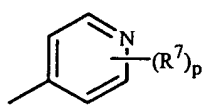
H-31



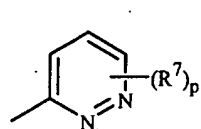
H-32



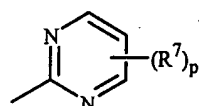
H-33



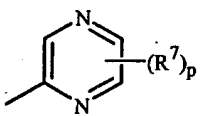
H-34



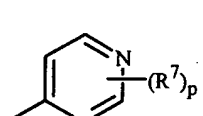
H-35



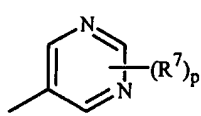
H-36



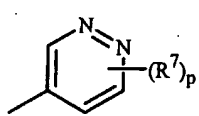
H-37



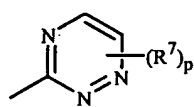
H-38



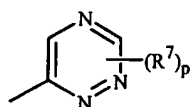
H-39



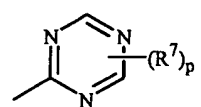
H-40



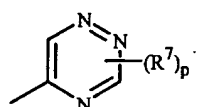
H-41



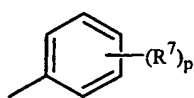
H-42



H-43

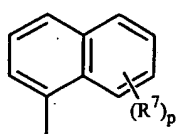


H-44



H-45

or



H-46

em que cada R^7 é independentemente alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxycarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialquilsilila C_3-C_6 ; e p é 0, 1 ou 2.

Realização 66. Um composto da Realização 65 em que R^6 é H-1, H-20, H-32, H-45 ou H-46.

Realização 67. Um composto da Realização 66 em que R^6 é H-1 ou H-45.

Realização 68. Um composto da Realização 67 em que R^6 é H-45.

Realização 69. Um composto de Fórmula 1 em que Q^b é $CR^5R^6R^{15}$; R^6 é uma fenila, benzila, naftalenila, cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquenila C_3-C_6 ou um anel heteroaromático de 5 ou 6 membros, cada um opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes selecionados a partir de R^7 nos membros do anel de carbono e de R^{12} nos membros do anel de nitrogênio; cada R^7 é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , haloalquinila C_2-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, hidróxi, alcóxi C_1-C_2 , haloalcóxi C_1-C_2 , alquiltio C_1-C_2 , haloalquiltio C_1-C_2 , alcoxialquila C_2-C_3 , alquilcarbonila C_2-C_3 , alquilcarbonilóxi C_2-C_3 , alcoxycarbonila C_2-C_3 , alquilaminocarbonila C_2-C_3 ou dialquilaminocarbonila C_3-C_4 ; e R^{12} é alquila C_1-C_3 .

Realização 70. Um composto da Realização 69 em que cada R^7 é

independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , haloalquinila C_2-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, hidróxi, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

Realização 71. Um composto da Realização 70 em que R^7 é
5 independentemente halogênio, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , hidróxi, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

Realização 72. Um composto da Realização 71 em que R^7 é independentemente halogênio, hidróxi, alcóxi C_1-C_2 ou alquila C_1-C_3 .

Realização 73. Um composto da Realização 72 em que cada R^7 é
10 independentemente F, Cl, Br, hidróxi, metóxi ou metila.

Realização 74. Um composto da Realização 65 em que p é 0.

Realização 75. Um composto da Realização 65 em que R^{12} é H ou alquila C_1-C_2 .

Realização 76. Um composto da Realização 75 em que R^{12} é metila.

15 Realização 77. Um composto de Fórmula 1 em que R^{15} é H, alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 , cicloalquila C_3-C_4 ou haloalquila C_1-C_4 .

Realização 78. Um composto da Realização 77 em que R^{15} é H ou alquila C_1-C_3 .

20 Realização 79. Um composto da Realização 78 em que R^{15} é H.

Realização 80. Um composto de Fórmula 1 em que Q^a é H ou alquila C_1-C_3 .

Realização 81. Um composto da Realização 80 em que Q^a é H ou metila.

25 Realização 82. Um composto da Realização 81 em que Q^a é metila.

Realização 83. Um composto da Realização 50 em que cada R^8 é independentemente H, alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_3-C_4 ,

cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄ ou alquilcarbonilóxi C₂-C₄.

Realização 84. Um composto da Realização 83 em que cada R⁸ é independentemente H, alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₃-C₄, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₄, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄ ou alquilcarbonilóxi C₂-C₄.

Realização 85. Um composto da Realização 84 em que cada R⁸ é independentemente H, alquila C₁-C₃, hidróxi, alcóxi C₁-C₃ ou alquilcarbonilóxi C₂-C₃.

Realização 86. Um composto da Realização 85 em que R⁸ é H, metila, hidróxi ou metóxi.

Realização 87. Um composto da Realização 50 em que m é 0 ou 1.

Realização 88. Um composto da Realização 87 em que m é 0.

Realização 89. Um composto da Realização 50 em que cada R⁹ é independentemente alquila C₁-C₃, alquenila C₂-C₃, alquinila C₂-C₃, ciclopropila, haloalquila C₁-C₃, haloalquenila C₂-C₃, haloalquinila C₂-C₃, halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, hidróxi, alquilcarbonilóxi C₂-C₃, alcóxi C₁-C₂, haloalcóxi C₁-C₂, alquiltio C₁-C₂, haloalquiltio C₁-C₂, alcoxialquila C₂-C₃, alquilcarbonila C₂-C₃, alcóxicarbonila C₂-C₃, alquilaminocarbonila C₂-C₃ ou dialquilaminocarbonila C₃-C₄.

Realização 90. Um composto da Realização 89 em que cada R⁹ é independentemente alquila C₁-C₃, ciclopropila, haloalquila C₁-C₃, halociclopropila, halogênio, hidróxi, alquilcarbonilóxi C₂-C₃, alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂.

Realização 91. Um composto da Realização 90 em que cada R⁹ é independentemente alquila C₁-C₃, hidróxi, alcóxi C₁-C₂ ou halogênio.

Realização 92. Um composto da Realização 91 em que cada R⁹ é

independentemente metila, F, Cl, Br, hidróxi ou metóxi.

Realização 93. Um composto da Realização 50 em que j é 0 ou 1.

Realização 94. Um composto da Realização 93 em que j é 0.

Realização 95. Um composto de 50 em que cada R^{10} é H ou metila.

5 Realização 96. Um composto de Fórmula 1 em que Q é de Q-1 até Q-75 e Q-83 até Q-85 e Q possui a orientação descrita acima na Realização 50, e em que R^{15} possui uma orientação abaixo do plano definido pelos três átomos de hidrogênio no carbono identificado com o asterisco (*) (por exemplo, para Q-1, a Fórmula 1).

10 Realização 97. Um composto da Realização 50 em que cada R^{16} é independentemente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , haloalquinila C_2-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 , ou um anel fenil ou benzil, opcionalmente substituído por até 3 substituintes
15 selecionados a partir de R^{13} .

Realização 98. Um composto da Realização 50 em que R^{16a} é H, alquila C_1-C_3 , alila, propargila, ciclopropila ou haloalquila C_1-C_3 , ou um anel fenil ou benzil, opcionalmente substituído por até 3 substituintes selecionados a partir de R^{13} .

20 Realização 99. Um composto da Realização 50 em que quando Q é Q-76, Q-77, Q-79, Q-80, Q-81, Q-82, Q-83, Q-84 ou Q-85, então m é 0 ou 1.

Realização 100. Um composto da Realização 99 em que m é 1.

Realização 101. Um composto da Realização 50 em que quando Q é Q-78 e R^{16a} é diferente de H, então m é 0.

25 Realização 102. Um composto da Realização 50 em que quando Q é Q-78 e R^{16a} é H, então m é 1.

Realização 103. Um composto da Realização 50 em que quando Q é Q-78, então R^{16a} é diferente H e m é 0.

As realizações da presente invenção, incluindo as Realizações de 1 a 103 acima, assim como quaisquer outras realizações descritas no presente, podem ser combinadas de qualquer modo, e as descrições das variáveis nas realizações se referem não só aos compostos de Fórmula 1, mas também aos compostos de partida e aos compostos intermédios úteis para a preparação dos compostos de Fórmula 1. Além disso, as realizações da presente invenção, incluindo as Realizações de 1 a 103 acima, bem como quaisquer outras realizações descritas no presente, e qualquer combinação das mesmas, se referem às composições e aos métodos da presente invenção.

As combinações das Realizações de 1 a 103 são representadas por:

Realização A1. Um composto de Fórmula 1 em que n é 0, R^1 é uma fenila ou um anel heteroaromático de 5 ou 6 membros, cada um opcionalmente substituído por 1 a 2 substituintes independentemente selecionados a partir de R^4 ; e cada R^4 é independentemente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 , cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialquilsilila C_3-C_6 .

Realização A2. Um composto da Realização A1 em que W^1 é O.

Realização A3. Um composto da Realização A2 em que A é NR^{18} ou metileno opcionalmente substituído por R^{17} ; R^{17} é H, alquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou alcoxicarbonila C_2-C_3 ; R^{18} é H, -CHO, alquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou alcoxicarbonila C_2-C_3 ; Z é $C=W^2$ ou metileno opcionalmente substituído por R^{19} , R^{19} é H, alquila C_1-C_2 , ou haloalquila C_1-C_2 .

Realização A4. Um composto da Realização A3 em que X é X¹ ou X².

Realização A5. Um composto da Realização A4 em que G é G-1, G-2, G-15, G-26 ou G-36.

Realização A6. Um composto da Realização A5 em que G não é substituído.

Realização A7. Um composto da Realização A6 em que Q é Q-1, Q-2, Q-8, Q-23 ou Q-41 e Q^a é H ou alquila C₁-C₃.

Realização A8. Um composto da Realização A7 em que R⁵ é alquila C₁-C₃, R⁶ é H-45, R¹⁵ é H e p é 0.

Realização A9. Um composto da Realização A7 em que j é 0, m é 0 ou 1, e R⁸ é H, metila, metóxi ou hidróxi.

Realização A10. Um composto de qualquer uma das Realizações A8 e A9 em que R¹ é U-1 ou U-50.

Realização A11. Um composto da Realização A10 em que cada R⁴ é independentemente Cl, Br, metila, etila, trifluorometila ou metóxi.

Realização A12. Um composto da Realização A11 em que Q é Q-1, Q^a é metila, R⁵ é alquila C₁-C₂, R¹⁵ é H e o átomo de carbono em que R⁵ e R⁶ estão ligados é um estereocentro com a configuração R.

Realização A13. Um composto da Realização A11 em que Q é Q-2, Q-8, Q-23 ou Q-41, Q^a é metila, R¹⁵ é H e o átomo de carbono identificado com o asterisco (*) é um estereocentro que possui uma configuração descrita como R, desde que, quando m for de 1, R⁸ é hidróxi ou metóxi e o grupo R⁸ está ligado ao carbono adjacente ao átomo de carbono identificado com um asterisco (*) então, o átomo de carbono identificado com o asterisco (*) é um estereocentro que possui uma configuração descrita como S.

As realizações específicas incluem os compostos de Fórmula 1 selecionados a partir do grupo que consiste em:

- 1-[4-[4-[[metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]amino]metil]-2-

tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona

(Composto 1),

- 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-L-[4-[4-[[[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]amino]metil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona (Composto 2),

5 - N-[[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil]metil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]acetamida (Composto 3),

- N-[[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil]metil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]formamida

10 (Composto 4),

- N-metil-2-[1-[3-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-oxopropil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]-4-thiazolcarboxamida (Composto 5), e

- etil 4-[4-[[metil(1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil)amino]carbonila]-2-tiazolil]- α -[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]- β -oxo-1-piperidinapropanoato
15 (Composto 6).

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel tiazol, Q é Q-1 e X é X¹ e X está ligado ao anel tiazol G na posição 2 de dito anel tiazol. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre
20 as Realizações de 1 a 35, Realização 41, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e Realizações A10 até A12.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel oxazol, Q é Q-1 e X é X¹ e X está ligado ao anel oxazol G na posição 2 de dito
25 anel oxazol. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre as Realizações de 1 a 35, Realização 42, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e Realizações A10 até A12.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel tiazol, Q é Q-1 e X é X^2 e X é ligado ao anel tiazol G na posição 2 de dito anel tiazol. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre as Realizações de 1 a 11, Realizações 14 a 35, realização 41, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e Realizações A10 até A12.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel oxazol, Q é Q-1 e X é X^2 e X está ligado ao anel oxazol G na posição 2 de dito anel oxazol. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre as Realizações 1 a 11, Realizações 14 a 35, Realização 41, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e Realizações A10 até A12. São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel tiazol, Q é Q-2 e X é X^1 e X está ligado ao anel tiazol G na posição 2 de dito anel tiazol. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre as Realizações de 1 a 35, Realização 41, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e Realizações A10 até A12.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel oxazol, Q é Q-2 e X é X^1 e X está ligado ao anel oxazol G na posição 2 de dito anel oxazol. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre as Realizações de 1 a 35, Realização 42, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e Realizações A10 até A12.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel tiazol, Q é Q-2 e X é X^2 e X está ligado ao anel tiazol G na posição 2 de dito anel tiazol. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre as Realizações de 1 a 11, Realizações 14 a 35, Realização 41, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e

Realizações A10 até A12.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel oxazol, Q é Q-2 e X é X² e X está ligado ao anel oxazol G na posição 2 de dito anel oxazol. São de interesse particular as realizações desses compostos
 5 dentre as Realizações de 1 a 11, Realizações 14 a 35, Realização 41, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e Realizações A10 até A12.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel tiazol, Q é Q-8 e X é X² e X está ligado ao anel tiazol G na posição 2 de dito
 10 anel tiazol. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre as Realizações de 1 a 35, Realização 41, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e Realizações A10 até A12.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel oxazol, Q é Q-8 e X é X¹ e X está ligado ao anel oxazol G na posição 2 de dito
 15 anel oxazol. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre as Realizações de 1 a 35, Realização 42, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e Realizações A10 até A12.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel tiazol, Q é Q-8 e X é X² e X está ligado ao anel tiazol G na posição 2 de dito
 20 anel tiazol. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre as Realizações de 1 a 11, Realizações 14 a 35, Realização 41, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e
 25 Realizações A10 até A12.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que G é o anel oxazol, Q é Q-8 e X é X² e X está ligado ao anel oxazol G na posição 2 de dito anel oxazol. São de interesse particular as realizações desses compostos

dentre as Realizações de 1 a 11, Realizações 14 a 35, Realização 41, Realizações 59 a 82, Realização 96, Realizações A1 até A4, Realização A6, Realização A8 e Realizações A10 até A12.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que Z é o metileno. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre as Realizações de 1 a 4 e as Realizações de 6 até 103.

São importantes os compostos de Fórmula 1 em que Z é C=O. São de interesse particular as realizações desses compostos dentre as Realizações de 1 a 4 e as Realizações de 7 até 103.

A presente invenção apresenta uma composição fungicida que compreende um composto de Fórmula 1 (incluindo todos os isômeros geométricos e estereoisômeros, N-óxidos e seus sais), e pelo menos um outro fungicida. São importantes como a realização de tais composições as composições que compreendem um composto que corresponde a qualquer uma das realizações do composto descritas acima.

A presente invenção apresenta uma composição que compreende uma quantidade fungicida eficaz de um composto de Fórmula 1 (incluindo todos os isômeros geométricos e estereoisômeros, N-óxidos e seus sais), e pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste em tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos. São importantes como a realização de tais composições as composições que compreendem um composto correspondente a qualquer das realizações dos compostos descritas acima.

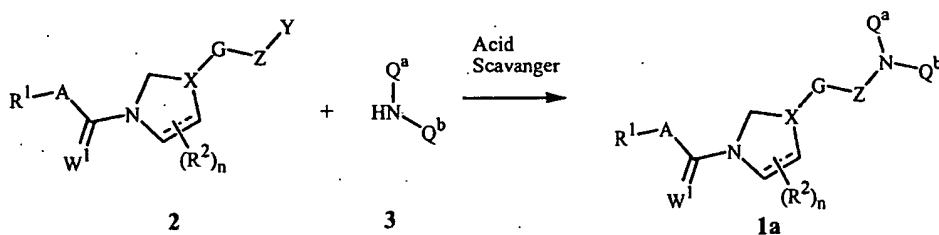
A presente invenção apresenta um método para o controle das doenças vegetais causadas por patógenos vegetais fúngicos que compreendem a aplicação no vegetal ou parte do mesmo, ou na semente ou muda vegetal, de uma quantidade fungicida eficaz de um composto de Fórmula 1 (incluindo todos os isômeros geométricos e estereoisômeros, N-óxidos e

seus sais). É importante como a realização de tais métodos os métodos que compreendem uma aplicação de uma quantidade fungicida eficaz de um composto que correspondente a qualquer das realizações dos compostos descritos acima. São de interesse particular as realizações em que os compostos são aplicados como composições da presente invenção.

Os compostos de Fórmula 1 podem ser preparados por um ou mais dos seguintes métodos e variações conforme descrito nos Esquemas de 1 a 17. As definições de R^1 , R^2 , R^{18} , A, W^1 , W^2 , X, G, Q^a , Q^b , Z e n nos compostos de Fórmulas 1 a 24 abaixo são conforme definidos acima na Descrição Resumida da Invenção, salvo indicações em contrário. Compostos de Fórmulas 1a a 1g são vários subconjuntos dos compostos de Fórmula 1.

Como mostrado no Esquema 1, os compostos de Fórmula 1a podem ser preparados por acoplamento de um composto de Fórmula 2 em que Y é um grupo de saída apropriado, tal como Cl, Br, I ou OMS (mesilato, - O_3SCH_3), com uma amina da Fórmula 3 na presença de um sequestrante ácido. Os sequestrantes ácido típicos incluem as bases de amina, tais como a trietilamina, N,N-diisopropiletilamina e piridina. Outros sequestrantes incluem os hidróxidos, tais como o hidróxido de sódio e de potássio e os carbonatos, tais como o carbonato de sódio e o carbonato de potássio. Em certos exemplos, é útil recorrer aos sequestrantes ácidos suportados por polímero, tais como o N,N-diisopropiletilamina suportado por polímero e a 4-(dimetilamino)piridina ligado ao polímero. As aminas de Fórmula 3, em que Q^a é um grupo alquila, podem ser preparadas ao primeiro aquecer uma amina primária Q^a-NH_2 com um formato de alquila seguido por uma redução com hidreto de alumínio lítio ou pela redução com borohidreto de sódio das N-alquil iminas preparadas pelo tratamento de $Q^a(=O)$ com uma alquilamina.

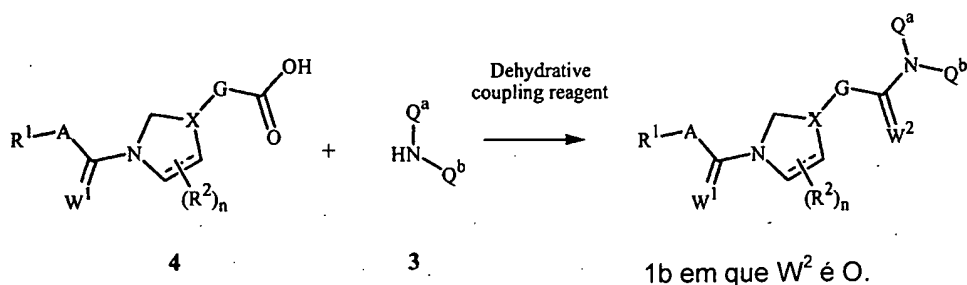
ESQUEMA 1



- em que Y é Cl, Br, I ou OMs.

Um procedimento alternativo para a preparação dos compostos da Fórmula 1b em que W^2 é O está representado no Esquema 2 e envolve a ligação de um ácido de Fórmula 4, com uma amina de Fórmula 3 na presença de um reagente de ligação desidratante, como o dicitohexilcarbodiimida (DCC), hidrocloreto de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (DCE) ou hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il-*N,N,N',N'*-tetrametilurônio (HBTU). Os reagentes suportados por polímero são novamente úteis no presente, tais como a ciclohexilcarbodiimida ligada ao polímero. Estas reações são normalmente realizadas a 0 a 40° C em um solvente, tal como o diclorometano ou a acetonitrila na presença de uma base, tal como a trietilamina ou a *N,N*-diisopropiletilamina. Em uma etapa posterior, as amidas de Fórmula 1b em que W^2 é O podem ser convertidas em tioamidas de Fórmula 1b em que W^2 é S utilizando uma variedade de reagentes tionadores (*thiating*) padrão, tais como o fósforo pentasulfeto ou 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditio-2,4-difosfetano-2,4- dissulfureto (reagente de Lawesson). Um técnico no assunto irá reconhecer que quando W^1 é O, a conversão de W^2 de O para S pode ser acompanhada pela conversão de W^1 de O para S. As aminas de Fórmula 3 são conhecidas ou podem ser preparadas através de métodos conhecidos pelos técnicos no assunto.

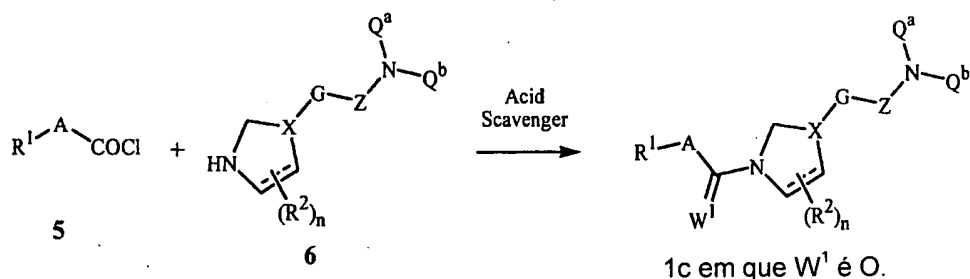
ESQUEMA 2



Conforme mostrado no Esquema 3, os compostos de Fórmula 1c em que W^2 é O podem ser preparados pela ligação de um composto de Fórmula 5 com uma amina de Fórmula 6 na presença de um sequestrante, conforme descrito acima para o Esquema 1. Os sais ácido das aminas de

5 Fórmula 6 também podem ser utilizados nesta reação, desde que pelo menos 2 equivalentes do sequestrante ácido estejam presentes, tal como é conhecido pelo técnico no assunto. Os ácidos típicos utilizados para formar os sais com as aminas incluem o ácido hidrocloreídrico, o ácido oxálico e o ácido trifluoroacético.

10

ESQUEMA 3

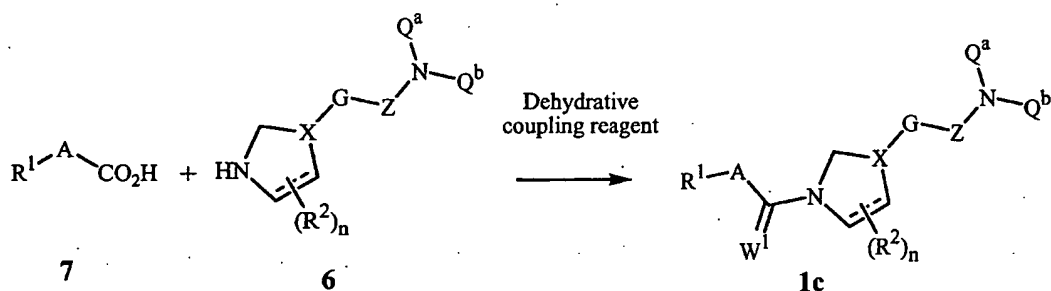
Conforme mostrado no Esquema 4, os compostos de Fórmula 1c em que W^1 é O também podem ser preparados pela ligação de um composto de Fórmula 7 em que A é diferente de NR^{18} com uma amina da Fórmula 6 (ou seu sal ácido) na presença de um reagente de ligação de desidratação,

15 análogo ao procedimento descrito no Esquema 2 acima. Os ácidos de Fórmula 7 são conhecidos ou podem ser obtidos pelos métodos conhecidos pelo técnico no assunto. Por exemplo, o R^1CH_2COOH , em que R^1 é um anel heteroaromático ligado através do nitrogênio, pode ser preparado pela reação do composto R^1H correspondente com um ácido haloacético ou éster na

20 presença de uma base; vide, por exemplo, a patente US 4.084.955. O R^1CH_2COOH , em que R^1 é uma fenila ou um anel heteroaromático ligado através de carbono, pode ser preparado a partir dos compostos R^1CH_2 -halogênio correspondentes pelo deslocamento do halogênio com cianeto

seguido por hidrólise; vide, por exemplo, K. Adachi, *Yuki Gosei Kagaku Kyokaishi* 1969, 27, 875 – 876; de $R^1C(=O)CH_3$ pela reação de Willgerodt-Kindler, vide, por exemplo, H. R. Darabi, et al., *Tetrahedron Letters* 1999, 40, 7549 – 7552 e M. M. Alam e S. R. Adapa, *Synthetic Communications* 2003, 33, 59 – 63 e as referências nele localizadas, ou a partir de R^1Br ou R^1I pela ligação catalisada por paládio, com acetato de *t*-butila ou dietil malonato seguido por hidrólise de éster; vide, por exemplo, W. A. Moradi e S. L. Buchwald, *J. Am. Chem. Soc.* 2001, 123, 7996 – 8002 e J. F. Hartwig et al., *J. Am. Chem. Soc.* 2002, 124, 12557 – 12565.

ESQUEMA 4



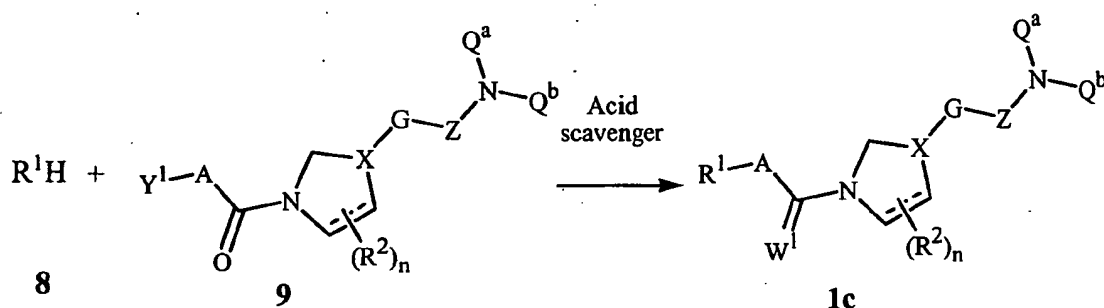
em que A é diferente de NR^{18} , e W^1 é O.

Os métodos sintéticos dos Esquemas 1, 2, 3 e 4 são ilustrativos de uma ampla variedade de métodos de formação de amida geralmente úteis conhecidos no estado da técnica que podem ser utilizados para a preparação dos compostos de Fórmula 1. Um técnico no assunto irá reconhecer que os compostos de Fórmula 1, em que Q^a é diferente de H ou OH podem ser preparados a partir dos compostos de Fórmula 1 em que Q^a é H pelos métodos de alquilação ou acilação padrão. Um técnico no assunto também irá perceber que os cloretos ácido de Fórmula 2, em que ZY é $C(O)Cl$, e de Fórmula 5, em que A é diferente NR^{18} , podem ser preparados a partir dos ácidos de Fórmula 4 e Fórmula 7, respectivamente, através de numerosos métodos bem conhecidos. Os cloretos de carbamoila de Fórmula 5 em que A é NR^{18} podem ser preparados a partir das aminas R^1NHR^{18} correspondentes pela reação com

fosgênio.

Alguns compostos de Fórmula 1c, em que W^1 é O e R^1 é um anel heteroaromático contendo nitrogênio de 5 membros, ligado através do átomo de nitrogênio, podem ser preparados pela reação do heterociclo principal de Fórmula 8 e um composto de haloalquilcarbonila de Fórmula 9 em que A é diferente NR^{18} conforme mostrado no Esquema 5. A reação é realizada na presença de uma base, tal como o hidreto de sódio ou o carbonato de potássio em um solvente, tal como o tetrahidrofurano, a N,N-dimetilformamida ou a acetonitrila de 0 a 80° C. Os compostos de haloalquil-carbonila de Fórmula 9 podem ser preparados pela reação de uma amina da Fórmula 6 com um haleto de haloalquilcarbonila ou um ácido haloalquilcarboxílico ou seu anidrido, análogo às reações de formação de amida descritas nos Esquemas 3 e 4, respectivamente.

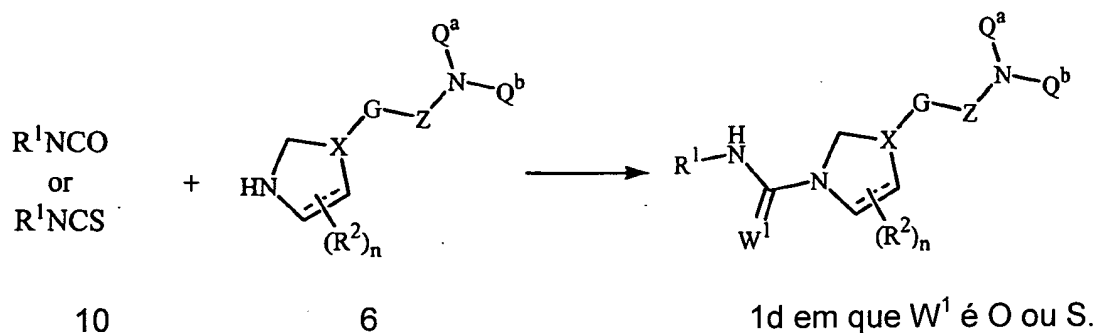
ESQUEMA 5



em que Y^1 é Cl, Br ou I, A é diferente NR^{18} , e W^1 é O.

Os compostos de Fórmula 1d (Fórmula 1 em que A é NH), em que R^1 é uma fenila ou um anel heteroaromático de 5 ou 6 membros ligado por meio de um átomo de carbono e W^1 é O ou S, podem ser preparados pela reação de uma amina de Fórmula 6 com um isocianato ou um isotiocianato de Fórmula 10, respectivamente, conforme descrito no Esquema 6. Esta reação é habitualmente realizada na temperatura ambiente em um solvente aprótico, tal como o diclorometano ou a acetonitrila.

ESQUEMA 6



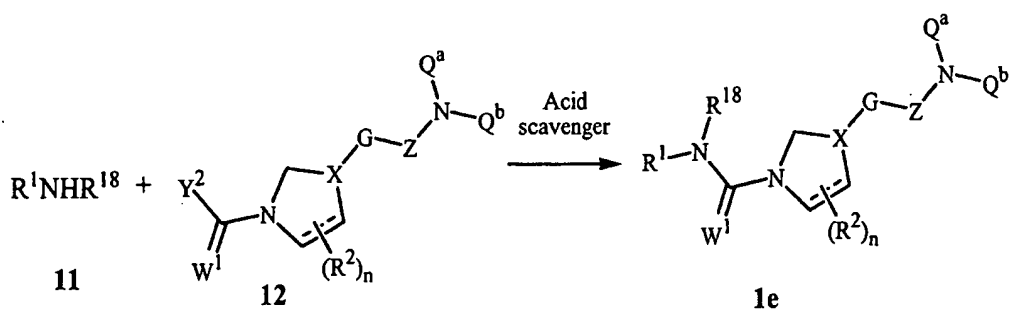
Os compostos de Fórmula 1e em que W¹ é O ou S podem ser preparados pela reação de uma amina de Formula 11, com uma carbamoila ou cloreto de tiocarbamoila ou imidazol de Formula 12 conforme mostrado no

Esquema 7. Quando Y² for cloro, a reação é geralmente realizada na presença de um sequestrante ácido. Os sequestrantes ácidos típicos incluem as bases amina, tais como a trietilamina, *N,N*-diisopropiletilamina e piridina. Outros sequestrantes incluem os hidróxidos, tais como o hidróxido de sódio e de potássio e os carbonatos, tais como o carbonato de sódio e o carbonato de

Os cloretos de carbamoila ou tiocarbamoila de Fórmula 12 (em que Y² é Cl e W¹ é O ou S) podem ser preparados a partir de aminas de Fórmula 6 pelo tratamento com fosgênio ou tiofosgeno, respectivamente, ou seus equivalentes, enquanto que o carbamoil ou tiocarbamoil imidazóis de Fórmula 12 (em que Y² é imidazol-1-il), podem ser preparados a partir das aminas de

Fórmula 6 pelo tratamento com 1,1'-carbonildiimidazol ou 1,1'-tiocarbonildiimidazol, respectivamente, de acordo com métodos gerais conhecidos pelo técnico no assunto.

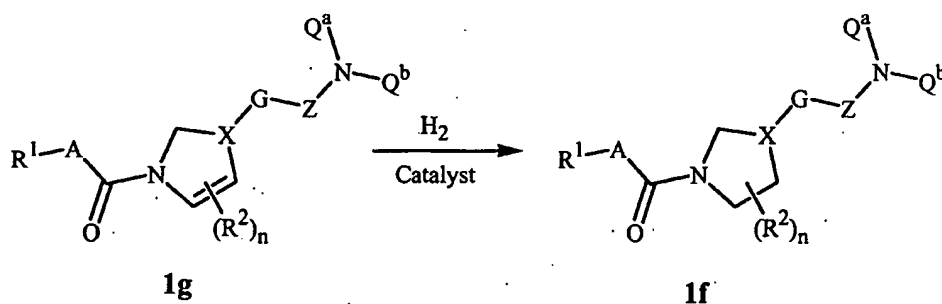
ESQUEMA 7



em que W¹ é O ou S, e Y² é Cl ou imidazol-1-il.

Alguns compostos de Fórmula 1f (Formula 1, quando o anel que contem X está saturado), podem ser preparados a partir de compostos de Fórmula 1g (Fórmula 1, quando o anel que contem X é insaturado) por hidrogenação catalítica conforme mostrado no Esquema 8. As condições normais envolvem a exposição de um composto de Fórmula 1g ao gás hidrogênio, em uma pressão de 70 a 700 kPa, de preferência, de 270 a 350 kPa, na presença de um catalisador metálico, tal como o paládio suportado em um veículo inerte como o carvão ativado, em uma proporção em peso de 5 a 20% do metal para o veículo, suspenso em um solvente, tal como o etanol, na temperatura ambiente. Este tipo de redução é muito bem conhecida; vide, por exemplo, *Catalytic Hydrogenation*, L. Cervený, Ed., Elsevier Science, Amsterdam, 1986. Um técnico no assunto irá reconhecer que algumas outras funcionalidades que podem estar presentes nos compostos de Fórmula 1g também podem ser reduzidas sob condições de hidrogenação catalítica, exigindo, deste modo, uma seleção adequada do catalisador e das condições.

ESQUEMA 8

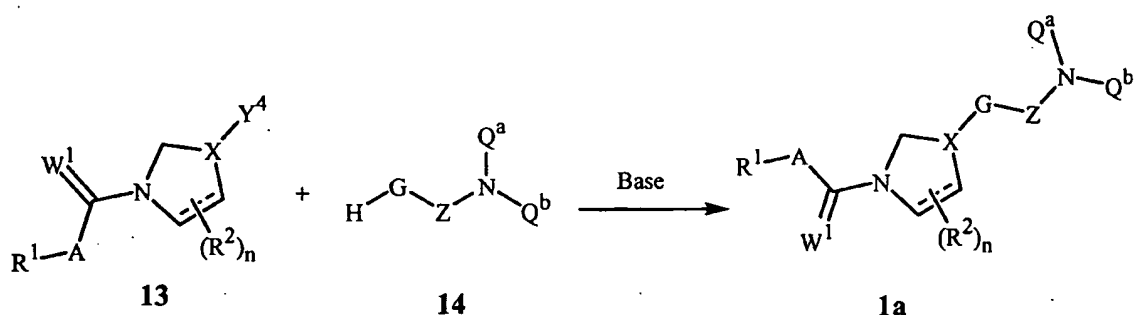


em que X é X¹, X², X⁵ ou X⁸.

Alguns compostos de Fórmula 1a, em que X é X¹ ou X⁵, e G está ligado ao anel contendo X por meio de um átomo de nitrogênio, podem ser preparados pelo deslocamento de um grupo de saída apropriado Y⁴ no anel contendo o X de Fórmula 13, com um heterociclo contendo nitrogênio de Fórmula 14, na presença de uma base conforme ilustrado no Esquema 9. As bases apropriadas incluem o hidreto de sódio ou o carbonato de potássio, e a

reação é realizada em um solvente tal como a N,N-dimetilformamida ou a acetonitrila de 0 a 80° C. Os grupos de saída apropriados nos compostos de Fórmula 13 incluem o brometo, iodo, mesilato ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CH}_3$), triflate ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$) e similares, e os compostos de Fórmula 13 podem ser preparados a partir dos compostos correspondentes em que Y^4 é OH, utilizando os métodos gerais conhecidos no estado da técnica.

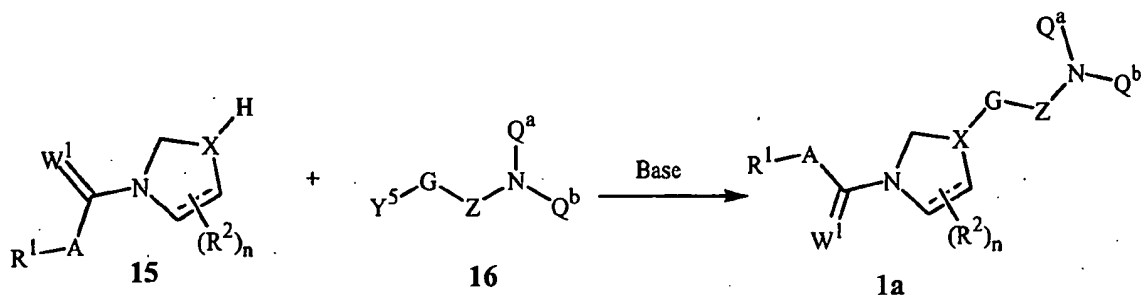
ESQUEMA 9



em que W^1 é O ou S; X é X^1 ou X^5 ; e Y^4 é um grupo de saída, tal como o Br, I, $\text{OS}(\text{O})_2\text{Me}$ ou $\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$.

Os compostos de Fórmula 1a em que X é X^2 ou X^8 podem ser preparados pela reação de um composto de Fórmula 15 com um haleto heterocíclico ou triflate ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$) de Fórmula 16, tal conforme mostrado no Esquema 10. A reação é realizada na presença de uma base, tal como o carbonato de potássio em um solvente, tal como o dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida ou acetonitrila de 0 a 80° C. Os compostos de Fórmula 16, em que Y^5 é o triflate, podem ser preparados a partir dos compostos correspondentes, em que Y^5 é OH, pelos métodos conhecidos pelo técnico no assunto.

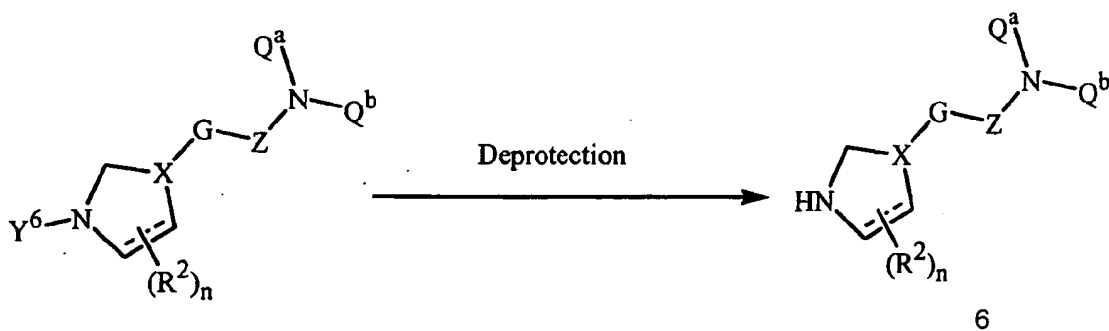
ESQUEMA 10



em que W^1 é O ou S; X é X^2 ou X^8 ; e Y^5 é um grupo de saída tal como o Br, I, $OS(O)_2Me$ ou $OS(O)_2CF_3$.

Os compostos de amina de Fórmula 6 podem ser preparados a partir dos compostos de amina protegidos correspondentes de Fórmula 17 em que Y^6 é um grupo protetor de amina, tal como mostrado no Esquema 11. Um vasto conjunto de grupos protetores de amina está disponível (vide, por exemplo, T. W. Greene and P. G. M. Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2^a ed.; Wiley: Nova Iorque, 1991), e a utilização e seleção dos grupos de proteção adequados serão evidentes para os técnicos no assunto na síntese química. O grupo de proteção pode ser removido e a amina isolada como seu sal ácido ou a amina livre pelos métodos gerais conhecidos no estado da técnica. Um técnico no assunto também irá reconhecer que as aminas protegidas de Fórmula 17 podem ser preparadas por métodos análogos aos descritos nos Esquemas 6 ou 7 acima em que o grupo $R^1NHC(=W^1)$ ou $R^1NR^{18}C(=W^1)$ é substituído por Y^6 .

ESQUEMA 11



Os compostos de Fórmula 17 também podem ser preparados pela reação de um composto devidamente funcionalizado de Fórmula 18 com um composto devidamente funcionalizado de Fórmula 19 conforme mostrado no Esquema 12. Os grupos funcionais Y^7 e Y^8 são selecionados a partir de, mas não limitado a, partes de moléculas tais como aldeídos, cetonas, ésteres, ácidos, amidas, tioamides, nitrilas, aminas, alcoóis, tióis, hidrazinas, oximas,

amidinas, amida oximas, olefinas, acetilenos, halogênios, haletos de alquila, metanesulfonatos, trifluorometanosulfonatos, ácidos borônicos, boronates e similares, que nas condições de reação apropriadas, irão permitir a construção de diversos anéis heterocíclicos G. Como um exemplo, a reação de um

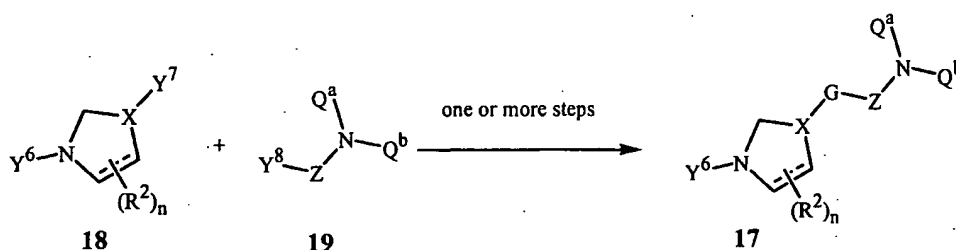
5 composto de Fórmula 18, em que Y^7 é um grupo tioamida, com um composto de Fórmula 19, em que Y^8 é um grupo bromoacetila, fornecerá um composto de Fórmula 17 em que G é um anel tiazol. A literatura sintética descreve muitos métodos gerais para a formação dos anéis heteroaromáticos de 5 membros e

10 anéis heterocíclicos parcialmente saturados de 5 membros (por exemplo, G-1 até G-55); vide, por exemplo, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 4 a 6, A. R. Katritzky and C. W. Rees editores, Pergamon Press, Nova Iorque, 1984; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, vol. 2 a 4, A. R. Katritzky, C. W. Rees, and E. F. Scriven editores, Pergamon Press, Nova Iorque, 1996; e as séries, *The Chemistry of Heterocyclic Compounds*, E. C. Taylor, editor, Wiley,

15 Nova Iorque. A utilização dos intermediários de Fórmula 18 em que X é X^1 e Y^7 é Br, I, metanosulfonato ou trifluorometanosulfonato para preparar os reagentes de organozinco para a utilização nas reações de ligação cruzada com anéis aromáticos, foi descrita; ver, por exemplo, por S. Bellotte, *Synlett* 1998, 379 – 380, e M. Nakamura et al., *Synlett* 2005, 1794 – 1798. Um técnico no assunto

20 sabe como selecionar os grupos funcionais apropriados para construir ou anexar os anéis heterocíclicos desejados, tais como G. Os compostos de Fórmula 18 e 19 são conhecidos ou podem ser preparados por uma ampla variedade de métodos gerais conhecidos no estado da técnica.

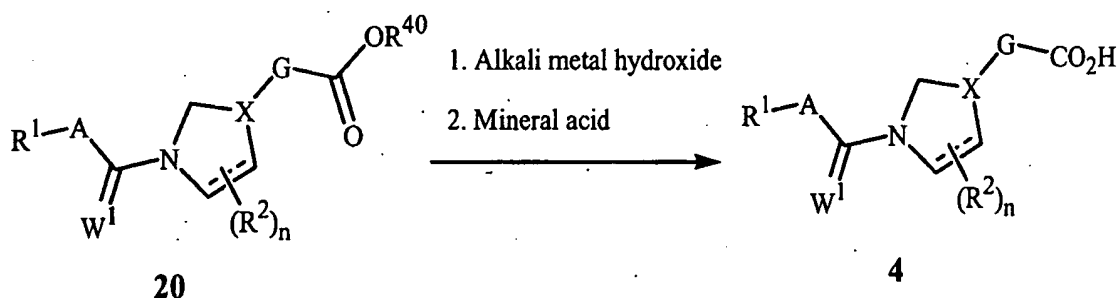
ESQUEMA 12



em que Y^6 onde é um grupo de proteção de amina e Y^7 e Y^8 são grupos funcionais adequados para a construção do heterociclo desejado G.

Os compostos ácidos de Fórmula 4 podem ser preparados por saponificação dos compostos de éster correspondente de Fórmula 20 utilizando um hidróxido de metal alcalino, tais como LiOH, NaOH ou KOH geralmente na presença de água, juntamente com um co-solvente, como o tetrahidrofurano e/ou o metanol para auxiliar na solubilidade do éster conforme ilustrado no Esquema 13. A reação é tipicamente realizada em 0 a 60° C, e o sal de carboxilato resultante é convertido no ácido livre pela adição de um leve excesso de um ácido mineral, tais como o ácido hidrocloreídrico ou o ácido sulfúrico.

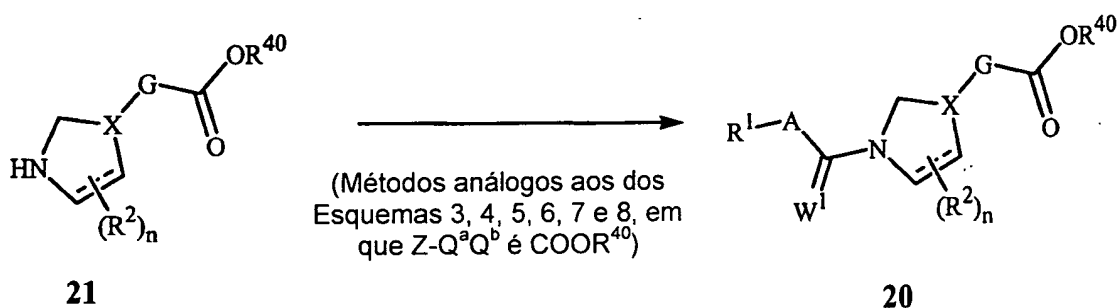
ESQUEMA 13



em que R^{40} é, por exemplo, alquila C_1 - C_4 .

Conforme esboçado no Esquema 14, os compostos de éster de Fórmula 20 podem ser preparados a partir dos compostos de amina de Fórmula 21 pelos métodos análogos aos acima descritos para a preparação dos compostos da Fórmula 1. Um técnico no assunto irá reconhecer que os métodos análogos aos dos Esquemas 3, 4, 5, 6, 7 e 8 em que o grupo COOR^{40} , onde R^{40} é, por exemplo, alquila C_1 - C_4 , é substituído pelo grupo $\text{Z-NQ}^a\text{Q}^b$, podem ser utilizados para fornecer os intermediários de Fórmula 20 úteis para a preparação dos compostos de Fórmula 1.

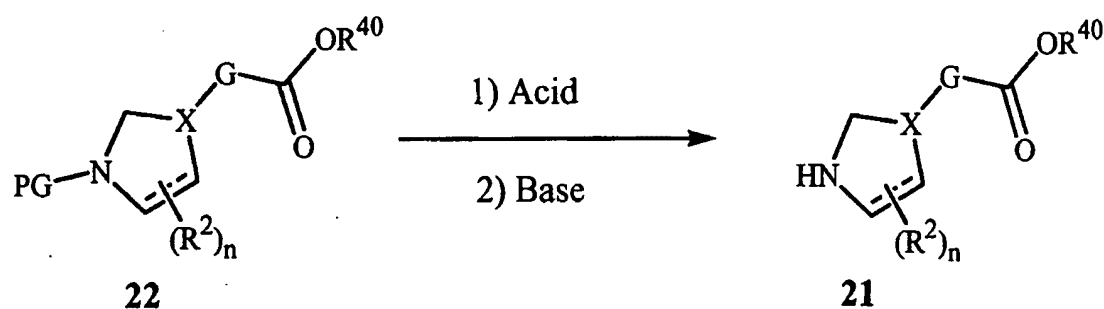
ESQUEMA 14



em que R⁴⁰ é, por exemplo, alquila C₁-C₄.

Os compostos de amina de Fórmula 21 podem ser preparados a partir dos compostos de amina protegida de Fórmula 22 em que PG é um grupo de proteção de amina ácido-lábil, tal como um grupo *t*-butoxicarbonila (t-Boc) ou um benziloxicarbonila (Cbz) conforme mostrado no Esquema 15. O grupo de proteção é removido por tratamento com um ácido, tal como o ácido trifluoroacético ou HCl gasoso na presença de um solvente, tal como o diclorometano ou o dioxano. A amina pode ser isolada como seu sal ácido ou convertida em uma etapa subsequente à amina livre pelo tratamento com uma base, tal conforme é conhecido pelo técnico no assunto.

ESQUEMA 15

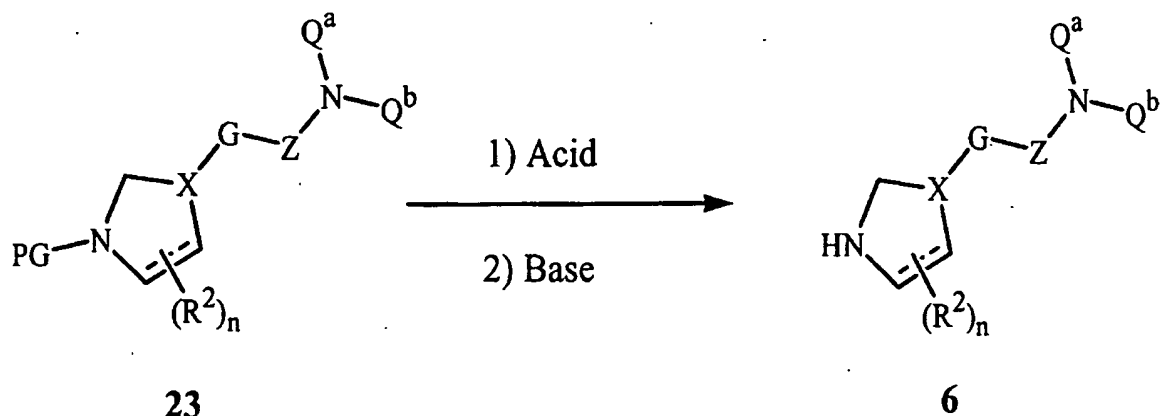


em que PG é um grupo de proteção ácido-lábil e R⁴⁰ é, por exemplo, alquila C₁-C₄.

As aminas de Fórmula 6 podem ser preparadas a partir das aminas protegidas de Fórmula 23 em que PG é um grupo de proteção de amina de ácido-lábil, tal como um grupo *t*-butoxicarbonila (t-Boc) ou um benziloxicarbonila (Cbz) conforme ilustrado no Esquema 16 pelos métodos análogos aos descritos acima para a preparação dos compostos de Fórmula

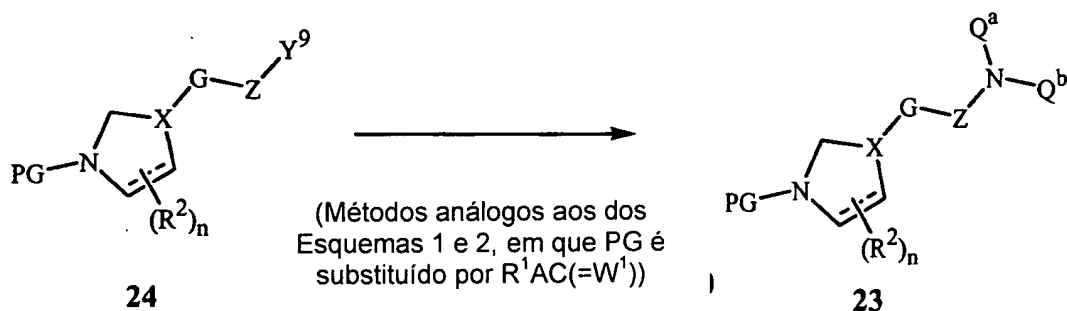
21, conforme esboçado no Esquema 15.

ESQUEMA 16



em que PG é um grupo de proteção ácido-lábil.

As aminas protegidas de Fórmula 23 podem ser preparadas a
 5 partir dos compostos de Fórmula 24 através dos métodos análogos aos
 descritos acima para a preparação dos compostos de Fórmula 1 conforme
 esboçado no Esquema 17. Um técnico no assunto irá reconhecer que nos
 Esquemas 1, 2, 8, 9 e 10, o grupo $\text{R}^1\text{AC}(=\text{W}^1)$ pode ser analogamente
 substituído por PG em que PG é um grupo de proteção de amina de ácido-
 10 lábil padrão, tal como um grupo *t*-butoxicarbonila (t-Boc) ou um
 benziloxicarbonila (Cbz) para fornecer intermediários úteis da Fórmula 23
 para a preparação dos compostos de Fórmula 1. Alguns compostos de
 Fórmula 24, em que Y^9 é OH e Z é C=O podem ser obtidos a partir dos
 compostos de Fórmula 22 por saponificação, análogo aos métodos
 15 descritos para o Esquema 13. Alguns outros compostos de Fórmula 24, em
 que Y^9 é OH e Z é CH_2 também podem ser obtidos a partir de compostos
 de Fórmula 22 de redução com LiBH_4 ou NaBH_4 conhecida pelo técnico no
 assunto. Os compostos de Fórmula 24, em que Y^9 é OH e Z é CH_2 , ainda
 podem ser transformados em compostos de Fórmula 24 em que Y^9 onde é
 20 Cl, Br, I, $\text{O}(\text{SO}_2)\text{Me}$ e Z é CH_2 pelos métodos gerais conhecidos no estado
 da técnica.

ESQUEMA 17

em que Y⁹ é Cl, Br, I, O(SO₂)Me ou OH; PG é um grupo de proteção ácido-lábil.

Os compostos de Fórmulas 22 e 24 podem ser preparados pelas metodologias conhecidas no estado da técnica da síntese química, incluindo os métodos análogos aos descritos com relação aos Esquemas 1 a 17. Além disso, um técnico no assunto irá reconhecer que muitos dos compostos de Fórmula 1 podem ser preparados diretamente pelos métodos análogos aos descritos no Esquema 12 acima onde o grupo Y⁶ é substituído por R¹AC(=W¹). Portanto, os compostos correspondentes à Fórmula 18 em que Y⁶ é substituído por R¹AC(=W¹) são intermediários úteis para a preparação dos compostos de Fórmula 1.

É reconhecido que alguns reagentes e condições de reação acima descritos para a preparação dos compostos de Fórmula 1 podem não ser compatíveis com algumas funcionalidades presentes nos intermediários. Nestes casos, a incorporação das seqüências proteção/ desproteção ou interconversões do grupo funcional na síntese irão auxiliar na obtenção dos produtos desejados. A utilização e a escolha dos grupos de proteção serão evidentes para um técnico no assunto da síntese química (vide, por exemplo, T. W. Greene and P. G. M. Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2^a ed.; Wiley: Nova Iorque, 1991). Um técnico no assunto irá reconhecer que, em alguns casos, após a introdução de um determinado reagente, tal como é retratado em qualquer esquema individual, poderá ser necessário realizar as

etapas sintéticas de rotina adicionais não descritas em detalhes para completar a síntese dos compostos da Fórmula 1. Um técnico no assunto também reconhece que poderá ser necessário realizar uma combinação das etapas ilustradas nos esquemas acima em uma ordem diferente da implícita pela seqüência particular apresentada para preparar os compostos de Fórmula 1.

Um técnico no assunto também reconhece que os compostos de Fórmula 1 e os intermediários descritos no presente podem ser submetidos a diversas reações eletrofílicas, nucleofílicas, de radicais, organometálicas, oxidação e redução para adicionar substituintes ou modificar os substituintes existentes.

Sem se aprofundar mais, acredita-se que um técnico no assunto utilizando o relatório descritivo anterior pode utilizar inteiramente a presente invenção. Os exemplos seguintes devem, portanto, ser interpretados como meramente ilustrativos, e não limitantes do relatório descritivo de forma alguma. As etapas nos seguintes exemplos 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 operação preparativa particular cujo procedimento é descrito em outros Exemplos ou Etapas. As percentagens estão em peso, exceto para as misturas dos solventes cromatográficos ou onde indicado em contrário. As partes e porcentagens das misturas dos solventes cromatográficos estão em volume, salvo indicação contrária. O espectro de ^1H NMR são relatados em ppm depois do t etrametilsilano; "s" significa singlete, "d" significa duplete, "t" significa triplete, "m" significa multiplete, "q" significa quadruplete, "br s" significa singlete amplo, "br m" significa multiplete amplo.

EXEMPLOS

EXEMPLO 1

**PREPARAÇÃO DO 1-[4-[4-[[METIL[(1R)-1,2,3,4-TETRAHIDRO-1-NAFTALENIL]AMINO]
METIL]-2-TIAZOLIL]-1-PIPERIDINIL]-2-[5-METIL-3-(TRIFLUOROMETIL)-1H-PIRAZOL-1-IL]**

ETANONA (COMPOSTO 1)

Etapa A: Preparação do 1,1-dimetiletil 4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato

Em uma suspensão de 1,1-dimetiletil 4-(aminotioxometil)-1-tetrahidropiridina-carboxilato (30 g, 123 mmol) em etanol (180 mL) arrefecida a 0° C em um banho de gelo, foi adicionada uma solução em gotas de etil bromopiruvato (15,7 mL, 125 mmol) em etanol (180 mL). O banho de gelo foi retirado e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante a noite. A trietilamina (30 mL) foi adicionada e a mistura foi concentrada sob pressão reduzida, diluída com acetato de etila, lavada com salmoura, seca em sulfato de magnésio e concentrada sob pressão reduzida para fornecer 31 g de um óleo marrom, que solidificou no repouso. Uma porção desse produto bruto (8,1 g) foi aquecida com éter (200 mL), e, em seguida, o éter foi decantado. Isso foi repetido uma segunda vez, e as soluções de éter combinadas foram evaporadas sob pressão reduzida, para fornecer 7,6 g do composto título como um sólido amarelo.

¹H NMR (CDCl₃) δ 1,40 (t, 3H), 1,46 (s, 9H), 1,7 (m, 2H), 2,1 (m, 2H), 2,85 (m, 2H), 3,25 (m, 1H), 4,2 (m, 2H), 4,42 (q, 2H), 8,08 (s, 1H).

Etapa B: Preparação da 1-(1,1-dimetiletil)4-[4-(hidroximetil)-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato

Uma mistura de 1,1-dimetiletil 4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato (isto é, o produto do Exemplo 1, Etapa A) (3,4 g, 10 mmol), borohidreto de lítio (0,33 g, 15 mmol) e metanol (607 µL, 15 mmol) em dietil éter (40 mL) foi aquecida em refluxo durante 16 h. A mistura da reação foi arrefecida, tratados com água (5 mL) e extraída com dietil éter e diclorometano. As camadas orgânicas combinadas foram secas (MgSO₄) e concentrada sob

pressão reduzida e purificadas por cromatografia de gel de sílica utilizando de 50 a 100% de acetato de etila em hexanos como eluente para fornecer 1,72 g do composto título como um sólido branco.

¹H NMR (CDCl₃) δ 1,45 (s, 9H), 1,66 – 1,78 (m, 2H), 2,04 – 2,12 (m, 2H), 2,45 – 2,53 (m, 1H), 2,80-2,94 (m, 2H), 3,10 – 3,20 (m, 1H), 4,12 – 4,30 (m, 2H), 4,75 (d, 2H), 7,073 (s, 1H).

Etapa C: Preparação da 1-(1,1-dimetiletil) 4-(4-clorometil-2-tiazolil)-1-piperidinacarboxilato

Uma solução de 1-(1,1-dimetiletil) 4-(4-hidroximetil-2-tiazolil)-1-piperidinacarboxilato (isto é, o produto do Exemplo 1, Etapa B) (0,83 g, 2,8 mmol) e trietilamina (836 µL, 6,0 mmol) em diclorometano (3 mL) foi resfriada a 0° C, e uma solução de cloreto de metanosulfonila (235 µL, 3,0 mmol) em diclorometano (2 mL) foi adicionada em gotas. A mistura da reação foi aquecida à temperatura ambiente, agitada por 2 h, diluída com diclorometano, lavada com ácido hidrocloreídrico a 1 N aquosa e salmoura, e secas (MgSO₄). As camadas orgânicas foram concentradas sob pressão reduzida e purificadas por cromatografia de gel de sílica com 25 a 50% de acetato de etila em hexanos como eluente para fornecer 0,20 g do composto como um sólido branco.

¹H NMR (CDCl₃) δ 1,45 (s, 9H), 1,65 – 1,77 (m, 2H), 2,05 – 2,12 (m, 2H), 3,12 – 3,20 (m, 1H), 4,17 – 4,24 (m, 2H), 4,65 (s, 2H), 7,20 (s, 1H).

Etapa D: Preparação do 1,1-dimetiletil 4-[4-[[metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil]amino]metil]-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato

Uma mistura de 1-(1,1-dimetiletil) 4-(4-clorometil-2-tiazolil)-1-piperidinacarboxilato (isto é, o produto do Exemplo 1, Etapa C) (0,15 g, 0,47 mmol), (1R)-1,2,3,4-tetrahidro-N-metil-1-naftalenamina (0,076 g, 0,47 mmol) e carbonato de potássio (0,072 g, 0,52 mmol) em acetonitrila seca (5 mL) foi aquecida em refluxo durante dois dias. Então, a mistura da reação foi filtrada,

concentrada sob pressão reduzida, diluída com diclorometano e lavada com ácido clorídrico aquoso a 1 N e água. As camadas orgânicas foram secas (MgSO_4) e concentradas sob pressão reduzida para fornecer 0,19 g do composto título como uma espuma amarronzada.

¹H NMR (CDCl_3) δ 1,47 (s, 9H), 1,58 – 1,78 (m, 4H), 1,98 – 2,12 (m, 4H), 2,31 (s, 3H), 2,70, 2,90 (m, 4H), 3,10 – 3,20 (m, 1H), 3,75 (s, 2H), 3,92 – 4,00 (m, 1H), 4,13 – 4,24 (br s, 2H), 7,03 – 7,21 (m, 4H), 7,90 (d, 1H).

Etapa E: Preparação do ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acético

Uma mistura de 3-metil-5-trifluorometilpirazol (10,0 g, 66,7 mmol), etil bromoacetato (11,1 mL, 100 mmol) e carbonato de potássio (18,4 g, 133 mmol), em N,N-dimetilformamida (80 mL) foi agitada à temperatura ambiente durante a noite. A mistura laranja foi filtrada, diluída com acetato de etila, lavada com água e salmoura, seca (MgSO_4) e concentrada sob pressão reduzida, para fornecer 15,7 g de pirazol éster. O éster dissolvido em tetrahidrofurano (100 mL) foi tratado com 11 mL de uma solução de NaOH aquosa a 50% em 90 mL de água, e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante a noite. O solvente de tetraidrofurano foi removido da mistura por evaporação sob pressão reduzida. A solução aquosa remanescente foi lavada com éter e, em seguida, acidificada com ácido hidrocloreídrico concentrado para reduzir o pH a 1, resultando na formação de um precipitado. O precipitado foi coletado na filtração, lavado com água e seco para fornecer 12,1 g do composto como um sólido branco.

¹H NMR (Acetona- d_6) δ 2,35 (s, 3H), 5,07 (s, 2H), 6,45 (s, 1H).

Etapa F: Preparação do cloreto de 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acetil

O ácido 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il] acético (7,58 g, 36,4 mmol) (isto é, o produto do Exemplo 1, Etapa E) foi dissolvido em diclorometano (100 mL). A N,N-dimetil-formamida (1 gota) foi adicionada na mistura de reação, que foi então resfriada a 0° C. o cloreto de oxalila

(3,5 mL, 40 mmol) foi adicionado em gotas na mistura de reação agitada, que foi, então, deixada para aquecer à temperatura ambiente por 3 h. A mistura resultante foi concentrada sob pressão reduzida e colocada sob alto vácuo para fornecer 7,93 g do composto como um sólido amarronzado.

5 Este composto era de pureza suficiente para se utilizar nas reações subsequentes.

^1H NMR (CDCl_3) δ 2,31 (s, 3H), 5,27 (s, 2H), 6,38 (s, 1H).

Etapa G: Preparação do 1-[4-[4-[[metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]amino]metil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]

10 *etanona*

Uma solução de 1,1-dimetiletil 4-[4-[[metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]amino]metil]-2-tiazolil]-1-piperidinacarboxilato (isto é, o produto do Exemplo 1, Etapa D) (0,19 g, 0,43 mmol) em metanol (5 mL) foi tratada com uma solução de cloreto de hidrogênio em dietil éter (2 M, 2,15 mL, 4,3 mmol). A

15 mistura da reação foi agitada à temperatura ambiente por 4 h, e, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante e a trietilamina (0,28 mL, 2,0 mmol) foram dissolvidos em diclorometano (10 mL), e a solução agitada foi arrefecida a 0° C. A esta solução foi adicionada em gotas uma

20 solução de cloreto de 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-acetila (ou seja, o produto do Exemplo 1, Etapa F) (113 mg, 0,50 mmol) em diclorometano (2 mL). A mistura de reação agitada foi aquecida até a temperatura ambiente por 2 h, e foi então diluída com diclorometano. A camada orgânica foi lavada com ácido clorídrico aquoso a 1 N, solução de bicarbonato de sódio aquosa saturada e salmoura, e seca (MgSO_4). As camadas orgânicas foram concentradas sob

25 pressão reduzida, para fornecer 0,16 g do produto título, um composto da presente invenção, tal como um óleo.

^1H NMR (CDCl_3) δ 1,60 – 1,80 (m, 4H), 2,00 – 2,10 (m, 2H), 2,12 – 2,23 (m, 2H), 2,29 (m, 3H), 2,63 – 2,90 (m, 3H), 3,20 – 3,34 (m, 2H), 3,75 –

3,80 (m, 2H), 3,91 – 4,03 (m, 2H), 4,52, 4,61 (d, 1H), 4,92 – 5,02 (m, 2H), 6,32 (s, 1H), 7,03 – 7,20 (m, 4H), 7,8 (d, 1H).

EXEMPLO 2

PREPARAÇÃO DO 4-[4-[[METIL(1,2,3,4-TETRAHIDRO-1-NAFTALENIL)AMINO]

5 CARBONILA]-2-TIAZOLIL]-A-[5-METIL-3-(TRIFLUOROMETIL)-1H-PIRAZOL-1-IL]-B-OXO-

L-PIPERIDINAPROPANOATO DE ETILA (COMPOSTO 6)

Etapa A: Preparação do monoclóridrato de 2-(4-piperidinil)-4-tiazolcarboxilato etila

Uma solução de 1,1-dimetiletil 4-[4-(etoxicarbonil)-2-tiazolil]-1-
 10 piperidina-carboxilato (11,1 g, 32,7 mmol) (isto é, o produto do Exemplo 1, Etapa A) em dietil éter (100 mL) a 0° C foi tratada com uma solução de cloreto de hidrogênio em dietil éter (2 M, 166 mL, 331 mmol). A mistura de reação foi então diluída com etanol absoluto (100 mL) e agitada durante a noite em temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada sob pressão
 15 reduzida e re-dissolvida em etanol e evaporado novamente para fornecer um sólido. O sólido resultante foi colocado sob um alto vácuo durante várias horas para fornecer 10,38 g do composto como um pó branco higroscópico. Este composto era de pureza suficiente para se utilizar em reações subsequentes.

20 ¹H NMR (DMSO-d₆) δ 1,30 (t, 3H), 1,9 (m, 2H), 2,2 (m, 2H), 3,0 (m, 2H), 3,35 (m, 2H), 3,4 (m, 1H), 4,3 (q, 2H), 8,9 – 9,3 (br m, 2H).

Etapa B: Preparação do etil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxilato

Uma solução de monoclóridrato de 2-(4-piperidinil)-4-
 25 tiazolcarboxilato etila (isto é, o produto do Exemplo 2, Etapa A) (10,38 g, 33,1 mmol) e trietilamina (23 mL, 165 mmol), em diclorometano (200 mL) foi adicionada a uma solução agitada de cloreto de 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il] acetila (isto é, o produto do Exemplo 1, Etapa F) (7,58 g, 36,4

mmol) em diclorometano (50 mL) a 0° C. A mistura de reação agitada foi deixada aquecer à temperatura ambiente durante a noite. Depois, a mistura de reação foi despejada em água, e a mistura foi extraída com diclorometano. A camada orgânica foi lavada com 1 N de ácido clorídrico, água, solução de bicarbonato de sódio aquosa saturada e salmoura, secas (MgSO₄) e filtrada. O filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para fornecer 13,0 g do composto como um óleo. Este composto era de pureza suficiente para se utilizar em reações subsequentes.

¹H NMR (CDCl₃) δ 1,4 (t, 3H), 1,78 (m, 2H), 2,2 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,80 (m, 1H), 3,25 (m, 1H), 3,36 (m, 1H), 4,07 (m, 1H), 4,42 (q, 2H), 4,62 (m, 1H), 4,98 (m, 2H), 6,34 (s, 1H), 8,09 (s, 1H).

Etapa C: Preparação do ácido 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxílico

Uma solução agitada de etil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxilato (13,0 g, 30,2 mmol) (ou seja, o produto do Exemplo 2, Etapa B) em metanol (60 mL) foi resfriada a 0° C e tratada com uma solução aquosa de hidróxido de sódio (1 N, 36,3 mL, 36,3 mmol). A mistura de reação agitada foi deixada aquecer à temperatura ambiente durante 5 h. A mistura de reação foi arrefecida novamente a 0° C e tratada com uma solução aquosa de ácido hidrocloreídrico (1 N, 36,3 mL, 36,3 mmol). O precipitado resultante foi coletado na filtração, lavado com água e seco em um forno a vácuo a 100° C para fornecer 10,95 g do composto título como um sólido branco.

¹H NMR (DMSO-d₆) δ 1,55 (m, 1H), 1,80 (m, 1H), 2,1 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,82 (m, 1H), 3,30 (m, 2H), 3,98 (m, 1H), 4,38 (m, 1H), 5,28 (m, 2H), 6,50 (s, 1H), 8,36 (s, 1H), 12,9 (br s, 1H).

Etapa D: Preparação do cloreto de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonil

Uma solução agitada de ácido 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarboxílico (2,55 g, 5,87 mmol) (isto é, o produto do Exemplo 2, Etapa C) em diclorometano (100 mL) foi resfriada a -10° C, e 1 gota de N,N-dimetil-formamida foi adicionada. Uma solução de cloreto de oxalila (0,60 mL, 6,8 mmol) em diclorometano (10 mL) foi adicionada em gotas na mistura de reação agitada. A mistura de reação foi agitada a -10° C por mais 30 minutos e, em seguida, foi deixada a aquecer até a temperatura ambiente e agitar um mais 16 h. A mistura homogênea resultante foi evaporada em vácuo, e o resíduo foi colocado sob alto vácuo durante várias horas para fornecer 2,46 g do composto título como um sólido amarelo claro. Este composto era de pureza suficiente para se utilizar nas reações subsequentes.

¹H NMR (CDCl₃) δ 1,80 (m, 2H), 2,2 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,88 (m, 1H), 3,36 (m, 2H), 4,10 (m, 1H), 4,60 (m, 1H), 4,99 (m, 2H), 6,34 (s, 1H), 8,39 (s, 1H).

Etapa E: Preparação do N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-4-tiazolcarboxamida

Em uma solução agitada de 1,2,3,4-tetrahidro-N-metil-1-naftalenamina (145 mg, 0,9 mmol) e trietilamina (0,16 mL, 1,13 mmol) em diclorometano (2 mL) a 0° C foi gradualmente acrescentado o cloreto de 2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolcarbonila (316 mg, 0,75 mmol) (ou seja, o produto de Exemplo 2, Etapa D). A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente por 16 horas e depois diluída com diclorometano (4 mL). A mistura foi lavada com água, ácido clorídrico 1 N, água, solução de bicarbonato de sódio aquosa saturada e salmoura, seca (MgSO₄) e filtrada. O filtrado foi concentrado em vácuo para fornecer o produto bruto, que foi purificado por cromatografia líquida de média pressão sobre sílica gel utilizando de 60 a 100% de acetato de etila em hexanos como eluente para fornecer 242 mg do composto título como a espuma branca.

^1H NMR (CDCl_3) δ 1,6 – 2,0 (m, 4H), 2,05 – 2,3 (m, 6H), 2,7 – 3,0 (m, 6H), 3,22 – 3,35 (m, 2H), 3,95 – 4,58 (m, 3H), 4,96 – 5,02 (m, 2H), 5,67 – 6,05 (m, 1H), 6,32 (s, 1H), 7,05 – 7,25 (m, 4H), 7,85 (m, 1H).

Etapa F: Preparação do 4-[4-[[metil(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)amino] carbonila]-2-tiazolil]- α -[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]- β -oxo-L-piperidinapropanoato de etila (Composto 6)

Em uma solução agitada de N-metil-2-[1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-N-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-4-thiazolcarboxamida (120 mg, 0,23 mmol) (ou seja, o produto do Exemplo 2, Etapa E) em tetrahidrofurano (5 mL) a -78°C , foi adicionada uma solução em diisopropilamida de lítio em tetrahidrofurano (0,5 M, 2,0 mL, 1 mmol). Após agitação a -78°C por 30 minutos, uma solução de cloroformato de etila (100 μL) em tetrahidrofurano (2 mL) foi adicionada. A mistura de reação foi agitada a -78°C durante mais 30 minutos e, em seguida, a 0°C durante 30 minutos. A mistura da reação foi arrefecida pela adição da solução de cloreto de amônio aquosa saturada e a mistura foi extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca (MgSO_4) e concentrada sob pressão reduzida, e o resíduo foi purificado por cromatografia líquida de média pressão utilizando de 75 a 100% de acetato de etil em hexanos como eluente para fornecer 4 mg do produto título, um composto da presente invenção.

Espectro de massa (AP^+) 618 ($\text{M}+1$).

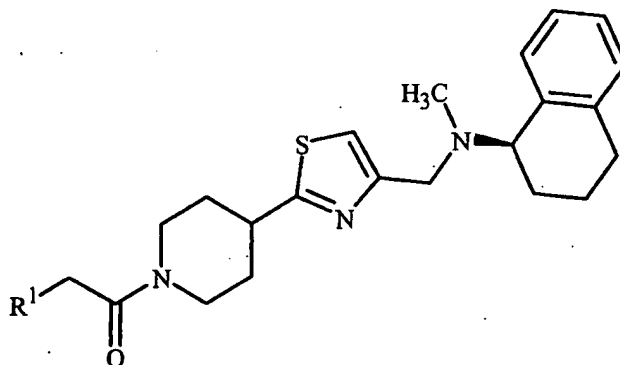
Pelos procedimentos descritos no presente, juntamente com os métodos conhecidos no estado da técnica, os seguintes compostos das Tabelas 1A a 5 podem ser preparados. As seguintes abreviaturas são utilizadas nas tabelas que se seguem: *t* significa terciário, *s* significa secundário, *n* significa normal, *i* significa iso, *c* significa ciclo, Ac significa acetil, Me significa metil, Et significa etil, Pr significa propil, *i*-Pr significa isopropil, *c*-Pr significa ciclopropil, Bu significa butil, Pen significa pentil, Hex significa hexil,

NC significa ciano, SO₂ significa S(O)₂. Um traço (-) indica que não há substituintes.

A presente invenção inclui, mas não está limitada, às espécies exemplares seguintes.

5

TABELA 1 A



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
fenil	2,5-diclorofenil
2-metilfenil	5-bromo-2-clorofenil
2-metoxifenil	2-cloro-5-iodofenil
2-clorofenil	2-cloro-5-metilfenil
2-bromofenil	2-cloro-5-etilfenil
2-etilfenil	2-cloro-5-propilfenil
2-etoxifenil	2-cloro-5-isopropilfenil
2-(metiltio)fenil	2-cloro-5-(trifluorometil)fenil
2-(etiltio)fenil	2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil
2-(trifluorometoxi)fenil	2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenil
3-clorofenil	2-cloro-5-cianofenil
3-bromofenil	2-cloro-5-nitrofenil
3-iodofenil	2-bromo-5-clorofenil
3-metilfenil	2,5-dibromofenil

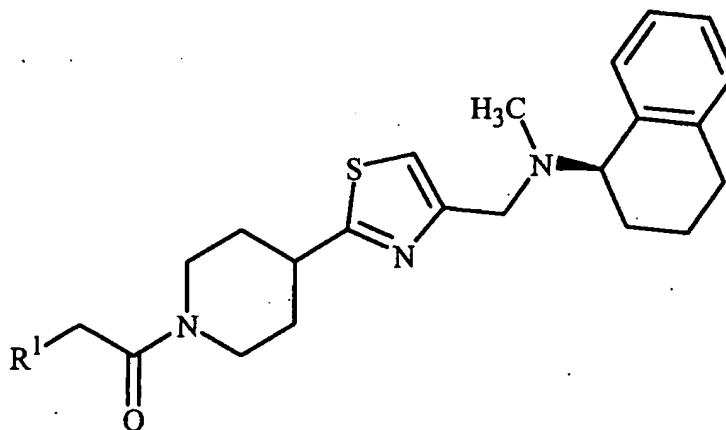
<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
3-etilfenil	2-bromo-5-iodofenil
3-propilfenil	2-bromo-5-metilfenil
3-isopropilfenil	2-bromo-5-etilfenil
3-(trifluorometil)fenil	2-bromo-5-propilfenil
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	2-bromo-5-isopropilfenil
3-(pentafluoroetil)fenil	2-bromo-5-(trifluorometil)fenil
3-cianofenil	2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil
3-nitrofenil	2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenil
2-bromo-5-cianofenil	2-etil-5-(trifluorometil)fenil
2-bromo-5-nitrofenil	2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil
5-cloro-2-metilfenil	2-etil-5-(pentafluoroetil)fenil
5-bromo-2-metilfenil	5-ciano-2-etilfenil
5-iodo-2-metilfenil	2-etil-5-nitrofenil
2,5-dimetilfenil	3-metilpirazol-1-il
5-etil-2-metilfenil	3-cloropirazol-1-il
2-metil-5-propilfenil	3-bromopirazol-1-il
5-isopropil-2-metilfenil	3-iodopirazol-1-il
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	3-etilpirazol-1-il
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	3-(trifluorometil)pirazol-1-il
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenil	3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il
5-ciano-2-metilfenil	3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il
2-metil-5-nitrofenil	3-cianopirazol-1-il
5-cloro-2-metoxifenil	3-nitropirazol-1-il

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-bromo-2-metoxifenil	3,5-dimetilpirazol-1-il
5-iodo-2-metoxifenil	3-cloro-5-metilpirazol-1-il
2-metoksi-5-metilfenil	3-bromo-5-metilpirazol-1-il
5-etil-2-metoxifenil	3-iodo-5-metilpirazol-1-il
2-metoksi-5-propilfenil	3-etil-5-metilpirazol-1-il
5-isopropil-2-metoxifenil	5-metil-3-propilpirazol-1-il
2-metoksi-5-(trifluorometil)fenil	3-isopropil-5-metilpirazol-1-il
2-metoksi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il
2-metoksi-5-(pentafluoroetil)fenil	5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il
5-ciano-2-metoxifenil	5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il
2-metoksi-5-nitrofenil	3-ciano-5-metilpirazol-1-il
5-cloro-2-etilfenil	5-metil-3-nitropirazol-1-il
5-bromo-2-etilfenil	5-cloro-3-metilpirazol-1-il
2-etil-5-iodofenil	3,5-dicloropirazol-1-il
2-etil-5-metilfenil	5-cloro-3-bromopirazol-1-il
2,5-dietilfenil	5-cloro-3-iodopirazol-1-il
2-etil-5-propilfenil	5-cloro-3-etilpirazol-1-il
2-etil-5-isopropilfenil	5-cloro-3-propilpirazol-1-il
5-cloro-3-isopropilpirazol-1-il	5-hexil-2-metilfenil
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	5-alil-2-metilfenil
5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il	2-metil-5-(4-metil-3-pentenil)fenil
5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il	2-metil-5-propargilfenil

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-cloro-3-cianopirazol-1-il	2-metil-5-(3-metilpropargil)fenil
5-cloro-3-nitropirazol-1-il	5-ciclopropil-2-metilfenil
5-bromo-3-metilpirazol-1-il	5-ciclohexil-2-metilfenil
5-bromo-3-cloropirazol-1-il	2-metil-5-(pentafluoroisopropil)fenil
3,5-dibromopirazol-1-il	5-(3,3-dicloro-2-propen-1-il)-2-metilfenil
5-bromo-3-iodopirazol-1-il	2-metil-5-(4,4,4-trifluoro-2-butin-1-il)fenil
5-bromo-3-etilpirazol-1-il	5-(2,2-diclorociclopropan-1-il)-2-metilfenil
5-bromo-3-propilpirazol-1-il	2-metil-5-(trifluorometoxi)fenil
5-bromo-3-isopropilpirazol-1-il	2-cloro-5-(isobutiltio)fenil
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-cloro-5-(etilsulfonil)fenil
5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il	2-cloro-5-(trifluorometiltio)fenil
5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il	2-cloro-5-(trifluorometilsulfonil)fenil
5-bromo-3-cianopirazol-1-il	2-cloro-5-(metilamino)fenil
5-bromo-3-nitropirazol-1-il	2-cloro-5-(tert-butilamino)fenil
5-metoxi-3-metilpirazol-1-il	2-cloro-5-(dimetilamino)fenil
3-cloro-5-metoxipirazol-1-il	2-cloro-5-(dietilamino)fenil
5-etil-3-metilpirazol-1-il	2-cloro-5-(ciclopropilamino)fenil
3-cloro-5-etilpirazol-1-il	3-(metoximetil)fenil

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
3-bromo-5-etilpirazol-1-il	2-cloro-5-(etoximetil)fenil
5-etil-3-iodopirazol-1-il	2-cloro-5-(hidroximetil)fenil
3,5-dietilpirazol-1-il	2-cloro-5-(metoxicarbonil)fenil
5-etil-3-propilpirazol-1-il	2-cloro-5-(etilcarbonil)fenil
5-etil-3-isopropilpirazol-1-il	2-cloro-5-(metilcarboniloxi)fenil
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-cloro-5-(metilaminocarbonil)fenil
5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il	2-cloro-5-(dimetilaminocarbonil)fenil
5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il	2-metil-5-(trimetilsilil)fenil
3-ciano-5-etilpirazol-1-il	3,5-dimetil-2-tienil
5-etil-3-nitropirazol-1-il	3,5-dicloro-2-tienil
5-butil-2-metilfenil	3,5-dimetil-2-furil
1-metil-2-pirrolil	1-metil-4-imidazolil
4-metil-2-trifluorometil-5-tiazolil	5-trifluorometil-3-(1,2,4-oxadiazolil)
4-trifluorometil-2-tiazolil	5-trifluorometil-3-(1,2,4-tiadiazolil)
4-trifluorometil-2-oxazolil	2-bromo-1-(1,3,4-triazolil)
4-metil-2-trifluorometil-5-oxazolil	5-trifluorometil-3-(1,2,4-triazolil)
4-bromo-5-isotiazolil	2-bromo-1-imidazolil
4-bromo-5-isoxazolil	3,6-dimetil-2-piridil
1-metil-5-pirazolil	2,5-dimetil-3-piridil
1-metil-5-imidazolil	2,5-dimetil-4-piridil
1-metil-4-trifluorometil-2-imidazolil	3,6-dicloro-2-piridil
4-metil-3-(1,3,4-triazolil)	2,5-dicloro-3-piridil
2-metil-3-(1,2,4-triazolil)	2,5-dicloro-4-piridil

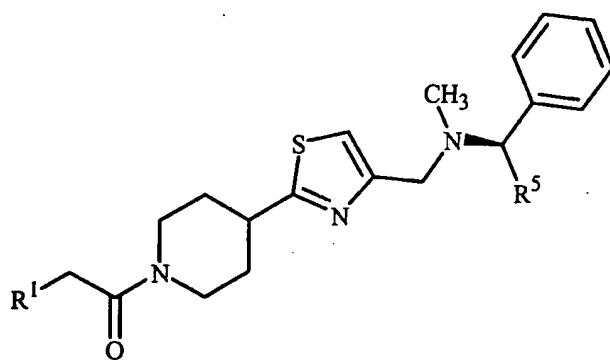
<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-trifluorometil-2-(1,3,4-tiadiazolil)	4-bromo-3-piridazinil
5-trifluorometil-2-(1,3,4-oxadiazolil)	4-trifluorometil-2-pirimidinil
3-fluorometil-5-(1,2,4-tiadiazolil)	3,6-dimetil-2-pirazinil
3-trifluorometil-5-(1,2,4-oxadiazolil)	2,5-dimetil-4-pirimidinil
3-trifluorometil-1-(1,2,4-triazolil)	4-metoxi-5-pirimidil
2,5-dimetil-1-pirrolil	3,6-dimetil-4-piridazinil
2,5-dimetil-3-furil	5-trifluorometil-3-(1,2,4-triazinil)
2,5-dimetil-3-tienil	5-metoxi-6-(1,2,4-triazinil)
2,5-dicloro-3-tienil	4-trifluorometil-2-(1,3,5-triazinil)
1,4-dimetil-3-pirrolil	3,6-dimetil-5-(1,2,4-triazilil)
1,4-dimetil-3-pirazolil	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il
1,3-dimetil-4-pirazolil	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-il
2,5-dimetil-4-oxazolil	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-il
2,5-dimetil-4-tiazolil	3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il
3-bromo-4-isotiazolil	3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il
3-bromo-4-isooxazolil	3-bromo-5-(trifluorometil)pirazol-1-il

TABELA 1 B

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-metoxifenil	2-bromo-5-(trifluorometil)fenil
3-bromofenil	2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil
3-iodofenil	2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenil
3-(trifluorometil)fenil	2-bromo-5-cianofenil
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	2-bromo-5-nitrofenil
3-(pentafluoroetil)fenil	5-cloro-2-metilfenil
3-cianofenil	5-bromo-2-metilfenil
3-nitrofenil	5-iodo-2-metilfenil
2,5-diclorofenil	2,5-dimetilfenil
5-bromo-2-clorofenil	5-etil-2-metilfenil
2-cloro-5-iodofenil	2-metil-5-propilfenil
2-cloro-5-metil-fenil	5-isopropil-2-metilfenil
2-cloro-5-etilfenil	2-metil-5-(trifluorometil)fenil
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	2-metil-5-(pentafluoroetil)fenil
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenil	5-ciano-2-metilfenil
2-cloro-5-cianofenil	2-metil-5-nitrofenil
2-cloro-5-nitrofenil	5-cloro-2-metoxifenil
2-bromo-5-clorofenil	5-bromo-2-metoxifenil
2,5-dibromofenil	5-iodo-2-metoxifenil
2-bromo-5-iodofenil	2-metoxi-5-metilfenil
2-bromo-5-metilfenil	5-etil-2-metoxifenil
2-bromo-5-etilfenil	2-metoxi-5-propilfenil
2-bromo-5-propilfenil	2-metoxi-5-(trifluorometil)fenil
2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	5-cloro-3-metilpirazol-1-il
2-metoxi-5-(pentafluoroetil)fenil	3,5-dicloropirazol-1-il

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-ciano-2-metoxifenil	5-cloro-3-bromopirazol-1-il
2-metoxi-5-nitrofenil	5-cloro-3-iodopirazol-1-il
5-cloro-2-etilfenil	5-cloro-3-etilpirazol-1-il
5-bromo-2-etilfenil	5-cloro-3-propilpirazol-1-il
2-etil-5-iodofenil	5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il
2-etil-5-metilfenil	5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il
2,5-dietilfenil	5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il
2-etil-5-propilfenil	5-cloro-3-cianopirazol-1-il
2-etil-5-(trifluorometil)fenil	5-cloro-3-nitropirazol-1-il
2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	5-bromo-3-metilpirazol-1-il
2-etil-5-(pentafluoroetil)fenil	5-bromo-3-cloropirazol-1-il
5-ciano-2-etilfenil	3,5-dibromopirazol-1-il
2-etil-5-nitrofenil	5-bromo-3-iodopirazol-1-il
3-cloropirazol-1-il	5-bromo-3-etilpirazol-1-il
3-bromo-pirazol-1-il	5-bromo-3-propilpirazol-1-il
3-(trifluorometil)pirazol-1-il	5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il	5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il	5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il
3-cianopirazol-1-il	5-etil-3-metilpirazol-1-il
3-nitropirazol-1-il	3-cloro-5-etilpirazol-1-il
3,5-dimetilpirazol-1-il	3-bromo-5-etilpirazol-1-il
3-cloro-5-metilpirazol-1-il	5-etil-3-iodopirazol-1-il
3-bromo-5-metilpirazol-1-il	3,5-dietilpirazol-1-il
3-iodo-5-metilpirazol-1-il	5-etil-3-propilpirazol-1-il
3-etil-5-metilpirazol-1-il	5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il
5-metil-3-propilpirazol-1-il	5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il

$\underline{R^1}$	$\underline{R^1}$
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il
5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il	3,5-dimetil-2-tienil
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il	3,5-dicloro-2-tienil
3-ciano-5-metilpirazol-1-il	2,5-dimetil-3-tienil
5-metil-3-nitropirazol-1-il	2,5-dicloro-3-tienil
3,6-dimetil-2-piridil	3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il
2,5-dimetil-3-piridil	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-il
2,5-dimetil-4-piridil	1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-il
3,6-dicloro-2-piridil	3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il
2,5-dicloro-3-piridil	3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il
2,5-dicloro-4-piridil	3-bromo-5-(trifluorometil)pirazol-1-il

TABELA 1 C

$\underline{R^1}$	$\underline{R^5}$
2-metoxifenil	Et
3-bromofenil	Et
3-iodofenil	Et
3-(trifluorometil)fenil	Et
3-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	Et
3-(pentafluoroetil)fenil	Et
3-cianofenil	Et

<u>R¹</u>	<u>R⁵</u>
3-nitrofenil	Et
2,5-diclorofenil	Et
5-bromo-2-clorofenil	Et
2-cloro-5-iodofenil	Et
2-cloro-5-metilfenil	Et
2-cloro-5-etilfenil	Et
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	Et
2-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	Et
2-cloro-5-(pentafluoroetil)fenil	Et
2-cloro-5-cianofenil	Et
2-cloro-5-nitrofenil	Et
2-bromo-5-clorofenil	Et
2,5-dibromofenil	Et
2-bromo-5-iodofenil	Et
2-bromo-5-metilfenil	Et
2-bromo-5-etilfenil	Et
2-bromo-5-propilfenil	Et
2-bromo-5-(trifluorometil)fenil	Et
2-bromo-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	Et
2-bromo-5-(pentafluoroetil)fenil	Et
2-bromo-5-cianofenil	Et
2-bromo-5-nitrofenil	Et
5-cloro-2-metilfenil	Et
5-bromo-2-metilfenil	Et
5-iodo-2-metilfenil	Et
2,5-dimetilfenil	Et

R^1	R^5
5-etil-2-metilfenil	Et
2-metil-5-propilfenil	Et
5-isopropil-2-metilfenil	Et
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	Et
2-metil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	Et
2-metil-5-(pentafluoroetil)fenil	Et
5-ciano-2-metilfenil	Et
2-metil-5-nitrofenil	Et
5-cloro-2-metoxifenil	Et
5-bromo-2-metoxifenil	Et
5-iodo-2-metoxifenil	Et
2-metoxi-5-metilfenil	Et
5-etil-2-metoxifenil	Et
2-metoxi-5-propilfenil	Et
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenil	Et
2-metoxi-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	Et
2-metoxi-5-pentafluoroetil)fenil	Et
5-ciano-2-metoxifenil	Et
2-metoxi-5-nitrofenil	Et
5-cloro-2-etilfenil	Et
5-bromo-2-etilfenil	Et
2-etil-5-iodofenil	Et
2-etil-5-metilfenil	Et
2,5-dietilfenil	Et
2-etil-5-propilfenil	Et
2-etil-5-(trifluorometil)fenil	Et

<u>R¹</u>	<u>R⁵</u>
2-etil-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil	Et
2-etil-5-(pentafluoroetil)fenil	Et
5-ciano-2-etilfenil	Et
2-etil-5-nitrofenil	Et
3-cloropirazol-1-il	Et
3-bromopirazol-1-il	Et
3-(trifluorometil)pirazol-1-il	Et
3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il	Et
3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il	Et
3-cianopirazol-1-il	Et
3-nitropirazol-1-il	Et
3,5-dimetilpirazol-1-il	Et
3-cloro-5-metilpirazol-1-il	Et
3-bromo-5-metilpirazol-1-il	Et
3-iodo-5-metilpirazol-1-il	Et
3-etil-5-metilpirazol-1-il	Et
5-metil-3-propilpirazol-1-il	Et
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	Et
5-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il	Et
5-metil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il	Et
3-ciano-5-metilpirazol-1-il	Et
5-metil-3-nitropirazol-1-il	Et
5-cloro-3-metilpirazol-1-il	Et
3,5-dicloropirazol-1-il	Et
5-cloro-3-bromopirazol-1-il	Et
5-cloro-3-iodopirazol-1-il	Et

<u>R¹</u>	<u>R⁵</u>
5-cloro-3-etilpirazol-1-il	Et
5-cloro-3-propilpirazol-1-il	Et
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	Et
5-cloro-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il	Et
5-cloro-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il	Et
5-cloro-3-cianopirazol-1-il	Et
5-cloro-3-nitropirazol-1-il	Et
5-bromo-3-metilpirazol-1-il	Et
5-bromo-3-cloropirazol-1-il	Et
3,5-dibromopirazol-1-il	Et
5-bromo-3-iodopirazol-1-il	Et
5-bromo-3-etilpirazol-1-il	Et
5-bromo-3-propilpirazol-1-il	Et
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	Et
5-bromo-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il	Et
5-bromo-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il	Et
5-etil-3-metilpirazol-1-il	Et
3-cloro-5-etilpirazol-1-il	Et
3-bromo-5-etilpirazol-1-il	Et
5-etil-3-iodopirazol-1-il	Et
3,5-dietilpirazol-1-il	Et
5-etil-3-propilpirazol-1-il	Et
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	Et
5-etil-3-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-1-il	Et
5-etil-3-(pentafluoroetil)pirazol-1-il	Et
3,5-dimetil-2-tienil	Et

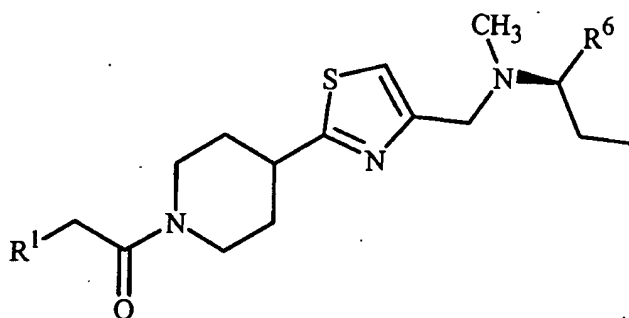
<u>R¹</u>	<u>R⁵</u>
3,5-dicloro-2-tienil	Et
2,5-dimetil-3-tienil	Et
2,5-dicloro-3-tienil	Et
3,6-dimetil-2-piridil	Et
2,5-dimetil-3-piridil	Et
2,5-dimetil-4-piridil	Et
3,6-dicloro-2-piridil	Et
2,5-dicloro-3-piridil	Et
2,5-dicloro-4-piridil	Et
2-metoxifenil	Me
2,5-diclorofenil	Me
5-bromo-2-clorofenil	Me
2-cloro-5-metilfenil	Me
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	Me
2,5-dibromofenil	Me
2-bromo-5-metilfenil	Me
2-bromo-5-(trifluorometil)fenil	Me
5-cloro-2-metilfenil	Me
5-bromo-2-metilfenil	Me
2,5-dimetilfenil	Me
5-etil-2-metilfenil	Me
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	Me
5-bromo-2-metoxifenil	Me
2-metoxi-5-metilfenil	Me
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenil	Me
3-(trifluorometil)pirazol-1-il	Me

<u>R¹</u>	<u>R⁵</u>
3,5-dimetilpirazol-1-il	Me
3-etil-5-metilpirazol-1-il	Me
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	Me
3,5-dicloropirazol-1-il	Me
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	Me
3,5-dibromopirazol-1-il	Me
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	Me
3,5-dietilpirazol-1-il	Me
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	Me
2-metoxifenil	<i>n</i> -Pr
2,5-diclorofenil	<i>n</i> -Pr
5-bromo-2-clorofenil	<i>n</i> -Pr
2-cloro-5-metilfenil	<i>n</i> -Pr
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	<i>n</i> -Pr
2,5-dibromofenil	<i>n</i> -Pr
2-bromo-5-metilfenil	<i>n</i> -Pr
2-bromo-5-(trifluorometil)fenil	<i>n</i> -Pr
5-cloro-2-metilfenil	<i>n</i> -Pr
5-bromo-2-metilfenil	<i>n</i> -Pr
2,5-dimetilfenil	<i>n</i> -Pr
5-etil-2-metilfenil	<i>n</i> -Pr
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	<i>n</i> -Pr
5-bromo-2-metoxifenil	<i>n</i> -Pr
2-metoksi-5-metilfenil	<i>n</i> -Pr
2-metoksi-5-(trifluorometil)fenil	<i>n</i> -Pr
3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>n</i> -Pr

<u>R¹</u>	<u>R⁵</u>
3,5-dimetilpirazol-1-il	<i>n</i> -Pr
3-etil-5-metilpirazol-1-il	<i>n</i> -Pr
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>n</i> -Pr
3,5-dicloropirazol-1-il	<i>n</i> -Pr
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>n</i> -Pr
3,5-dibromopirazol-1-il	<i>n</i> -Pr
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>n</i> -Pr
3,5-dietilpirazol-1-il	<i>n</i> -Pr
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>n</i> -Pr
2-metoxifenil	CN
2,5-diclorofenil	CN
5-bromo-2-clorofenil	CN
2-cloro-5-metilfenil	CN
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	CN
2,5-dibromofenil	CN
2-bromo-5-metilfenil	CN
2-bromo-5-(trifluorometil)fenil	CN
5-cloro-2-metilfenil	CN
5-bromo-2-metilfenil	CN
2,5-dimetilfenil	CN
5-etil-2-metilfenil	CN
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	CN
5-bromo-2-metoxifenil	CN
2-metoksi-5-metilfenil	CN
2-metoksi-5-(trifluorometil)fenil	CN
3-(trifluorometil)pirazol-1-il	CN

<u>R¹</u>	<u>R⁵</u>
3,5-dimetilpirazol-1-il	CN
3-etil-5-metilpirazol-1-il	CN
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	CN
3,5-dicloropirazol-1-il	CN
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	CN
3,5-dibromopirazol-1-il	CN
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	CN
3,5-dietilpirazol-1-il	CN
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	CN
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>i</i> -Pr
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>n</i> -Bu
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>i</i> -Bu
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>n</i> -Pen
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>n</i> -Hex
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	etenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	etinil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-metil-3-penten-1-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>c</i> -Pr
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>c</i> -Bu
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>c</i> -Pen
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	<i>c</i> -Hex
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	trifluorometil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2,2,2-trifluoroetil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	3,3-dicloro-2-propen-1-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	etinil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	propinil

<u>R¹</u>	<u>R⁵</u>
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	metiletinil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	trifluorometiletinil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2,2-diclorocicloprop-1-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	nitro
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	metoximetil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	metoxietil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-metoxietil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-metoxietil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	hidroximetil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	acetil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	isobutiril
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	metoxicarbonil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	etoxicarbonil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	metilaminocarbonil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	dimetilaminocarbonil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	trimetilsilil
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	Et
1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-il	Et
1-metil-4-(trifluorometil)imidazol-2-il	Et

TABELA 1 D

<u>R¹</u>	<u>R⁶</u>
2-metoxifenil	2-metilfenil
2,5-diclorofenil	2-metilfenil
5-bromo-2-clorofenil	2-metilfenil
2-cloro-5-metilfenil	2-metilfenil
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	2-metilfenil
2,5-dibromofenil	2-metilfenil
2-bromo-5-metilfenil	2-metilfenil
2-bromo-5-(trifluorometil)fenil	2-metilfenil
5-cloro-2-metilfenil	2-metilfenil
5-bromo-2-metilfenil	2-metilfenil
2,5-dimetilfenil	2-metilfenil
5-etil-2-metilfenil	2-metilfenil
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	2-metilfenil
5-bromo-2-metoxifenil	2-metilfenil
2-metoksi-5-metilfenil	2-metilfenil
2-metoksi-5-(trifluorometil)fenil	2-metilfenil
3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-metilfenil
3,5-dimetilpirazol-1-il	2-metilfenil
3-etil-5-metilpirazol-1-il	2-metilfenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-metilfenil
3,5-dicloropirazol-1-il	2-metilfenil
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-metilfenil
3,5-dibromopirazol-1-il	2-metilfenil
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-metilfenil
3,5-dietilpirazol-1-il	2-metilfenil
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-metilfenil

<u>R¹</u>	<u>R⁶</u>
2-metoxifenil	4-metilfenil
2,5-diclorofenil	4-metilfenil
5-bromo-2-clorofenil	4-metilfenil
2-cloro-5-metilfenil	4-metilfenil
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	4-metilfenil
2,5-dibromofenil	4-metilfenil
2-bromo-5-metilfenil	4-metilfenil
2-bromo-5-(trifluorometil)fenil	4-metilfenil
5-cloro-2-metilfenil	4-metilfenil
5-bromo-2-metilfenil	4-metilfenil
2,5-dimetilfenil	4-metilfenil
5-etil-2-metilfenil	4-metilfenil
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	4-metilfenil
5-bromo-2-metoxifenil	4-metilfenil
2-metoksi-5-metilfenil	4-metilfenil
2-metoksi-5-(trifluorometil)fenil	4-metilfenil
3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-metilfenil
3,5-dimetilpirazol-1-il	4-metilfenil
3-etil-5-metilpirazol-1-il	4-metilfenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-metilfenil
3,5-dicloropirazol-1-il	4-metilfenil
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-metilfenil
3,5-dibromopirazol-1-il	4-metilfenil
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-metilfenil
3,5-dietilpirazol-1-il	4-metilfenil
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-metilfenil

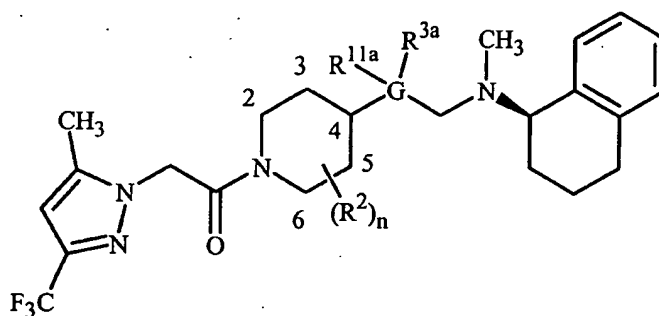
<u>R¹</u>	<u>R⁶</u>
2-metoxifenil	4-clorofenil
2,5-diclorofenil	4-clorofenil
5-bromo-2-clorofenil	4-clorofenil
2-cloro-5-metilfenil	4-clorofenil
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	4-clorofenil
2,5-dibromofenil	4-clorofenil
2-bromo-5-metilfenil	4-clorofenil
2-bromo-5-(trifluorometil)fenil	4-clorofenil
5-cloro-2-metilfenil	4-clorofenil
5-bromo-2-metilfenil	4-clorofenil
2,5-dimetilfenil	4-clorofenil
5-etil-2-metilfenil	4-clorofenil
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	4-clorofenil
5-bromo-2-metoxifenil	4-clorofenil
2-metoxi-5-metilfenil	4-clorofenil
2-metoxi-5-(trifluorometil)fenil	4-clorofenil
3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-clorofenil
3,5-dimetilpirazol-1-il	4-clorofenil
3-etil-5-metilpirazol-1-il	4-clorofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-clorofenil
3,5-dicloropirazol-1-il	4-clorofenil
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-clorofenil
3,5-dibromopirazol-1-il	4-clorofenil
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-clorofenil
3,5-dietilpirazol-1-il	4-clorofenil
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-clorofenil

R^1	R^6
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-etilfenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4- <i>t</i> -butilfenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-alilfenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-etinilfenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-ciclopropilfenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(trifluorometil)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(2-cloroetil)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-bromoetinilfenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(2,2-diclorocicloprop-1-il)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-fluorofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	3-fluorofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-fluorofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-clorofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-bromofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-hidroxifenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-aminofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-cianofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-nitrofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-metoxifenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(trifluorometoksi)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(metiltio)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazole-1-il	4-(metilsulfonil)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(metilsulfonil)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(trifluorometiltio)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(trifluorometilsulfonil)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(metilamino)fenil

<u>R¹</u>	<u>R⁶</u>
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(dimetilamino)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(ciclopropilamino)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-(metoximetil)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	3,4-(dimetoxi)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-acetilfenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(metoxicarbonil)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(acetiloxi)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(metilaminocarbonil)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(dimetilaminocarbonil)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-(trimetilsilil)fenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2,6-difluorofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2,4,6-trifluorofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2,3-dimetilfenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2,3-diclorofenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-naftalenil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-tienil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-furil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-metil-2-pirrolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	5-tiazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-oxazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-tiazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	5-oxazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	5-isotiazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	5-isoxazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-metil-5-pirazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-metil-5-imidazolil

<u>R¹</u>	<u>R⁶</u>
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-metil-2-imidazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-metil-1,2,4-triazolil-3-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-metil-1,2,4-triazolil-5-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1,3,4-oxadiazol-2-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1,3,4-tiadiazol-2-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1,2,4-oxadiazol-2-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1,2,4-tiadiazol-2-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	3-tienil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	3-furil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-metil-3-pirrolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-metil-3-pirazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-metil-4-pirazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-oxazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-tiazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-isotiazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-isoxazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-metil-4-imidazolil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1,2,4-oxadiazol-3-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1,2,4-tiadiazol-3-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1-metil-1,2,4-triazolil-3-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-piridil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	3,5-dicloro-2-piridil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	3-piridil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-piridil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	3-pirazinil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-pirimidinil

<u>R¹</u>	<u>R⁶</u>
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	2-pirimidinil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-pirimidinil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	5-pirimidinil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	4-pirazinil
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1,2,4-triazin-6-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1,2,4-triazin-3-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1,3,5-triazin-2-il
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	1,2,4-triazin-5-il

TABELA 2

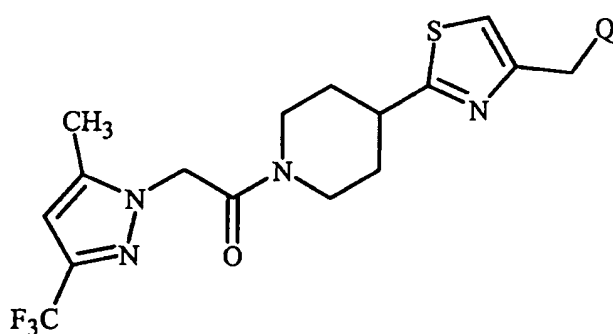
<u>(R²)_n</u>	<u>G</u>	<u>R^{3a}</u>	<u>R^{11a}</u>
-	G-1	H	-
-	G-2	H	-
-	G-3	H	H
-	G-4	H	-
-	G-5	H	-
-	G-6	H	H
-	G-7	-	-
-	G-8	-	-
-	G-9	-	H
-	G-10	H	-
-	G-11	H	-

$(R^2)_n$	<u>G</u>	R^{3a}	R^{11a}
-	G-12	H	H
-	G-13	H	H
-	G-14	H	-
-	G-15	H	-
-	G-16	H	H
-	G-17	H	-
-	G-18	H	-
-	G-19	-	H
-	G-20	-	-
-	G-21	-	-
-	G-22	H	H
-	G-23	H	-
-	G-24	H	-
-	G-25	H	-
-	G-26	H	-
-	G-27	H	-
-	G-28	H	-
-	G-29	H	-
-	G-30	H	-
-	G-31	H	-
-	G-32	H	-
-	G-33	H	-
-	G-34	H	-
-	G-35	H	-
-	G-36	H	-
-	G-37	H	-

$(R^2)_n$	<u>G</u>	<u>R^{3a}</u>	<u>R^{11a}</u>
-	G-38	H	-
-	G-39	H	H
-	G-40	H	-
-	G-41	H	-
-	G-42	H	H
-	G-43	H	H
-	G-44	H	-
-	G-45	H	-
-	G-46	-	-
-	G-47	-	-
-	G-48	-	H
-	G-49	H	-
-	G-50	H	-
-	G-51	H	H
-	G-52	H	-
-	G-53	H	-
-	G-54	H	H
-	G-55	-	-
-	G-2	Me	-
-	G-2	Cl	-
-	G-2	F	-
-	G-2	CF ₃	-
-	G-14	<i>n</i> -Pr	-
-	G-3	H	Me
-	G-3	H	<i>n</i> -Pr
-	G-26	5-Me	-

$\underline{(R^2)_n}$	$\underline{G}$	$\underline{R^{3a}}$	$\underline{R^{11a}}$
2-Me	G-1	H	-
3-Me	G-1	H	-
2,6-di-Me	G-1	H	-
3,5-di-Me	G-1	H	-
3- <i>n</i> -Bu	G-1	H	-
4-MeO	G-1	H	-
4-OH	G-1	H	-
4-Cl	G-1	H	-
4-Br	G-1	H	-
4-CN	G-1	H	-

TABELA 3



$\underline{Q}$	$\underline{Q^a}$	$\underline{R^5}$	$\underline{(R^8)_m}$	$\underline{(R^9)_i}$	$\underline{R^{10}}$	$\underline{R^{15}}$	$\underline{(R^{16})_m R^{16a}}$
Q-2	Me	-	H	-	-	H	-
Q-3	Me	-	H	-	-	H	-
Q-4	Me	-	H	-	-	H	-
Q-5	Me	-	H	-	H	H	-
Q-6	Me	-	H	-	-	H	-
Q-7	Me	-	H	-	-	H	-
Q-8	Me	-	H	-	-	H	-
Q-9	Me	-	H	-	-	H	-
Q-10	Me	-	H	-	-	H	-

<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R⁵</u>	<u>(R⁸)_m</u>	<u>(R⁹)_i</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R¹⁵</u>	<u>(R¹⁶)_mR^{16a}</u>
Q-11	Me	-	H	-	H	H	-
Q-12	Me	-	H	-	-	H	-
Q-13	Me	-	H	-	-	H	-
Q-14	Me	-	H	-	-	H	-
Q-15	Me	-	H	-	H	H	-
Q-2	Me	-	2-Me	-	-	H	-
Q-2	Me	-	2,2-di- Me	-	-	H	-
Q-2	Me	-	2-Et	-	-	H	-
Q-2	Me	-	H	6-Me	-	H	-
Q-2	Me	-	H	6-Cl	-	H	-
Q-2	Me	-	H	6-OMe	-	H	-
Q-2	Me	-	H	6-Br	-	H	-
Q-2	Me	-	H	6-F	-	H	-
Q-2	Me	-	H	5-OMe	-	H	-
Q-2	Me	-	H	7-Ome	-	H	-
Q-3	Me	-	3-Me	-	-	H	-
Q-4	Me	-	3-Me	-	-	H	-
Q-5	Me	-	H	-	Me	H	-
Q-5	Me	-	H	-	<i>n</i> -Pr	H	-
Q-6	Me	-	H	3-Cl	-	H	-
Q-7	Me	-	H	2-Cl	-	H	-
Q-8	Me	-	2-Me	-	-	H	-
Q-8	Me	-	2,2-di-Me	-	-	H	-
Q-8	Me	-	2-Et	-	-	H	-
Q-8	Me	-	2- <i>n</i> -Pr	-	-	H	-
Q-8	Me	-	3,3-di-Me	-	-	H	-

<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R⁵</u>	<u>(R⁸)_m</u>	<u>(R⁹)_i</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R¹⁵</u>	<u>(R¹⁶)_mR^{16a}</u>
Q-8	Me	-	H	5-Me	-	H	-
Q-8	Me	-	H	5-Cl	-	H	-
Q-8	Me	-	H	5-OMe	-	H	-
Q-8	Me	-	H	5-Br	-	H	-
Q-9	Me	-	2-Me	-	-	H	-
Q-10	Me	-	2-Me	-	-	H	-
Q-11	Me	-	H	-	Me	H	-
Q-13	Me	-	H	2-Me	-	H	-
Q-14	Me	-	H	2-Me	-	H	-
Q-14	Me	-	H	2-Cl	-	H	-
Q-15	Me	-	H	-	Me	H	-
Q-16	Me	-	H	-	-	H	-
Q-17	Me	-	H	-	-	H	-
Q-18	Me	-	H	-	Me	H	-
Q-19	Me	-	H	-	-	H	-
Q-20	Me	-	H	-	-	H	-
Q-21	Me	-	H	-	Me	H	-
Q-22	Me	-	H	-	-	H	-
Q-23	Me	-	H	-	-	H	-
Q-24	Me	-	H	-	-	H	-
Q-25	Me	-	H	-	-	H	-
Q-26	Me	-	H	-	-	H	-
Q-27	Me	-	H	-	-	H	-
Q-28	Me	-	H	-	-	H	-
Q-29	Me	-	H	-	-	H	-
Q-30	Me	-	H	-	-	H	-

<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R⁵</u>	<u>(R⁸)_m</u>	<u>(R⁹)_i</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R¹⁵</u>	<u>(R¹⁶)_mR^{16a}</u>
Q-31	Me	-	H	-	-	H	-
Q-32	Me	-	H	-	-	H	-
Q-33	Me	-	H	-	Me	H	-
Q-34	Me	-	H	-	-	H	-
Q-35	Me	-	H	-	-	H	-
Q-36	Me	-	H	-	Me	H	-
Q-37	Me	-	H	-	-	H	-
Q-38	Me	-	H	-	-	H	-
Q-39	Me	-	H	-	Me	H	-
Q-40	Me	-	H	-	-	H	-
Q-41	Me	-	H	-	-	H	-
Q-42	Me	-	H	-	-	H	-
Q-43	Me	-	H	-	-	H	-
Q-44	Me	-	H	-	-	H	-
Q-45	Me	-	H	-	-	H	-
Q-46	Me	-	H	-	-	H	-
Q-47	Me	-	H	-	-	H	-
Q-48	Me	-	H	-	-	H	-
Q-49	Me	-	H	-	-	H	-
Q-50	Me	-	H	-	-	H	-
Q-51	Me	-	H	-	-	H	-
Q-52	Me	-	H	-	-	H	-
Q-53	Me	-	H	-	-	H	-
Q-54	Me	-	H	-	-	H	-
Q-55	Me	-	H	-	-	H	-
Q-56	Me	-	H	-	-	H	-

<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R⁵</u>	<u>(R⁸)_m</u>	<u>(R⁹)_i</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R¹⁵</u>	<u>(R¹⁶)_mR^{16a}</u>
Q-57	Me	-	H	-	-	H	-
Q-58	-	-	H	-	-	H	-
Q-59	-	-	H	-	-	H	-
Q-60	-	-	H	-	-	H	-
Q-61	-	-	H	-	-	H	-
Q-62	-	-	H	-	-	H	-
Q-63	-	-	H	-	-	H	-
Q-64	-	-	H	-	-	H	-
Q-65	-	-	H	-	-	H	-
Q-66	-	-	H	-	-	H	-
Q-67	-	-	H	-	-	H	-
Q-68	-	-	H	-	-	H	-
Q-69	-	-	H	-	-	H	-
Q-70	-	Et	-	-	-	H	-
Q-71	-	Et	-	-	-	H	-
Q-72	-	Et	-	-	-	H	-
Q-73	Me	-	-	-	-	H	-
Q-74	Me	-	-	-	-	H	-
Q-75	Me	Me	-	-	-	Me	-
Q-76	-	-	-	-	-	-	3-Ph
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-Ph
Q-78	-	-	-	-	-	-	4-Ph
Q-79	-	-	-	-	-	-	-
Q-80	-	-	-	-	-	-	4-Ph
Q-81	-	-	-	-	-	-	1-Me
Q-82	-	-	-	-	-	-	-

<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R⁵</u>	<u>(R⁸)_m</u>	<u>(R⁹)_i</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R¹⁵</u>	<u>(R¹⁶)_mR^{16a}</u>
Q-83	Me	-	-	-	-	H	2-Ph
Q-84	Me	-	-	-	-	H	2-Ph
Q-85	Me	-	-	-	-	H	2-Ph
Q-2	Me	-	4-Me	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4,4-di-Me	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-Et	-	-	H	-
Q-2	Me	-	2-OH	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-OH	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-OMe	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-SMe	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-SOMe	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-SO ₂ Me	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-OCF ₃	-	-	H	-
Q-2	Me	-	2-CF ₃	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-NH ₂	-	-	H	-
Q-2	Me	-	2- <i>n</i> -Bu	-	-	H	-
Q-2	Me	-	2-propenil	-	-	H	-
Q-2	Me	-	2-propinil	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-Cl	-	-	H	-
Q-2	Me	-	2-CN	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-CN	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-O- <i>t</i> -Bu	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-NHMe	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-N(Me)Me	-	-	H	-
Q-2	Me	-	2-MeOMe	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-CH ₂ OH	-	-	H	-

<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R⁵</u>	<u>(R⁸)_m</u>	<u>(R⁹)_i</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R¹⁵</u>	<u>(R¹⁶)_mR^{16a}</u>
Q-2	Me	-	4-Ac	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-COOMe	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-OAc	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-O(C=O)- <i>n</i> -Bu	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-OEt	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-O(C=O)Et	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-SAc	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-CONHMe	-	-	H	-
Q-2	Me	-	4-CONMe ₂	-	-	H	-
Q-2	H	-	2-Me	-	-	H	-
Q-2	H	-	2,2-di-Me	-	-	H	-
Q-2	H	-	4-Me	-	-	H	-
Q-2	H	-	4,4-di-Me	-	-	H	-
Q-2	H	-	4-OH	-	-	H	-
Q-2	H	-	4-OMe	-	-	H	-
Q-2	H	-	4-OAc	-	-	H	-
Q-2	Me	-	2-Me	-	-	Me	-
Q-2	Me	-	2,2-di-Me	-	-	Me	-
Q-2	Me	-	4-Me	-	-	Me	-
Q-2	Me	-	4,4-di-Me	-	-	Me	-
Q-2	Me	-	4-OH	-	-	Me	-
Q-2	Me	-	4-OMe	-	-	Me	-
Q-2	Me	-	4-OAc	-	-	Me	-
Q-2	Et	-	H	-	-	H	-
Q-2	Pr	-	H	-	-	H	-
Q-2	2-propenil	-	H	-	-	H	-

<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R⁵</u>	<u>(R⁸)_m</u>	<u>(R⁹)_i</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R¹⁵</u>	<u>(R¹⁶)_mR^{16a}</u>
Q-2	2-propinil	-	H	-	-	H	-
Q-2	c-propil	-	H	-	-	H	-
Q-2	CF ₃	-	H	-	-	H	-
Q-2	CN	-	H	-	-	H	-
Q-2	OH	-	H	-	-	H	-
Q-2	OMe	-	H	-	-	H	-
Q-2	CH ₂ OMe	-	H	-	-	H	-
Q-2	CH ₂ OH	-	H	-	-	H	-
Q-2	Ac	-	H	-	-	H	-
Q-2	COEt	-	H	-	-	H	-
Q-2	CO ₂ Me	-	H	-	-	H	-
Q-2	CONHMe	-	H	-	-	H	-
Q-2	CON(Me) ₂	-	H	-	-	H	-
Q-8	Me	-	3-Me	-	-	H	-
Q-8	Me	-	3,3-di-Me	-	-	H	-
Q-8	Me	-	3-OH	-	-	H	-
Q-8	Me	-	3-OMe	-	-	H	-
Q-8	Me	-	3-OAc	-	-	H	-
Q-8	Me	-	2-Et	-	-	H	-
Q-8	H	-	H	-	-	H	-
Q-14	Me	-	2-Me	-	-	H	-
Q-14	Me	-	2,2-di-Me	-	-	H	-
Q-14	Me	-	3-Me	-	-	H	-
Q-14	Me	-	3,3-di-Me	-	-	H	-
Q-14	Me	-	3-OH	-	-	H	-
Q-14	Me	-	3-OMe	-	-	H	-

[illegible]

[illegible]

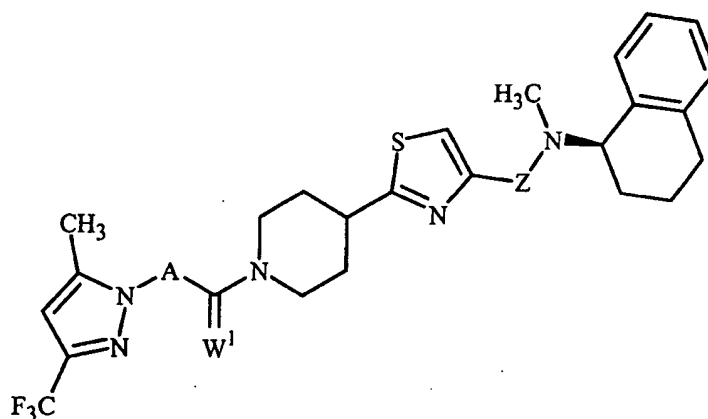
<u>Q</u>	<u>Q^a</u>	<u>R⁵</u>	<u>(R⁸)_m</u>	<u>(R⁹)_i</u>	<u>R¹⁰</u>	<u>R¹⁵</u>	<u>(R¹⁶)_mR^{16a}</u>
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-NHMe
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-N(Me) ₂
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-MeOMe
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-CO ₂ Me
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-OAc
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-CONHMe
Q-77	-	-	-	-	-	-	4-trimetilsilil
Q-77	-	-	-	-	-	-	3-Ph
Q-77	-	-	-	-	-	-	3-Me
Q-77	-	-	-	-	-	-	2-Ph
Q-75	Me	Et	-	-	-	Et	-
Q-75	Me	Et	-	-	-	Me	-
Q-75	Me	Me	-	-	-	<i>i</i> -Pr	-

Notas:

* As definições de R⁵, R¹⁰, R¹⁵, (R¹⁶)_m, R^{16a}, Q^a, (R⁸)_m e (R⁹)_i nos compostos da Tabela 3 são mostradas na Realização 50, salvo indicações em contrário.

5

TABELA 4

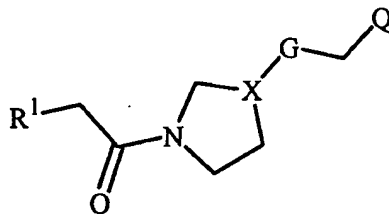


<u>A</u>	<u>W</u> ¹	<u>Z</u>
-CH ₂ -	S	-CH ₂ -
-NH-	S	-CH ₂ -
-NH-	O	-CH ₂ -
-CH ₂ -	O	-CH ₂ CH ₂ -
-CH ₂ -	O	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -
-CH ₂ -	O	-CH(Me)-
-CH ₂ -	O	-CH(Et)-
-CH ₂ -	O	-CH(CN)-
-CH ₂ -	O	-CH(<i>i</i> -Bu)-
-CH ₂ -	O	-CH(CF ₃)-
-CH ₂ -	O	-CHCL-
-CH ₂ -	O	-CH(C=CH)-
-CH ₂ -	O	-CH(CH=CH ₂)-
-CH ₂ -	O	-CH(OH)CH ₂ -
-CH ₂ -	O	-CH(OMe)-
-CH ₂ -	O	-CH(SMe)-
-CH ₂ -	O	-CH(S=OMe)-
-CH ₂ -	O	-CH(SO ₂ Me)-
-CH ₂ -	O	-CH(Ac)-
-CH ₂ -	O	-CHCO ₂ Me-
-CH ₂ -	O	-CHCONMe ₂ -
-CH ₂ -	O	-CH(OMe)CH ₂
-CH ₂ -	O	-CH(SO ₂ Me)CH ₂
-CH ₂ -	O	-CH ₂ C(CN) ₂
-CH ₂ CH ₂ -	O	-(C=O)-
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	O	-(C=O)-

<u>A</u>	<u>W</u> ¹	<u>Z</u>
-CH(Me)-	O	-(C=O)-
-CH(Et)-	O	-(C=O)-
-CH(CN)-	O	-(C=O)-
-CH(<i>i</i> -Bu)-	O	-(C=O)-
-CH(CF ₃)-	O	-(C=O)-
-CHCL-	O	-(C=O)-
-CH(C=CH)-	O	-(C=O)-
-CH(CH=CH ₂)-	O	-(C=O)-
-CH(OH)CH ₂ -	O	-(C=O)-
-CH(OMe)-	O	-(C=O)-
-CH(SMe)-	O	-(C=O)-
-CH(SOMe)-	O	-(C=O)-
-CH(SO ₂ Me)-	O	-(C=O)-
-CHAc-	O	-(C=O)-
-CH(CO ₂ Me)-	O	-(C=O)-
-CH(CONMe ₂)-	O	-(C=O)-
-CH(OMe)CH ₂	O	-(C=O)-
-CH(SO ₂ Me)CH ₂	O	-(C=O)-
-CH ₂ C(CN) ₂	O	-(C=O)-
-CH ₂ C(OH)-	O	-(C=O)-
-CH(CHO)-	O	-(C=O)-
-CH(CO ₂ Et)-	O	-(C=O)-
CH(CO ₂ - <i>n</i> -Pr)-	O	-(C=O)-
CH(CO ₂ - <i>i</i> -Pr)-	O	-(C=O)-
CH(CO ₂ - <i>n</i> -Bu)-	O	-(C=O)-
CH(CO ₂ - <i>i</i> -Bu)-	O	-(C=O)-

<u>A</u>	<u>W</u> ¹	<u>Z</u>
CH(CO ₂ - <i>t</i> -Bu)-	O	-(C=O)-
-C(Cl) ₂ -	O	-(C=O)-
-CH ₂ CH(Me)-	O	-(C=O)-
-CH(COCF ₃)-	O	-(C=O)-
-CH(CH ₂ OCH ₃)-	O	-(C=O)-
-CH(CH ₂ CO ₂ Me)-	O	-(C=O)-
-CH(CO ₂ Me)CH ₂ -	O	-(C=O)-
-CH(CONHMe)-	O	-(C=O)-
-N(Me)-	O	-(C=O)-
-N(Et)-	O	-(C=O)-
-N(CN)-	O	-(C=O)-
-N(OH)-	O	-(C=O)-
-N(CHO)-	O	-(C=O)-
-N(CH ₂ CH=CH ₂)-	O	-(C=O)-
-N(CH ₂ C=CH)-	O	-(C=O)-
-N(CH ₂ Cl)-	O	-(C=O)-
-N(CH ₂ OMe)-	O	-(C=O)-
-N(CH ₂ OEt)-	O	-(C=O)-
-N(CH ₂ OMe)-	O	-(C=O)-
-N(CH ₂ SMe)-	O	-(C=O)-
-NCH ₂ SOMe-	O	-(C=O)-
-N(CH ₂ SO ₂ Me)-	O	-(C=O)-
-N(Ac)-	O	-(C=O)-
-N(COCF ₃)-	O	-(C=O)-
-N(CO ₂ Me)-	O	-(C=O)-
-N(CONMe ₂)	O	-(C=O)-

<u>A</u>	<u>W</u> ¹	<u>Z</u>
-N(CH ₂ CH ₂ OMe)-	O	-(C=O)-
-N(SO ₂ Et)-	O	-(C=O)-
-N(CH ₂ CHMe ₂)-	O	-(C=O)-
-N(CO ₂ Et)-	O	-(C=O)-
-N(CO ₂ - <i>n</i> -Pr)-	O	-(C=O)-
-N(CO ₂ - <i>i</i> -Pr)-	O	-(C=O)-
-N(CO ₂ - <i>n</i> -Bu)-	O	-(C=O)-
-N(CO ₂ - <i>i</i> -Bu)-	O	-(C=O)-
-N(CO ₂ - <i>t</i> -Bu)-	O	-(C=O)-
-N(SOMe)-	O	-(C=O)-
-N(SO ₂ Me)-	O	-(C=O)-

TABELA 5

<u>R</u> ¹	<u>X</u> [*]	<u>G</u> ^{**}	<u>Q</u>
2,5-diclorofenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-cloro-5-(trifluorometil) fenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
3,5-dietilpirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-26	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
3,5-dietilpirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-27	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-36	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-diclorofenil	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenil	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ¹	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

R^1	X^*	G^{**}	Q
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenil	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^1	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X^2	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X^2	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-dimetilfenil	X^2	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X^2	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X^2	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-diclorofenil	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenil	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
3,5-dibromopirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenil	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino

R^1	X^*	G^{**}	Q
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^2	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^2	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^2	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-dimetilfenil	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-diclorofenil	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenil	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X^2	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetraidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenil	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ²	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-dimetilfenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
2,5-diclorofenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-diclorofenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-dimetilfenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-fenilpropilamino
2,5-diclorofenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-dimetilfenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

<u>R¹</u>	<u>X³</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
2,5-diclorofenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-cloro-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2,5-dimetilfenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
2-metil-5-(trifluorometil)fenil	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dimetilpirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dicloropirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-cloro-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dibromopirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-bromo-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-dietilpirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-etil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3,5-bis-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
3-metil-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino

<u>R¹</u>	<u>X[*]</u>	<u>G^{**}</u>	<u>Q</u>
3-cloro-5-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ³	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1-indanilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ⁴	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ⁵	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ⁶	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ⁷	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ⁸	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ⁴	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ⁵	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ⁶	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ⁷	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino
5-metil-3-(trifluorometil)pirazol-1-il	X ⁸	G-2	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -metil-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenilamino

Notas:

*n É 0.

**R³ é h.

FORMULAÇÃO/ UTILIDADE

Um composto da presente invenção será utilizado, em geral, como um ingrediente ativo fungicida em uma composição, isto é, formulação, com pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste em tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos, que servem
5 como um veículo. Os ingredientes da formulação ou da composição são selecionados como sendo consistentes com as propriedades físicas dos ingredientes ativos, modo de aplicação e fatores ambientais, tais como tipo de solo, umidade e temperatura.

As formulações úteis incluem ambas as composições líquidas e
10 sólidas. As composições líquidas incluem as soluções (incluindo concentrados emulsificáveis), suspensões, emulsões (incluindo microemulsões e/ou suspoemulsões) e similares, que podem ser opcionalmente espessadas em géis. Os tipos gerais de composições líquidas aquosas são o concentrado solúvel, concentrado de suspensão, suspensão em cápsula, emulsão
15 concentrada, microemulsão e suspo-emulsão. Os tipos gerais de composições líquidas não aquosas são o concentrado emulsificável, concentrado microemulsificável, concentrado dispersível e dispersão em óleo.

Os tipos gerais de composições sólidas são as poeiras, pós, grânulos, *pellets*, *prills*, pastilhas, tabletes, filmes preenchidos (*filled films*)
20 (incluindo os revestimentos de semente) e similares, que podem ser dispersíveis em água ("molháveis") ou hidrossolúveis. Os filmes e os revestimentos formados a partir das soluções formadoras de filme ou suspensões fluidas são particularmente úteis para o tratamento de semente. O ingrediente ativo pode ser (micro)encapsulado e ainda transformado em uma
25 suspensão ou uma formulação sólida; alternativamente toda a formulação do ingrediente ativo pode ser encapsulada (ou "recoberta"). O encapsulamento pode controlar ou retardar a liberação do ingrediente ativo. Um grânulo emulsificável combina as vantagens de ambas uma formulação concentrada

emulsificável e uma formulação granular seca. As composições de alta intensidade são principalmente utilizadas como intermediárias para formulação adicional.

As formulações pulverizáveis são tipicamente fornecidas em um meio apropriado antes da pulverização. Tais formulações líquidas e sólidas são formuladas para serem prontamente diluídas no meio de pulverização, geralmente, a água. Os volumes do spray podem variar de cerca de um a cerca de centenas de litros por hectare, mas tipicamente, estão no intervalo de cerca de 10 a cerca de diversas centenas litros por hectare. As formulações pulverizáveis podem ser misturadas em tanque com água ou outro meio apropriado para o tratamento foliar por aplicação aérea ou terrestre, ou para a aplicação no meio de crescimento do vegetal. As formulações líquidas ou secas podem ser medidas diretamente nos sistemas de irrigação por imersão ou medidas nos sulcos durante a plantação. As formulações líquidas e sólidas podem ser aplicadas em sementes vegetais como tratamento das sementes antes da plantação para proteger as raízes em desenvolvimento e outras partes do vegetal subterrâneo e/ou a folhagem através da absorção sistêmica.

As formulações deverão conter tipicamente quantidades eficazes de ingrediente ativo, diluente e tensoativo dentro dos seguintes intervalos aproximadas que somam até 100% em peso.

	% em peso		
	Ingrediente Ativo	Diluente	Tensoativo
Grânulos, tabletes e pós dispersíveis em água e hidrossolúveis	0,001 – 90	0 – 99,999	0 – 15
Dispersões oleosas, suspensões, emulsões, soluções (incluindo concentrados emulsificáveis)	1 – 50	40 – 99	0 – 50

	% em peso		
	Ingrediente Ativo	Diluyente	Tensoativo
Pós secos	1 – 25	70 – 99	0 – 5
Grânulos e <i>pellets</i>	0,001 – 99	5 – 99,999	0 – 15
Composições de Alta Intensidade	90 – 99	0 – 10	0 – 2

Os diluentes sólidos incluem, por exemplo, argilas tais como a bentonita, montmorilonita, atapulgita e caulim, gipsita, celulose, dióxido de titânio, óxido de zinco, amido, dextrina, açúcares (por exemplo, lactose, sacarose), sílica, talco, mica, terra diatomácea, uréia, carbonato de cálcio, 5 carbonato e bicarbonato de sódio e sulfato de sódio. Os diluentes sólidos típicos estão descritos em Watkins, et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carries*, 2ª Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Os diluentes líquidos incluem, por exemplo, a água, N,N-dimetilalcanamidas (por exemplo, N,N-dimetilformamida), limoneno, 10 sulfóxido de dimetila, N-alkilpirrolidonas (por exemplo, N-metilpirrolidona), etileno glicol, trietileno glicol, polipropileno glicol, dipropileno glicol, polipropileno glicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (por exemplo, óleos minerais branco, parafina normal, isoparafinas), alquilbenzenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de 15 glicerol, sorbitol, triactina, hidrocarbonetos aromáticos, desaromatizadores alifáticos, alquilbenzenos, alquilnaftalenos, cetonas, tais como a ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona e 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, acetatos, tais como o isoamil acetato, hexil acetato, heptil acetato, octil acetato, nonil acetato, tridecil acetato e isobornil acetato, outros ésteres, 20 tais como os ésteres de lactato alquilados, ésteres dibásicos e γ -butirolactona e alcoóis, que podem ser lineares, ramificados, saturados ou insaturados, tais como o metanol, etanol, n-propanol, álcool isopropílico, n-

butanol, álcool isobutílico, n-hexanol, 2-etilhexanol, n-octanol, decanol, álcool isodecílico, isooctadecanol, álcool cetílico, álcool laurílico, álcool tridecílico, álcool oleílico, ciclohexanol, álcool tetrahidrofurfurílico, álcool diacetona e álcool benzílico. Os diluentes líquidos também incluem os

5 gliceróis ésteres de ácidos graxos saturados e insaturados (tipicamente C₆-C₂₂), tais como sementes de vegetais e óleos de frutas (por exemplo, óleos de oliva, mamona, linhaça, gergelim, milho, amendoim, girassol, semente de uva, açafrão, caroço de algodão, soja, semente de colza, coco e palmiste), gorduras de fonte animal (por exemplo, sebo de carne bovina,

10 sebo de carne suína, banha de porco, óleo de fígado de bacalhau, óleo de peixe) e suas misturas. Os diluentes líquidos também incluem os ácidos graxos alquilados (por exemplo, metilado, etilado, butilado), em que os ácidos graxos podem ser obtidos pela hidrólise dos ésteres de glicerol a partir de fontes vegetais e animais, e pode ser purificado por destilação. Os

15 diluentes líquidos são descritos em Marsden, *Solvents Guide*, 2^a Ed., Interscience, New York, 1950.

As composições sólidas e líquidas da presente invenção incluem frequentemente um ou mais tensoativos. Os tensoativos podem ser classificados como não iônicos, aniônicos ou catiônicos. Os tensoativos não

20 iônicos úteis para a presente composição incluem, mas não estão limitados a: álcool alcoxilado, tal como álcool alcoxilado com base em alcoóis naturais e sintéticos (que podem ser ramificados ou lineares) e preparados a partir dos alcoóis e óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou suas misturas; etoxilados de amina, alcanolamidas e alcanolamidas etoxiladas;

25 triglicerídeos alcoxilados, tais como óleos de soja, mamona e de colza etoxilados; alcoxilados de alquilfenol, tais como os etoxilados de octilfenol, etoxilados de nonilfenol, etoxilados de dinonil fenol e etoxilados de dodecil fenol (preparado a partir dos fenóis e do óxido de etileno, óxido de propileno, óxido

de butileno ou suas misturas); polímeros em bloco preparados a partir do óxido de etileno ou óxido de propileno e polímeros em bloco reverso, onde os blocos terminais são preparados a partir do óxido de propileno; ácidos graxos etoxilados; ésteres graxos etoxilados e óleos; ésteres de metila etoxilados; 5 tristirilfenol etoxilados (incluindo aqueles preparados a partir do óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou suas misturas); ésteres de ácido graxo, ésteres de glicerol, derivados com base em lanolina, ésteres polietoxilados, tais como ésteres de ácido graxos de sorbitano polietoxilados, ésteres de ácido graxos de sorbitol polietoxilados e ésteres de ácido graxos de 10 glicerol polietoxilados, outros derivados de sorbitano, tais como ésteres de sorbitano; tensoativos poliméricos, tais como copolímeros aleatórios, copolímeros em bloco, resinas de PEG de alquila (polietileno glicol), polímeros do tipo enxertado ou em pente e polímeros do tipo estrela; polietileno glicóis (PEGs); ésteres de ácido graxo de polietileno glicol; tensoativos com base em 15 silicone; e derivados do açúcar, tais como os ésteres de sacarose, alquil poliglicosídeos e alquila polissacarídeos.

Os tensoativos aniônicos úteis incluem, mas não estão limitados a: ácidos sulfônicos de alquilarila e seus sais; álcool carboxilado ou etoxilados de alquilfenol; derivados de sulfonato de difenila; lignina e derivados de lignina, 20 tais como os lignosulfonatos; ácidos maléico ou succínico ou seus anidridos; sulfonatos de olefina; ésteres de fosfato, tais como os ésteres de fosfato dos alcoxilatos de álcool, ésteres de fosfato dos alcoxilatos de alquilfenol e ésteres de fosfato dos etoxilatos do estiril fenol; tensoativos com base em proteína; derivados de sarcosina; sulfato de estiril fenol éter; sulfatos e sulfonatos de 25 óleos e ácidos graxos; sulfatos e sulfonatos de alquilfenóis etoxilados; sulfatos de álcoois; sulfatos de álcoois etoxilados; sulfonatos de aminas e amidas, tais como o N,N-alquilaauratos; sulfonatos de benzeno, cumeno, tolueno, xileno, e dodecil e tridecilbenzenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos

de naftaleno e alquil naftaleno; sulfonatos de petróleo fracionado; sulfosuccinamatos; e sulfosuccinatos e seus derivados, tais como os sais de dialquil sulfosuccinato.

Os tensoativos catiônicos úteis incluem, mas não estão limitados a: amidas e amidas etoxiladas; aminas, tais como as N-alquil propanodiaminas, tripropilenotriaminas e dipropilenotetraminas, e aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas e aminas propoxiladas (preparadas a partir das aminas e do óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou suas misturas); sais de amina, tais como acetatos de amina e sais de diamina; sais de amônio quaternário, tais como os sais quaternários, sais quaternários etoxilados e sais diquaternário; e óxidos de amina, tais como os óxidos de alquildimetilamina e o óxido de bis-(2-hidroxietil)-alquilamina.

Também são úteis para a presente composição as misturas de tensoativos não iônicos e aniônicos ou as misturas de tensoativos não iônicos e catiônicos. Os tensoativos não iônicos, aniônicos e catiônicos e seus usos recomendados estão descritos 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., Nova Iorque, 1964; e A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, 7ª edição, John Wiley and Sons, Nova Iorque, 1987.

As composições da presente invenção também podem conter auxiliares da formulação e aditivos, conhecidos pelos técnicos no assunto como auxiliares de formulação. Tais auxiliares de formulação e aditivos podem controlar: pH (tampões), espumação durante o processamento (antiespumantes, tais como os poliorganosiloxanos (Rhodorsil® 416)), sedimentação dos ingredientes ativos (agentes de suspensão), viscosidade

(espessantes tixotrópicos), crescimento microbiano em recipiente (antimicrobianos), produto de congelamento (anticongelantes), cor (corantes/dispersões de pigmento (por exemplo, Prolzed® Corante Vermelho)), lavagem (formadores de filme ou aderentes), evaporação (retardantes da evaporação) e
5 outros atributos de formulação. Os formadores de filme incluem, por exemplo, os acetatos de polivinila, copolímeros de acetato de polivinila, copolímero de acetato de vinila – polivinilpirrolidona, alcoóis polivinílicos, copolímeros de álcool polivinílicos e ceras. Os exemplos de auxiliares de formulação e aditivos incluem aqueles listados em *McCutcheon 's Volume 2: Functional Materials*,
10 annual International and North American editions publicados por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; e o documento WO 03/024.222.

As soluções, incluindo os concentrados emulsificáveis, podem ser preparadas ao apenas misturar os ingredientes. Se o solvente de uma
15 composição líquida destinada para a utilização como um concentrado emulsificável for imiscível em água, um emulsificador é tipicamente adicionado para emulsificar o solvente contendo o ativo na diluição em água. As caldas do ingrediente ativo com diâmetros de partícula de até 2.000 µm podem ser moídas a úmido utilizando os moinhos de meio para obter partículas com
20 diâmetros médios inferiores a 3 µm. As caldas aquosas podem ser fabricadas em concentrados de suspensão acabados (vide, por exemplo, o documento US 3.060.084) ou ainda processados em secagem por *spray* para formar os grânulos dispersíveis em água. As formulações secas geralmente requerem processos de moagem a seco, que produzem diâmetros de partícula médio no
25 intervalo de 2 a 10 µm. Os pós secos e pós podem ser preparados pela mistura e geralmente moagem, tal como com em um moinho martelo ou um moinho de energia fluida. Os grânulos e os *pellets* podem ser preparados ao pulverizar o material ativo nos veículos granulares pré-formados ou pelas técnicas de

aglomeração. Vide Browning, *Agglomeration, Chemical Engineering*, 04 de dezembro de 1967, páginas 147 – 48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4ª Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, páginas 8 - 57 e as seguintes, e o documento WO 91/13546. Os *pellets* podem ser preparados tal conforme descrito na patente US 4.172.714. Os grânulos dispersíveis em água e hidrossolúveis podem ser preparados tal conforme ensinado nas patentes US 4.144.050, US 3.920.442 e DE 3.246.493. Os tabletes podem ser preparados tal conforme ensinado nas patentes US 5.180.587, US 5.232.701 e US 5.208.030. Os filmes podem ser preparados tal conforme ensinado nas patentes GB 2.095.558 e US 3.299.566.

Para maiores informações a respeito da técnica de formulação, vide T. S. Woods, *The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture* em *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, páginas 120 - 133. Vide também a patente US 3.235.361, da Coluna 6, linha 16 até a Coluna 7, linha 19 e os Exemplos 10 - 41; a patente US 3.309.192, da Coluna 5, linha 43 até a Coluna 7, linha 62 e os Exemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138 - 140, 162 - 164, 166, 167 e 169 - 182; a patente US 2.891.855, da Coluna 3, linha 66 até a Coluna 5, linha 17 e os Exemplos 1 - 4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, páginas 81 - 96; e Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; e *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, Reino Unido, 2000.

Nos exemplos a seguir, todas as porcentagens estão em peso e todas as formulações são preparadas de maneiras convencionais. Os números compostos se referem aos compostos na Tabela índice A.

EXEMPLO A

Concentrado de alta intensidade	
Composto 1	98,5%
Aerogel de sílica	0,5%
Sílica fina amorfa sintética	1,0%

EXEMPLO B

Pó Molhável	
Composto 2	65,0%
éter de dodecilfenol polietileno glicol	2,0%
sulfonato de lignina sódica	4,0%
silicoaluminato de sódio	6,0%
montmorilonita (calcinada)	23,0%

EXEMPLO C

Grânulo	
Composto 1	10,0%
Grânulos de atapulgita (baixo teor de matéria volátil, 0,71/ 0,30 mm; Crivos USS Nº 25 - 50)	90,0%

EXEMPLO D

Suspensão Aquosa	
Composto 3	25,0%
Hidrato de atapulgita	3,0%
ligninsulfonato de cálcio bruto	10,0%
Diidrogenofosfato de sódio	0,5%
Água	61,5%

EXEMPLO E

<i>Pellet Extrudado</i>	
Composto 6	25,0%
sulfato de sódio anidro	10,0%
ligninsulfonato de cálcio bruto	5,0%
alquilnaftalenossulfonato de sódio	1,0%
bentonita de cálcio/ magnésio	59,0%

EXEMPLO F

Microemulsão	
Composto 4	1,0%
Triacetina	30,0%
Alquilpoliglicosídeo C ₈ -C ₁₀	30,0%
Monooleato de glicerila	19,0%
Água	20,0%

EXEMPLO G

Concentrado Emulsificável	
Composto 1	10,0%
Éster de ácido graxo de metila C ₈ -C ₁₀	70,0%
Hexoleato de polioxietileno sorbitol	20,0%

Os compostos da presente invenção são úteis como agentes de controle da doença vegetal. Portanto, a presente invenção ainda compreende um método para o controle das doenças vegetais causadas por patógenos vegetais fúngicos que compreende a aplicação na planta ou em sua porção a ser protegida, ou na semente do vegetal a ser protegido, de uma quantidade eficaz de um composto da presente invenção ou de uma composição fungicida contendo dito composto. Os compostos e/ou composições da presente

invenção fornecem o controle das doenças causadas por um amplo espectro de patógenos vegetais fúngicos nas classes *Basidiomycete*, *Ascomycete*, *Oomycete* e *Deuteromycete*. Eles são eficazes no controle de um amplo espectro de doenças vegetais, particularmente os patógenos foliares das

5 culturas ornamentais, turfa, vegetal, de campo, cereal e fruta. Estes patógenos incluem: Oomycetes, incluindo as doenças *Phytophthora*, tais como a *Phytophthora infestans*, *Phytophthora megasperma*, *Phytophthora parasitica*, *Phytophthora cinnamomi* e *Phytophthora capsici*, doenças *Pythium*, tais como o *Pythium aphanidermatum* e as doenças na família *Peronosporaceae*, tais como

10 a *Plasmopara viticola*, *Peronospora* spp. (incluindo *Peronospora tabacina* e *Peronospora parasitica*), *Pseudoperonospora* spp. (incluindo *Pseudoperonospora cubensis*) e *Bremia lactucae*; Ascomycetes, incluindo as doenças *Alternaria*, tais como a *Alternaria solani* e a *Alternaria brassicae*, doenças *Guignardia*, tais como a *Guignardia bidwell*, doenças *Venturia*, tais

15 como a *Venturia inaequalis*, doenças *Septoria*, tais como a *Septoria nodorum* e a *Septoria tritici*, doenças do oídio pulverulento, tais como a *Erysiphe* spp. (incluindo a *Erysiphe graminis* e a *Erysiphe polygoni*), *Uncinula necatur*, *Sphaerotheca fuliginea* e *Podosphaera leucotricha*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, doenças *Botrytis*, tais como a *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, doenças da *Sclerotinia*, tais como a *Sclerotinia sclerotiorum*,

20 *Magnaporthe grisea*, *Phomopsis viticola*, doenças do *Helminthosporium*, tal como a *Helminthosporium tritici repentis*, *Pyrenophora teres*, doenças antracnose, tais como a *Glomerella* or *Colletotrichum* spp. (tais como a *Colletotrichum graminicola* e *Colletotrichum orbiculare*), e *Gaeumannomyces graminis*;

25 *Basidiomycetes*, incluindo as doenças da ferrugem causadas por *Puccinia* spp. (tais como *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia hordei*, *Puccinia graminis* e *Puccinia arachidis*), *Hemileia vastatrix* e *Phakopsora pachyrhizi*; outros patógenos incluindo a *Rhizoctonia* spp. (tais

como, *Rhizoctonia solani*); doenças Fusarium, tais como *Fusarium roseum*, *Fusarium graminearum* e *Fusarium oxysporum*; *Verticillium dahliae*; *Sclerotium rolfsii*; *Rhynchosporium secalis*; *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola* e *Cercospora beticola*; e outros gêneros e espécies intimamente relacionadas a estes patógenos. Em adição à sua atividade fungicida, as composições ou combinações também possuem atividade contra a bactéria, tais como *Erwinia amylovora*, *Xanthomonas campestris*, *Pseudomonas syringae*, e outras espécies relacionadas. É importante o controle fornecido pela doença causada pelas classes Ascomycete e Oomycete. É importante o controle fornecido pela doença causada pela classe Oomycete.

O controle da doença vegetal é geralmente realizado pela aplicação de uma quantidade eficaz de um composto da presente invenção pré ou pós-infecção, na porção do vegetal a ser protegido, tal como as raízes, caules, folhagem, fruta, semente, tubérculos ou bulbos, ou no meio (solo ou areia) em que as plantas a serem protegidas estão crescendo. Os compostos também podem ser aplicados nas sementes para proteger as sementes e as mudas em desenvolvimento a partir das sementes. Os compostos também podem ser aplicados através da água de irrigação para tratar os vegetais.

As taxas de aplicação para estes compostos podem ser influenciadas por muitos fatores do ambiente e devem ser determinadas sob as condições de uso real. As folhagens podem ser normalmente protegidas quando tratadas em uma taxa de menos de cerca de 1 g/há a cerca de 5.000 g/ha do ingrediente ativo. As sementes e mudas podem ser normalmente protegidas quando a semente é tratada em uma taxa de cerca de 0,1 a cerca de 10 g por Kg de semente.

Os compostos da presente invenção também podem ser misturados com um ou mais inseticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, reguladores do crescimento, quimioesterilizantes, semioquímicos,

repelentes, atrativos, feromônios, estimulantes de alimentação ou outros compostos biologicamente ativos para formar um pesticida de múltiplos componentes que resulta em um espectro ainda mais amplo de proteção agrônômica. Os exemplos de tais protetores agrícolas com os quais os

5 compostos da presente invenção podem ser formulados são: inseticidas, tais como a abamectina, acefato, acetamiprida, amidoflomet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfós-metila, bifentrina, bifenazato, buprofezina, carbofurano, cartap, clorantraniliprol (DPX-E2Y45), clorfenapir, clorfluazurona, clorpirifós, clorpirifós-metila, cromafenozida, clotianidina, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-

10 ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiurona, diazinona, dieldrina, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, enestroburina (SiP-Z071), esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronila, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim (UR-

15 50701), flufenoxurona, fonofós, halofenozida, hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, isofenfós, lufenurona, malationa, metaflumizona, metaldeído, metamidofós, metidationa, metomila, metopreno, metoxiclor, metoflutrina, monocrotofós, metoxifenoazida, nitenpiram, nitiazina, novaluron, noviflumuron (XDE-007), oxamila, parationa, parationa-metila, permetrina,

20 forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofós, proflutrina, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridilil, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rinaxipir, rianodina, spinetoram, spinosad, spirotetramat, spiromesifen (BSN 2060), spirotetramat, sulprofós, tebufenozida, teflubenzurona, teflutrina, terbufós, tetraclorvinfós, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sódio,

25 tralometrina, triazamato, triclorfon e triflumurona; fungicidas tais como a acibenzolar-S-metil, aldimorf, amisulbrom, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxil, benalaxil-M, benodanil, benomil, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropila, betoxazina, binapacril, bifenila, bitertanol, bixafeno, blastidicid-S,

mistura Bordeaux (sulfato de cobre tribásico), boscalida, bromuconazol, bupirinato, captafol, captano, carbendazim, carboxina, carpropamida, cloroneb, clorotalonila, clozolinato, clotrimazol, oxicleto de cobre, sais de cobre, tais como o sulfato de cobre e o hidróxido de cobre, ciazofamida, ciflufenamida,

5 cimoxanila, ciproconazol, ciprodinila, diclofluanida, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimetirimol, dimetomorf, dimoxistrobin, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, ditianona, dodemorf, dodina, edifenfós, enestroburina, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenexamida,

10 fenoxanila, fempiclonila, fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, cloreto de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonila, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, firusulfamida, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetil-alumínio, fuberidazol, furalaxil, furametpir, guazatina, hexaconazol, himexazol, imazalil,

15 imibenconazol, iminoctadina albesilato, triacetato de iminoctadina, iodocarb, ipconazol, iprobenfós, iprodiona, iprovalicarb, isoprotiolano, isotianila, kasugamicin, kresoxim-metil, mancozeb, mandipropamid, maneb, mepanipirim, mepronil, meptildinocap, metalaxil, metalaxil-M, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobin, metrafenona, miclobutanil, naftifina, neo-asozina

20 (metanoarsonato férrico), nuarimol, octilinona, ofurace, orisastrobin, oxadixil, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, oxitetraciclina, pefurazoato, penconazol, pencicuron, pentiopirad, ácido fosforoso e sais, ftalida, picoxistrobina, piperalina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, hidrocloreto de propamocarb, propiconazol, propineb,

25 proquinazid, protiocarb, protioconazol, pirazofós, piraclostrobin, piribencarb, piributicarb, pirifenox, pirimetanila, pirrolnitrina, piroquilon, quinometionato, quinoxifeno, quintozeno, siltiofam, simeconazol, spiroxamina, streptomicina, enxofre, tebuconazol, tecloftalam, tecnazeno, terbinafina, tetraconazol,

tiabendazol, tifulzamida, tiofanato, tiofanato-metila, tiram, tiadinila, tolclorfenil, tolclorfenil-metil, tolclorfenil, triadimefon, triadimenol, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, valifenal, vinclozolin, zineb, ziram, zoxamida, N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-[2-(1S,2R)-[1,1'-biciclopropil]-2-ilfenil]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, α -[metoxiimino]-N-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]-imino]metil]benzenoacetamida, 2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-ilideno]amino]oxi]metil]- α -(metoxiimino)-N-metilbenzenoacetamida, N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida, N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida, 2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)-fenil]tio]-2-[3-(2-metoxifenil)-2-tiazolidinilideno]acetonitrila, 2-butoxi-6-iodo-3-propil-4H-1-benzopiran-4-ona, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]-piridina, 4-fluorofenil-N-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]metil]propil]carbamato, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazol[1,5- α]pirimidina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metilbenzenosulfonamida, N-[[[ciclopropilmetoxi]amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metileno]benzenoacetamida, N'-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilmetanimidamida e 1-[(2-propeniltio)carbonila]-2-(1-metiletil)-4-(2-metilfenil)-5-amino-1H-pirazol-3-ona; nematocidas, tais como o aldicarb, imiciafós, oxamil e fenamifós; bactericidas, tais como a streptomomicina; acaricidas, tais como o amitraz, quinometionato, clorobenzilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridabeno e tebufenpirad; e os agentes biológicos incluindo a bactéria entomopatogênica, tal como o *Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*, *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*, e as delta-endotoxinas encapsuladas do *Bacillus thuringiensis* (por exemplo, Cellcap,

MPV, MPVII); fungo entomopatogênico, tal como, o fungo muscardine verde; e vírus entomopatogênico, incluindo o baculovírus, vírus nucleopoliédrico (NPV), tal como o HzNPV, AfNPV; e o vírus da granulose (GV), tal como o CpGV.

Os compostos da presente invenção e suas composições podem ser aplicadas aos vegetais geneticamente transformados para expressar as proteínas tóxicas nas pestes invertebradas (tais como as delta-endotoxinas do *Bacillus thuringiensis*). O efeito dos compostos fungicidas aplicados exogenamente da presente invenção pode ser sinérgico com as proteínas da toxina expressas.

As referências gerais para os protetores agrícolas (isto é, inseticidas, fungicidas, nematocidas, acaricidas, herbicidas e agentes biológicos) incluem o *The Pesticide Manual*, 13ª edição, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2003 e o *The BioPesticide Manual*, 2ª edição, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2001.

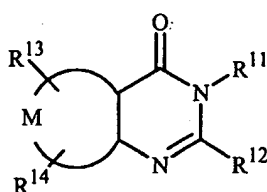
Para as realizações em que um ou mais destes diversos associados da mistura são utilizados, a proporção em peso destes diversos associados da mistura (no total) para o composto de Fórmula 1 está, tipicamente, entre cerca de 1:100 e cerca de 3.000:1. São importantes as proporções em peso entre cerca de 1:30 e cerca de 300:1 (por exemplo, as proporções entre cerca de 1:1 e cerca de 30:1). Será evidente que a inclusão destes componentes adicionais pode expandir o espectro de doenças controladas além do espectro controlado somente pelo composto de Fórmula 1.

Em uma realização da mistura, os grânulos de uma composição sólida que compreende um composto de Fórmula 1 são misturados com os grânulos de uma composição sólida que compreende outro protetor agrícola. Estas misturas de grânulos podem estar de acordo com a mistura dos grânulos geral descrito na patente WO 94/24861 ou, de maior preferência, a mistura de grânulo homogênea ensinada pela patente US 6.022.552.

São importantes as combinações (por exemplo, na forma de composições) de um composto de Fórmula 1, com pelo menos outro fungicida. São importantes tais combinações em que outro fungicida possui um sítio de ação diferente do composto de Fórmula 1. Em certos casos, as combinações com outros fungicidas que possui um espectro similar de controle, mas um sítio de ação diferente, será particularmente vantajoso para a administração da resistência. São importantes as composições em que, em adição ao composto de Fórmula 1 incluem pelo menos um composto selecionado a partir do composto que consiste em (1) fungicidas de alquilenobis(ditiocarbamato); (2) cimoxanila; (3) fungicidas de fenilamida; (4) fungicidas de pirimidinona; (5) clorotalonila; (6) carboxamidas agindo no complexo II do sítio de transferência de elétrons respiratório mitocondrial fúngico; (7) quinoxifeno; (8) metrafenona; (9) ciflufenamid; (10) ciprodinil; (11) compostos de cobre; (12) fungicidas de ftalimida; (13) fosetil-alumínio; (14) fungicidas de benzimidazol; (15) ciazofamid; (16) fluazinam; (17) iprovalicarb; (18) propamocarb; (19) validomicina; (20) fungicidas de dicarboximida de diclorofenila; (21) zoxamida; (22) fluopicolida; (23) mandipropamid; (24) amidas de ácido carboxílico agindo na biossíntese do fosfolípido e na deposição da parede celular; (25) dimetomorf; (26) inibidores da biossíntese de esterol de não DMI; (27) inibidores da demetilase na biossíntese de esterol; (28) fungicidas do complexo bc₁; e os sais dos compostos de (1) até (28).

As descrições adicionais das classes dos compostos fungicidas são fornecidas abaixo.

Os fungicidas de pirimidinona (grupo (4)) incluem os compostos de Fórmula A1



A1

em que M forma um anel de fenila fundido, tiofeno ou piridina; R¹¹ é alquila C₁-C₆; R¹² é alquila C₁-C₆ ou alcóxi C₁-C₆; R¹³ é halogênio; e R¹⁴ é hidrogênio ou halogênio.

Os fungicidas de pirimidinona são descritos no documento WO 94/26722 e nas patentes US 6.066.638, US 6.245.770, US 6.262.058 e US 6.277.858. São importantes os fungicidas de pirimidinona selecionados a partir do grupo: 6-bromo-3-propil-2-propilóxi-4(3H)-quinazolinona, 6,8-diiodo-3-propil-2-propilóxi-4(3H)-quinazolinona, 6-iodo-3-propil-2-propilóxi-4(3H)-quinazolinona (proquinazida), 6-cloro-2-propoxi-3-propil-tieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 7-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-d]pirimidin-4(3H)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propilpirido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 6,7-dibromo-2-propoxi-3-propil-tieno[3,2-d]pirimidin-4(3H)-ona, e 3-(ciclopropilmetil)-6-iodo-2-(propiltio)pirido-[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona.

Os inibidores da biossíntese do estero (grupo (27)) controlam os fungos por meio das enzimas de inibição na via da biossíntese do estero. Os fungicidas de inibição da demetilase possuem um sítio comum de ação dentro da via de biossíntese do estero fúngico, envolvendo a inibição de demetilação na posição 14 do lanosterol ou dihidrolanosterol 24-metileno, que são precursores para os esteróis nos fungos. Os compostos que agem neste local são freqüentemente referidos como inibidores da demetilase, fungicidas DMI ou DMIs. A enzima demetilase é, algumas vezes, referida por outros nomes na literatura bioquímica, incluindo o citocromo P-450 (14DM). A enzima demetilase é descrita, por exemplo, em *J. Biol. Chem.*, 1992, 267, 13175 – 79 e as referências citadas no mesmo. Os fungicidas DMI estão divididos em diversas classes químicas: azóis (incluindo os triazóis e os imidazóis), pirimidinas, piperazinas e piridinas. Os triazóis incluem o azaconazol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol (incluindo o diniconazol-M), epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol,

hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, penconazol, propiconazol, protioconazol, quinconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol e uniconazol. Os imidazóis incluem o clotrimazol, econazol, imazalil, isoconazol, miconazol, oxpoconazol, procloraz e triflumizol. As pirimidinas incluem o fenarimol, nuarimol e o triarimol. As piperazinas incluem a triforina. As piridinas incluem o butiobato e pirifenox. As investigações bioquímicas mostraram que todos os fungicidas mencionados acima são fungicidas DMI conforme descrito por K. H. Kuck et al., em *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205 – 258.

Os fungicidas do complexo bc_1 (grupo 28) possuem um mecanismo de ação que inibe o complexo bc_1 na cadeia de respiração mitocondrial. O complexo bc_1 é, referido algumas vezes por outros nomes na literatura bioquímica, incluindo o complexo III da cadeia de transferência de elétrons, e da ubihidroquinona: citocromo c oxiredutase. Este complexo é unicamente identificado pelo número da Comissão de Enzima (Enzyme Commission number) EC1.10.2.2. O complexo bc_1 é descrito, por exemplo, em *J. Biol. Chem.* 1989, 264, 14543-48; *Methods Enzymol.* 1986, 126, 253 – 71; e as referências citadas no mesmo. Os fungicidas de estrobilurina, tais como a azoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina (SYP-Z071), fluoxastrobina, kresoxim-metila, metominostrobrina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina e a trifloxistrobina são conhecidos por possuírem este mecanismo de ação (H. Sauter et al., *Angew. Chem. Int. Ed.*, 1999, 38, 1328-1349). Outros compostos fungicidas que inibem o complexo bc_1 na cadeia de respiração mitocondrial incluem a famoxadona e a fenamidona.

Os alquilenobis(ditiocarbamato)s (grupo (1)) incluem os compostos, tais como o mancozeb, maneb, propineb e zineb. As fenilamidas (grupo (3)) incluem os compostos, tais como metalaxil, benalaxil, furalaxil e

oxadixil. As carboxamidas (grupo (6)) incluem os compostos, tais como o boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanila, furametpir, mepronila, oxicarboxina, tifulzamida, pentiopirad e N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (patente WO 2003/010149), e são conhecidas por

5 inibirem a função mitocondrial ao interromper o complexo II (succinato desidrogenase) na cadeia respiratória de transporte de elétron. Os compostos de cobre (grupo (11)) incluem os compostos, tais como o oxicloreto de cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre, incluindo as composições, tais como a mistura Bordeaux (sulfato de cobre tribásico). As ftalimidas (grupo (12)) incluem

10 os compostos, tais como o folpet e o captan. Os fungicidas de benzimidazol (grupo (14)) incluem a benomila e a carbendazim. Os fungicidas de dicarboximida de diclorofenila (grupo (20)) incluem o clozolinato, diclozolina, iprodiona, isovalediona, miclozolina, procimidona e vinclozolina.

Os inibidores da biossíntese do esterol não DMI (grupo 26)

15 incluem os fungicidas de morfolina e piperidina. As morfolinas e as piperidinas são inibidores da biossíntese do esterol que mostrou inibir as etapas na via de biossíntese de esterol em um ponto posterior à inibição atingida pela biossíntese do esterol DMI (grupo (27)). As morfolinas incluem o aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf e trimorfamida. As piperidinas incluem a

20 fenpropidina.

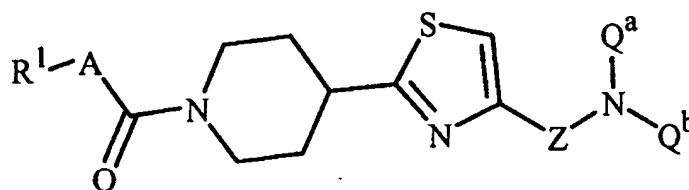
São importantes estes métodos em que as doenças vegetais causadas pelo patógeno vegetal fúngico Oomycete são controladas.

Os seguintes testes demonstram a eficácia do controle dos compostos da presente invenção em patógenos específicos. A proteção de

25 controle do patógeno conferida pelos compostos não se limita, no entanto, a estas espécies. Vide a Tabela Índice A para as descrições dos compostos. "Cmpd" é uma abreviatura de compostos. (R) ou (S) denota a quiralidade absoluta do centro do carbono assimétrico. A abreviatura "Ex" significa

“Exemplo” e é sucedido por um número que indica em que exemplo o composto é preparado. A Tabela Índice A enumera o peso molecular do maior íon precursor isotópico ($M + 1$) formado por adição de H^+ (peso molecular de 1) para a molécula, observada por espectrometria de massa utilizando ionização química a pressão atmosférica (AP^+).

ÍNDICE TABELA A



Cmp d	R ¹	A	Z	Q ^a	Q ^b	AP ⁺ (M+1)
1 (Ex.1)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-il	CH ₂	CH ₂	CH ₃	(1 <i>R</i>)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil	532
2	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-il	CH ₂	CH ₂	H	(1 <i>R</i>)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil	518
3	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-il	CH ₂	CH ₂	C(=O)CH ₃	(1 <i>R</i>)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil	560
4	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-il	CH ₂	CH ₂	CHO	(1 <i>R</i>)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil	546
5	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-il	CH ₂ CH ₂	C=O	CH ₃	(1 <i>R</i>)-1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil	560
6 (Ex.2)	3-trifluorometil-5-metilpirazol-1-il	CHCO ₂ Et	C=O	CH ₃	1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil	618

EXEMPLOS BIOLÓGICOS DA INVENÇÃO

Protocolo geral para a preparação das suspensões testes para os Testes AC: Os compostos teste foram primeiro dissolvidos em acetona, em uma quantidade equivalente a 3% do volume final e, então, suspensos na

concentração desejada (em ppm) em acetona e água purificada (50/50 mistura em volume) contendo 250 ppm do tensoativo Trem® 014 (ésteres de álcool polihídricos). As suspensões dos testes resultantes foram então utilizadas nos testes A – C. A pulverização de uma suspensão teste de 200 ppm no ponto de escoamento nos vegetais teste foi o equivalente a uma proporção de 500 g/ha.

TESTE A

Mudas de uva foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Plasmopara viticola* (o agente causador do míldio da uva) e incubadas em uma atmosfera saturada a 20° C por 24 h. Após um curto período de secagem, a suspensão teste foi pulverizada no ponto de escoamento sobre as mudas de uva, que foram então transferidas para uma câmara de crescimento, a 20° C, durante 5 dias, após cujo período, as mudas de uva foram repostos em uma atmosfera saturada a 20° C por 24 h. Após a remoção, foi realizada uma classificação visual da doença.

TESTE B

As suspensões teste foram pulverizadas no ponto de escoamento nas mudas de tomate. No dia seguinte, as mudas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Phytophthora infestans* (o agente causador da queima do tomate) e incubadas em uma atmosfera saturada a 20 ° C por 24 h, e em seguida transferidas para uma câmara de crescimento a 20° C por 5 dias, após o qual foi realizada uma classificação visual da doença.

TESTE C

Mudas de tomate foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Phytophthora infestans* (o agente causal da queima do tomate) e incubadas em uma atmosfera saturada a 20° C por 17 h. Após um curto período de secagem, a suspensão teste foi pulverizada no ponto de escoamento nas mudas de tomate, que foram então transferidas para uma câmara de crescimento a 20° C por 4 dias, após o qual, foi realizada uma

classificação visual da doença.

Em adição aos testes A-C, os compostos também foram pulverizados sobre tomateiro inoculados com *Botrytis cinerea* 24 h após o tratamento e três conjuntos distintos de plantas de trigo inoculadas com *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, *Puccinia recondita* ou *Septoria nodorum*, 24 h após o tratamento. Os compostos teste não mostraram atividade notável contra esses patógenos adicionais nas condições de teste, nas taxas de aplicação testadas.

Os resultados para os Testes de A a C são dados na Tabela A.

Na tabela, a classificação de 100 indica 100% de controle da doença e uma classificação de 0 indica nenhum controle da doença (com relação aos controles). Um traço (-) indica nenhum resultado do teste.

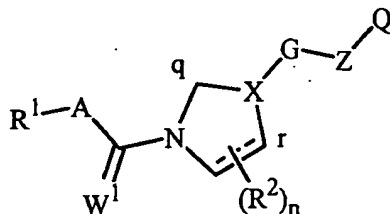
TABELA A

Cmpd No	Test A	Test B	Test C
1	72	100	99
2	28	100	93
3	55	85	53
4	0	87	26
5*	17	57	0
6*	72	17	0

*indica o composto testado a 40 ppm.

REIVINDICAÇÕES

1. COMPOSTO DE FÓRMULA 1, um N-óxido e seus sais,



1

em que:

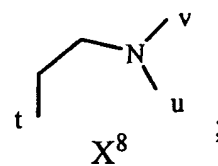
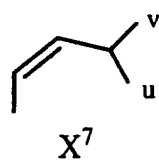
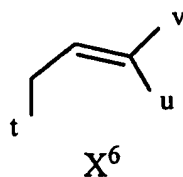
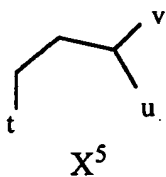
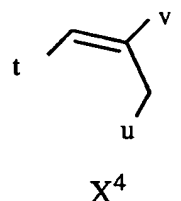
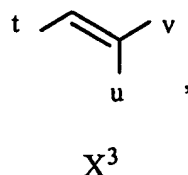
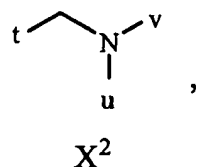
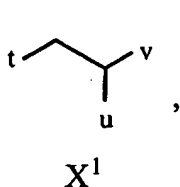
- R¹ é uma fenila ou um anel heteroaromático de 5 ou 6 membros

5 opcionalmente substituídos;

- A é NR¹⁸ ou alquilenos C₁-C₃ opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes independentemente selecionados a partir de R¹⁷;

- W¹ é O ou S;

- X é um radical selecionado a partir de:



10 - em que a ligação de X que é identificada com a letra "t" está ligada ao átomo de carbono identificado por "q" de Fórmula 1, a ligação que é identificada com "u" está ligada ao átomo de carbono identificado por "r" de Fórmula 1, bem como a ligação que é identificada por "v" está ligada a G;

15 - cada R² é independente alquila C₁-C₄, alquenila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, halogênio, ciano ou hidróxi;

- n é 0, 1 ou 2, ou

- dois R^2 são empregados em conjunto como alquilenos C_1-C_3 ou alquenilenos C_2-C_3 para formar um sistema de anéis bicíclico em ponte, ou

- dois R^2 apenas aos átomos de carbono adjacentes do anel unidos por uma ligação dupla são empregados em conjunto como $-CH=CH-$
 5 $CH=CH-$ opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes selecionados a partir de alquila C_1-C_4 , haloalquila C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , halogênio, hidróxi, aminoácidos, ciano e nitro;

- G é um anel heteroaromático de 5 membros opcionalmente substituído ou um anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado de 5
 10 membros;

- Z é $C=W^2$ ou alquilenos C_1-C_3 opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes independentemente selecionados a partir de R^{19} ;

- W^2 é O ou S;

- Q é $-NQ^aQ^b$;

15 - Q^a é H, $-CHO$, alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , ciano, hidróxi, alcóxi C_1-C_3 , alcoxialquila C_2-C_3 , hidroxialquila C_1-C_3 , alquilcarbonila C_2-C_3 , alcoxycarbonila C_2-C_3 , alquilaminocarbonila C_2-C_3 ou dialquilaminocarbonila C_3-C_5 ;

20 - Q^b é um sistema de anel bicíclico saturado ou parcialmente saturado de 8 a 11 membros opcionalmente substituídos ou um sistema de anéis tricíclicos parcialmente saturado de 10 a 15 membros opcionalmente substituídos, cada sistema de anel contendo opcionalmente de 1 a 3 heteroátomos selecionados de até 1 O, até 1 S e até 3 N, e, opcionalmente,
 25 incluindo de 1 a 3 membros do anel selecionados a partir do grupo constituído em $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$ ou $S(F)_2$; ou

- Q^b é $CR^5R^6R^{15}$; ou

- Q^a e Q^b são empregados em conjunto com o átomo de

nitrogênio ao qual estão ligados de modo a formar um anel heterocíclico saturado ou parcialmente saturado de 5 a 7 membros opcionalmente substituídos;

- R^5 é H, alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 ,
 5 cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} ,
 alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 ,
 haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , ciano, nitro, alcoxialquila C_2-C_4 ,
 hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 ,
 alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialquilsilila C_3-C_6 ;

10 - R^6 é um anel heteroaromático de 5 ou 6 membros
 opcionalmente substituído por fenila, benzila, naftalenila, cicloalquila C_3-C_6 ,
 cicloalquenila C_3-C_6 ; e

- R^{15} é H, alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_2-C_4 ,
 cicloalquila C_3-C_4 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} ,
 15 alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 ,
 haloalquinila C_2-C_4 , halocicloalquila C_3-C_4 ou alcoxialquila C_2-C_4 ; ou

- Q^a e R^5 são empregados em conjunto com os átomos que os
 conectam para formar um anel de 5 a 7 membros opcionalmente substituído
 contendo como membros do anel de 2 a 7 átomos de carbono e,
 20 opcionalmente, de 1 a 3 heteroátomos selecionados a partir de até 1 O, até 1 S
 e até 2 N; ou

- Q^a e R^6 são empregados em conjunto com os átomos que os
 conectam para formar um anel de 5 a 7 membros opcionalmente substituído
 contendo como membros do anel de 2 a 7 átomos de carbono e,
 25 opcionalmente, de 1 a 3 heteroátomos selecionados de até 1 O, até 1 S e até 2
 N; ou

- R^5 e R^{15} são empregados em conjunto com o átomo de carbono
 ao qual estão ligados de modo a formar um anel de 5 a 7 membros

opcionalmente substituído contendo como membros do anel de 2 a 7 átomos de carbono e, opcionalmente, de 1 a 3 heteroátomos selecionados de até 1 O, até 1 S, e até 1 N; ou

- R⁵ e R⁶ são empregados em conjunto com o átomo de carbono ao qual estão ligados de modo a formar um anel de 5 a 7 membros opcionalmente substituído contendo como membros do anel de 2 a 7 átomos de carbono e, opcionalmente, de 1 a 3 heteroátomos selecionados de até 1 O, até 1 S e até 1 N;

- R¹⁷ é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, haloalquil C₂-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄, alcoxialquila C₂-C₄, alquiltioalquila C₂-C₄, alquilsulfinilalquila C₂-C₄, alquilsulfonilalquila C₂-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, haloalquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₅, alcoxicarbonilalquila C₃-C₅, alquilaminocarbonila C₂-C₅, dialquilaminocarbonila C₃-C₅, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou haloalquilsulfonila C₁-C₄;

- R¹⁸ é H, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, haloalquila C₁-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄, alcoxialquila C₂-C₄, alquiltioalquila C₂-C₄, alquilsulfinilalquila C₂-C₄, alquilsulfonilalquila C₂-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, haloalquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₅, alcoxicarbonilalquila C₃-C₅, alquilaminocarbonila C₂-C₅, dialquilaminocarbonila C₃-C₅, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alcoxialcóxi C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou haloalquilsulfonila C₁-C₄; e

- R¹⁹ é H, halogênio, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, haloalquila C₁-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄, alcoxialquila C₃-C₄, alquiltioalquila C₂-C₄, alquilsulfinilalquila C₂-C₄, alquilsulfonilalquila C₂-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, haloalquilcarbonila C₂-C₅,

alcóxicarbonila C₂-C₅, alquilaminocarbonila C₂-C₅, dialquilaminocarbonila C₃-C₅, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou haloalquilsulfonila C₁-C₄;

desde que:

5 (a) quando X for X², X³, X⁴, X⁶ ou X⁸, então G não está ligado a X através de um heteroátomo do anel G, e

(b) quando Z for C=W², então A é diferente NH ou CH₂.

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

- R¹ é uma fenila ou um anel heteroaromático de 5 ou 6 membros, 10 opcionalmente substituído por 1 a 2 substituintes independentemente selecionados a partir de R⁴;

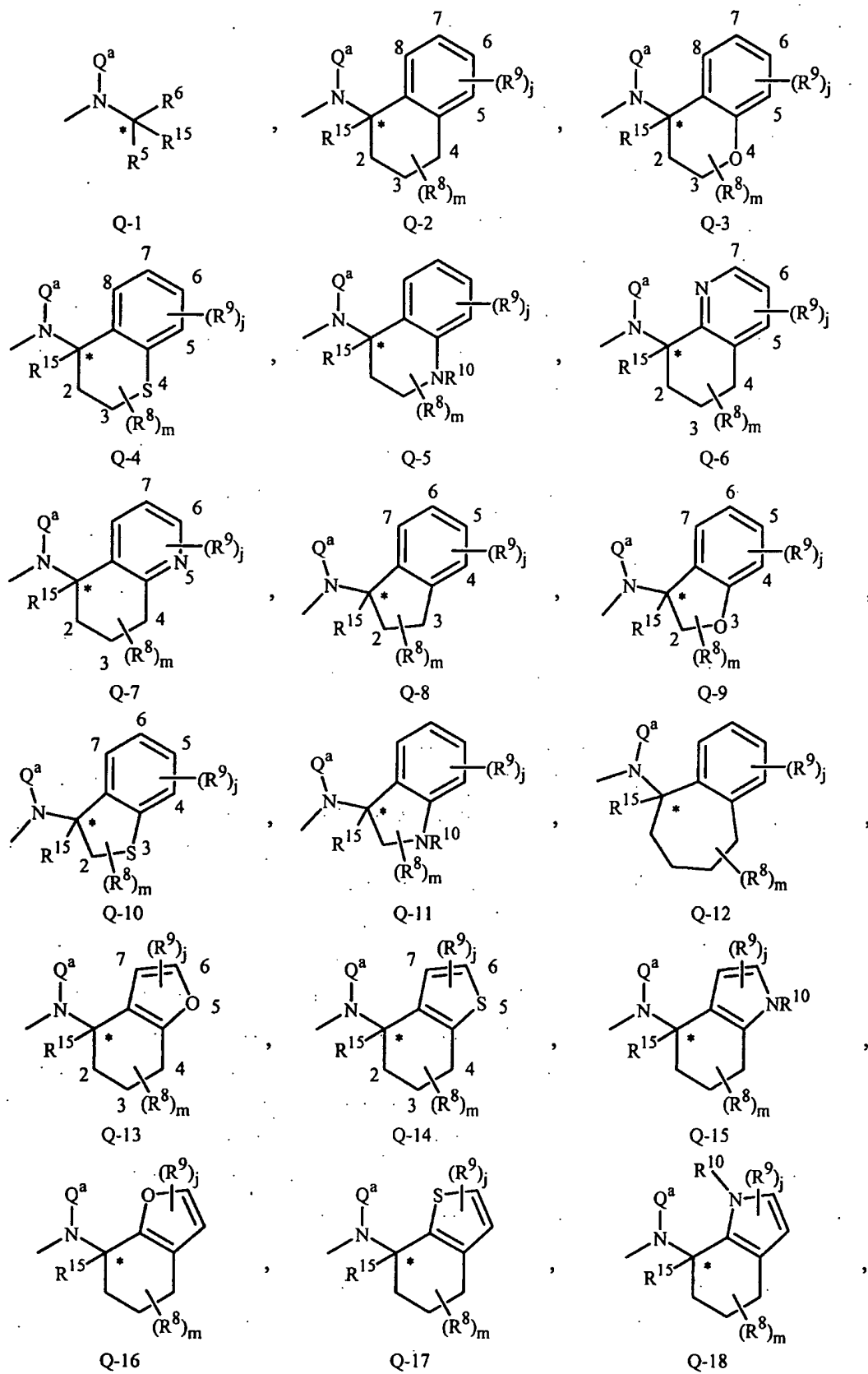
- cada R⁴ é independente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, 15 haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, aminoácidos, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcóxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, 20 alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilila C₃-C₆;

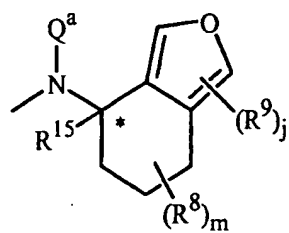
- G é um anel heteroaromático de 5 membros ou um anel heterocíclico 5-membros saturados ou parcialmente saturados, cada anel 25 opcionalmente substituído por até 2 substituintes selecionados a partir de R³ nos membros do anel de carbono e selecionados a partir de R¹¹ nos membros do anel de nitrogênio;

- cada R³ é independente alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃ ou halogênio;

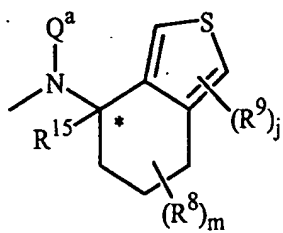
- R^{11} é alquila C_1 - C_3 ; e

- Q é um radical selecionado a partir de

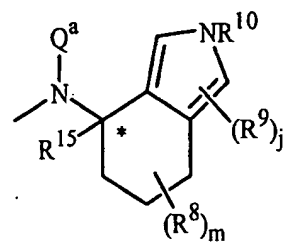




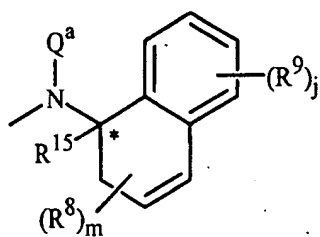
Q-19



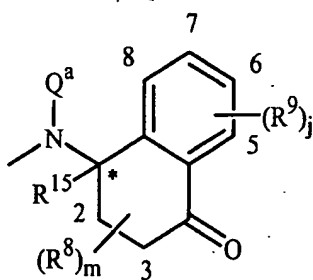
Q-20



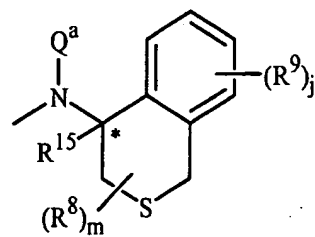
Q-21



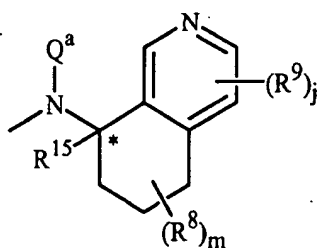
Q-22



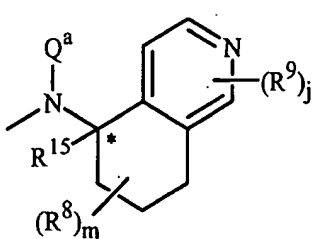
Q-23



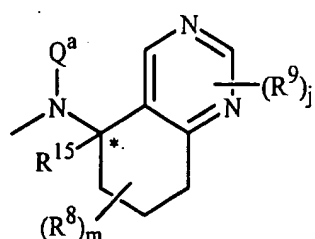
Q-24



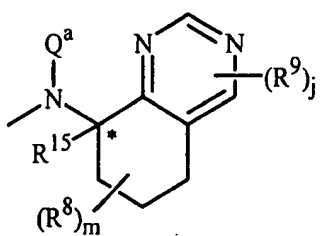
Q-25



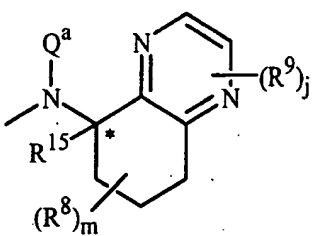
Q-26



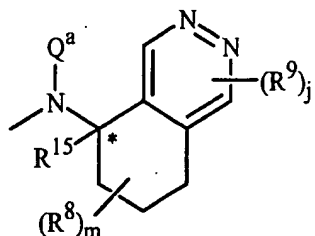
Q-27



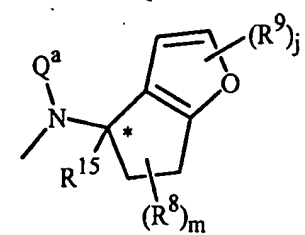
Q-28



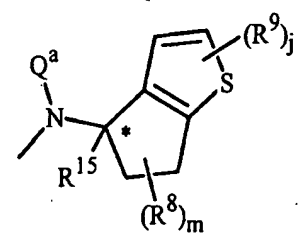
Q-29



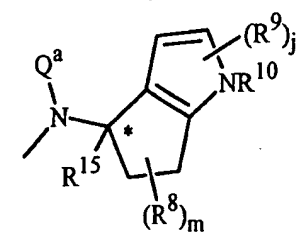
Q-30



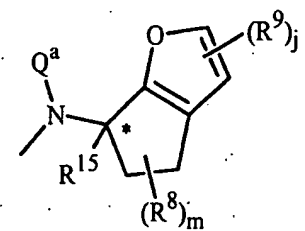
Q-31.



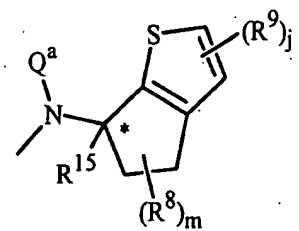
Q-32



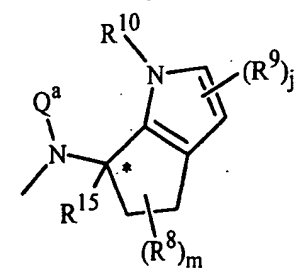
Q-33



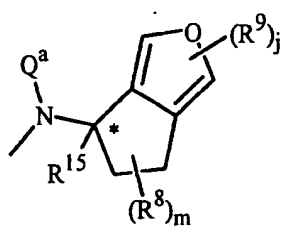
Q-34



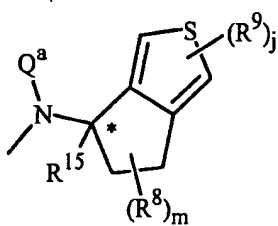
Q-35



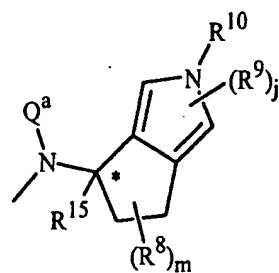
Q-36



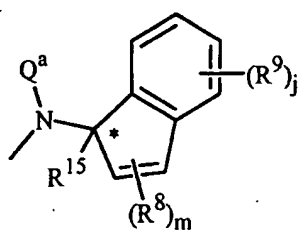
Q-37



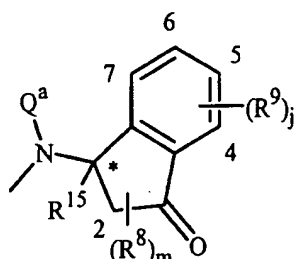
Q-38



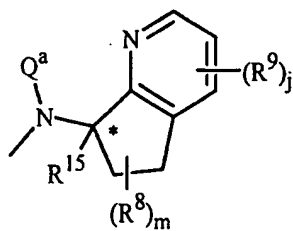
Q-39



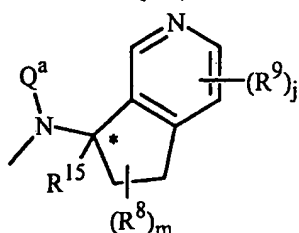
Q-40



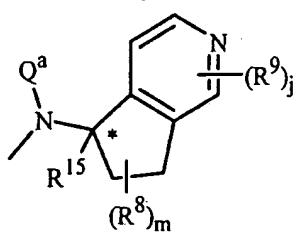
Q-41



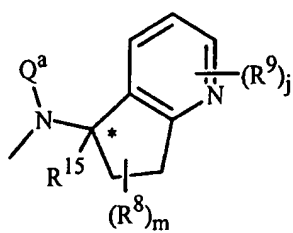
Q-42



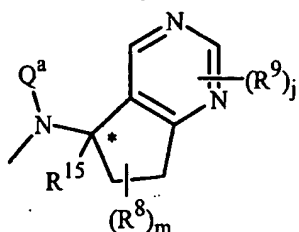
Q-43



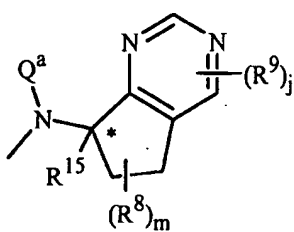
Q-44



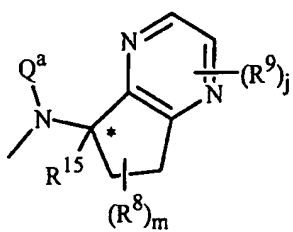
Q-45



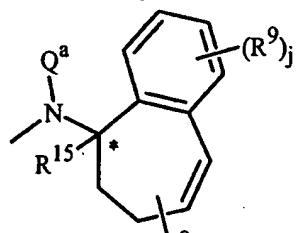
Q-46



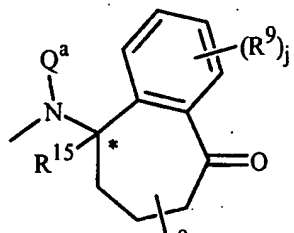
Q-47



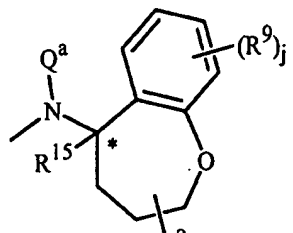
Q-48



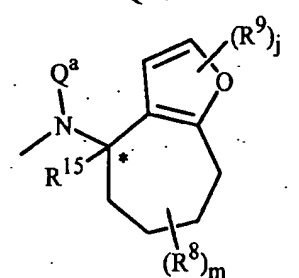
Q-49



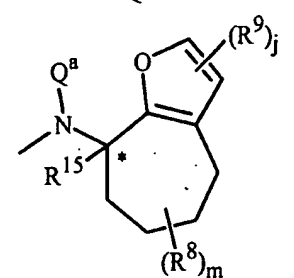
Q-50



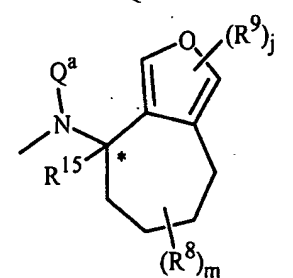
Q-51



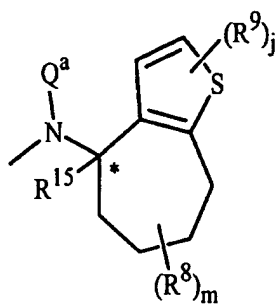
Q-52



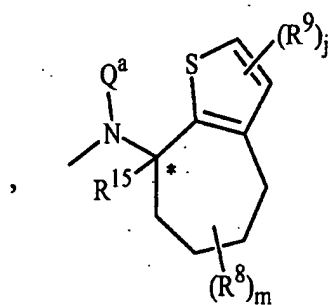
Q-53



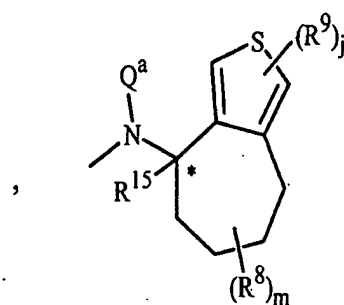
Q-54



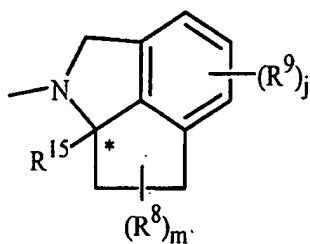
Q-55



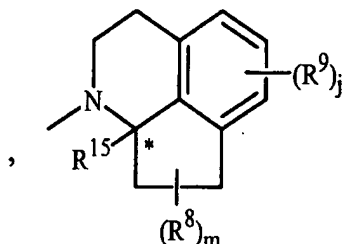
Q-56



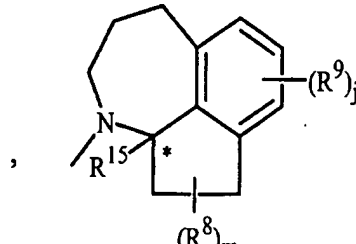
Q-57



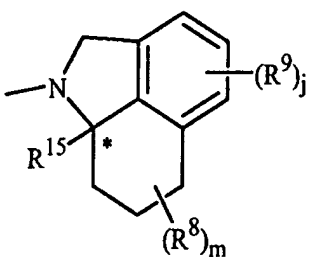
Q-58



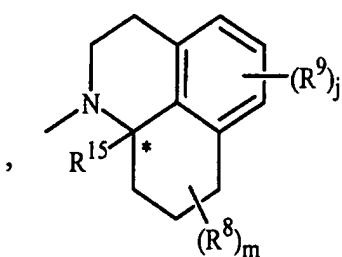
Q-59



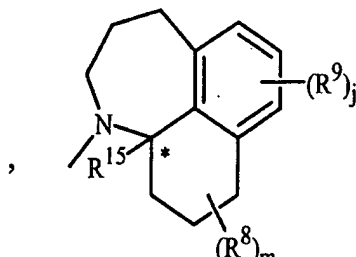
Q-60



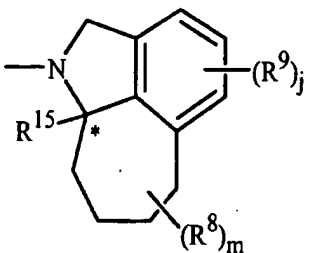
Q-61



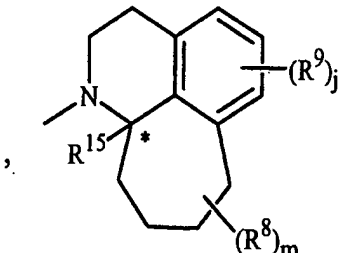
Q-62



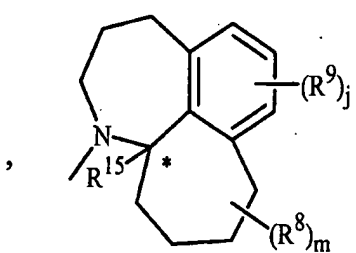
Q-63



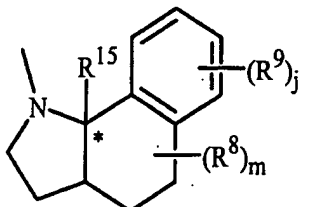
Q-64



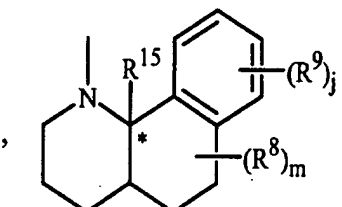
Q-65



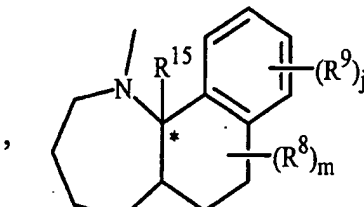
Q-66



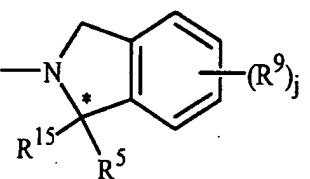
Q-67



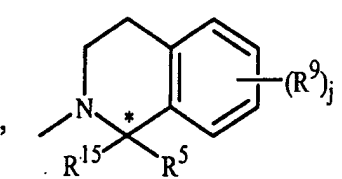
Q-68



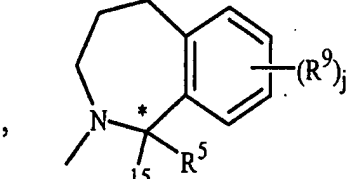
Q-69



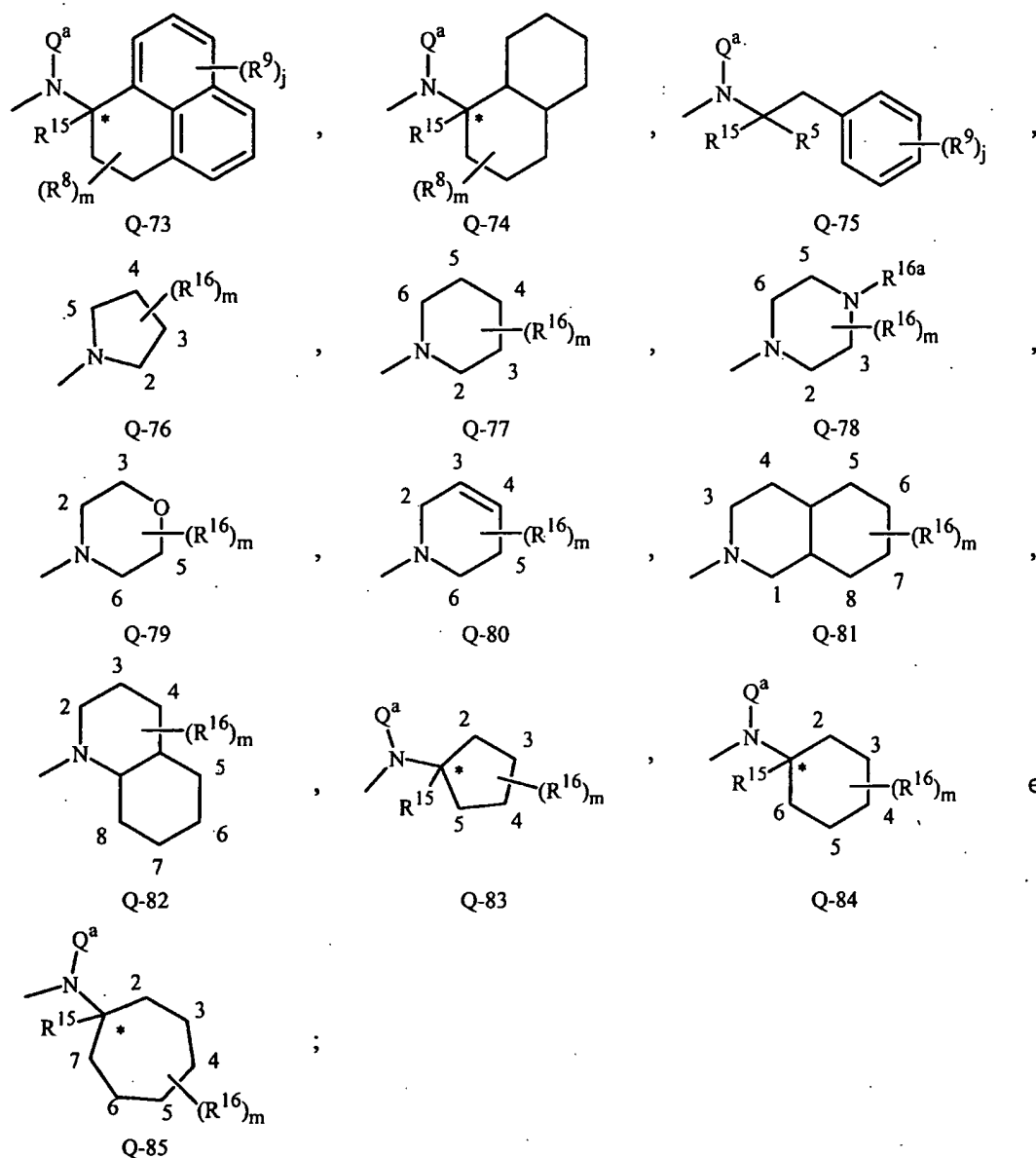
Q-70



Q-71



Q-72



em que o átomo de carbono identificados com asterisco (*) contém um estereocentro; R^{15} é conforme descrito acima, e para Q-2 até Q-75, cada R^8 está independente ligado nos átomos de carbono do anel carbocíclico não aromático ou anel heterocíclico do grupo Q, e cada R^9 está independente ligado nos átomos de carbono da fenila ou do anel heteroaromático do grupo Q,

cada R^8 é independentemente H, alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 , alquinila C_3-C_4 , cicloalquila C_3-C_6 , haloalquila C_1-C_4 , haloalquenila C_2-C_4 , haloalquinila C_2-C_4 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano,

nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄,
 alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄,
 haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₆,
 cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₁-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila
 5 C₂-C₄, alcoxycarbonila C₂-C₄, alquilcarbonilóxi C₂-C₄, alquilcarboniltio C₂-C₄,
 alquilaminocarbonila C₂-C₄, alquilaminocarbonilóxi C₂-C₄,
 dialquilaminocarbonila C₃-C₆ ou trialquilsilil C₃-C₆;

cada R⁹ é independente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila
 C₃-C₆, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila
 10 C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-
 C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄,
 haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄,
 alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-
 C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxycarbonila C₂-C₆,
 15 alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆,
 dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilil C₃-C₆;

- R¹⁰ é H ou alquila C₁-C₃;

- m é 0, 1 ou 2;

- j é 0, 1 ou 2;

20 - cada R¹⁶ é independente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila
 C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀,
 alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆,
 haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano,
 nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄,
 25 alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄,
 haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈,
 cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila
 C₂-C₄, alcoxycarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆,

alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₆ ou trialquilsilil C₃-C₆, ou um anel fenila ou benzila, opcionalmente substituído por até 3 substituintes selecionados a partir de R¹³, ou

- dois R¹⁶ ligados nos átomos de carbono do anel adjacentes são empregados em conjunto como -(CH₂)₃- ou -(CH₂)₄- opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes selecionados a partir de alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, halogênio, hidróxi, amino, ciano e nitro;

- R^{16a} é H, alquila C₁-C₆, alquenila C₃-C₆, alquinila C₃-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₃-C₆, haloalquinila C₃-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, amino, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆ ou dialquilaminocarbonila C₃-C₈, ou um anel fenila ou benzila, opcionalmente substituído por até 3 substituintes selecionados a partir de R¹³,

- cada R¹³ é independente alquila C₁-C₆, alquenila C₂-C₆, alquinila C₂-C₆, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquilalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquila C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquila C₅-C₁₀, haloalquila C₁-C₆, haloalquenila C₂-C₆, haloalquinila C₂-C₆, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfinila C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfinila C₁-C₄, haloalquilsulfonila C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alcoxialquila C₂-C₄, hidroxialquila C₁-C₄, alquilcarbonila C₂-C₄, alcoxicarbonila C₂-C₆, alquilcarbonilóxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquilaminocarbonila C₂-C₆, dialquilaminocarbonila C₃-C₈ ou trialquilsilil C₃-C₆;

- R⁶ é uma fenila, benzila, naftalenila, cicloalquila C₃-C₆, cicloalquenila C₃-C₆ ou um anel heteroaromático de 5 ou 6 membros, cada um

opcionalmente substituído por 1 a 3 substituintes selecionados a partir de R^7 nos membros do anel de carbono e R^{12} nos membros do anel de nitrogênio;

- cada R^7 é independente alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_6 , cicloalquilalquila C_4-C_{10} , alquilcicloalquila C_4-C_{10} ,
 5 alquilcicloalquilalquila C_5-C_{10} , haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 , halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinila C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfinila C_1-C_4 , haloalquilsulfonila C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_8 ,
 10 cicloalquilamino C_3-C_6 , alcoxialquila C_2-C_4 , hidroxialquila C_1-C_4 , alquilcarbonila C_2-C_4 , alcoxicarbonila C_2-C_6 , alquilcarbonilóxi C_2-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquilaminocarbonila C_2-C_6 , dialquilaminocarbonila C_3-C_8 ou trialquilsilil C_3-C_6 ; e

- R^{12} é H ou alquila C_1-C_3 .

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

15 - R^1 é um dentre U-1 até U-50;

- k é 0, 1 ou 2;

- G é um dentre G-1 até G-55;

- R^{3a} é H, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 ou halogênio;

- R^{11a} é H ou alquila C_1-C_3 ;

20 - R^6 é um dentre H-1 até H-46; e

- p é 0, 1 ou 2;

contanto que quando U for U-4, U-11 até U-15, U-24 até U-26, U-31 e U-35, e um radical R^4 estiver ligado a um átomo de nitrogênio do anel, dito radical R^4 é alquila C_1-C_6 , alquenila C_2-C_6 , alquinila C_2-C_6 , cicloalquila C_3-C_4 ,
 25 haloalquila C_1-C_6 , haloalquenila C_2-C_6 , haloalquinila C_2-C_6 , halocicloalquila C_3-C_6 ou alcoxialquila C_2-C_4 .

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

- cada R^2 é independente alquila C_1-C_2 , haloalquila C_1-C_2 , alcóxi

C₁-C₂, halogênio, ciano ou hidróxi;

- cada R⁴ é independente alquila C₁-C₃, alquenila C₂-C₃, alquinila C₂-C₃, ciclopropila, haloalquila C₁-C₃, haloalquenila C₂-C₃, haloalquinila C₂-C₃, halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂;

5 - X é um radical selecionado dentre X¹, X² e X³;

- Q^a é H ou CH₃;

- R⁵ é alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, haloalquila C₁-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄, halocicloalquila C₃-C₄, ciano ou alcóxi C₂-C₄;

10 - cada R⁷ é independente alquila C₁-C₃, alquenila C₂-C₃, alquinila C₂-C₃, ciclopropila, haloalquila C₁-C₃, haloalquenila C₂-C₃, haloalquinila C₂-C₃, halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂;

- cada R⁸ é independentemente H, alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₃-C₄, cicloalquila C₃-C₆, haloalquila C₁-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄, halocicloalquila C₃-C₆, halogênio, hidróxi, amino, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₄ ou alquilcarbonilóxi C₂-C₄;

15 - cada R⁹ é independente alquila C₁-C₃, ciclopropila, haloalquila C₁-C₃, halociclopropila, halogênio, hidróxi, alquilcarbonilóxi C₂-C₃, alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂;

20 - R¹⁰ é H ou metila;

- cada R¹⁶ é independente alquila C₁-C₃, alquenila C₂-C₃, alquinila C₂-C₃, ciclopropila, haloalquila C₁-C₃, haloalquenila C₂-C₃, haloalquinila C₂-C₃, halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂; ou um anel fenila ou benzila, opcionalmente substituído por até 3 substituintes selecionados a partir de R¹³;

25

- R^{16a} é H, alquila C₁-C₃, alila, propargila, ciclopropila ou haloalquila C₁-C₃, ou um anel fenila ou benzila, opcionalmente substituído por até 3 substituintes selecionados a partir de R¹³,

- cada R^{13} é independente alquila C_1-C_3 , alquenila C_2-C_3 , alquinila C_2-C_3 , ciclopropila, haloalquila C_1-C_3 , haloalquenila C_2-C_3 , haloalquinila C_2-C_3 , halociclopropila, halogênio, ciano, nitro, alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 ;

- R^{15} é H ou CH_3 ;

5 - A é NR^{18} ou alquilenos C_1-C_2 opcionalmente substituído por R^{17} ;
 R^{17} é H, halogênio, ciano, -CHO, alquila C_1-C_2 , alcoxialquila C_2-C_3 ,
alquilcarbonila C_2-C_3 ou alcoxycarbonila C_2-C_3 ;

- R^{18} é H, ciano, hidróxi, -CHO, alquila C_1-C_2 , alcoxialquila C_2-C_3 ,
alquilcarbonila C_2-C_3 ou alcoxycarbonila C_2-C_3 ;

10 - Z é $C=W^2$ ou metileno opcionalmente substituído por R^{19} ; e

- R^{19} é H, halogênio, ciano, alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 .

5. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 4, em que

- R^1 é um dentre U-1 até U-3, U-13, U-20, U-22, U-23, U-37 até U-39 e U-50, e

15 - cada R^4 é independente halogênio, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 , alcóxi C_1-C_2 ou haloalcóxi C_1-C_2 .

6. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 4, em que

- G é G-1, G-2, G-7, G-8, G-14, G-15, G-23, G-24, G-26, G-27, G-36 até G-38, G-49 ou G-50;

20 - R^{3a} é H, CH_3 , Cl ou Br;

R^{17} é H, alquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou alcoxycarbonila C_2-C_3 ;

- R^{18} é H, -CHO, alquila C_1-C_2 , alquilcarbonila C_2-C_3 ou alcoxycarbonila C_2-C_3 ; e

25 - R^{19} é H, alquila C_1-C_2 ou haloalquila C_1-C_2 .

7. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 6, em que:

- G não é substituído.

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

- Q é Q-1, Q-2, Q-3, Q-4, Q-8, Q-9, Q-10, Q-12, Q-14, Q-22, Q-23, Q-24, Q-40, Q-41, Q-59, Q-62, Q-74 ou Q-84;

- R⁵ é alquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, alquinila C₂-C₄, cicloalquila C₃-C₄, haloalquila C₁-C₄, haloalquenila C₂-C₄, haloalquinila C₂-C₄,
5 halocicloalquila C₃-C₄, ciano ou alcoxialquila C₂-C₄;

- R⁶ é H-1, H-20, H-32, H-45 ou H-46;

- cada R⁷ é independente halogênio, alquila C₁-C₃, haloalquila C₁-C₃, alcóxi C₁-C₂ ou haloalcóxi C₁-C₂;

- cada R⁸ é independente alquila C₁-C₂, haloalquila C₁-C₂, alcóxi
10 C₁-C₂, haloalcóxi C₁-C₂, alquilcarbonilóxi C₂-C₄ ou hidróxi; e

- cada R⁹ é independente halogênio, hidróxi, OCH₃ ou CH₃.

9. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 8, em que:

- Q é Q-1, Q-2, Q-8, Q-14, Q-23, Q-41, Q-59 ou Q-62;

- Q^a é CH₃;

15 - R⁵ é alquila C₁-C₄, haloalquila C₁-C₄, alquenila C₂-C₄, haloalquenila C₂-C₄ ou ciano;

- R⁶ é H-1 ou H-45;

- R¹² é H ou CH₃;

- cada R⁷ é independente F, Cl, Br, OCH₃ ou metila;

20 - R⁸ é CH₃, OCH₃ ou hidróxi;

- R¹⁰ é H ou CH₃; e

- R¹⁵ é H; R⁸ é CH₃, OCH₃ ou OH; e R¹⁰ é H ou CH₃.

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

- W¹ e W² são independentemente O;

25 - Q^a é CH₃;

- R^{3a} é H;

- m, j, n e p são todos independentemente 0 ou 1;

- cada R⁷ é independente F, Cl, Br, OCH₃ ou metila;

- cada R^8 é independente alquila C_1-C_2 , alcóxi C_1-C_2 ou hidróxi; e

- cada R^9 é independente F, Cl, Br, hidróxi, OCH_3 ou CH_3 .

11. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 10, em que:

- R^1 é U-1 ou U-50;

5 - cada R^4 é independente halogênio, alquila C_1-C_3 , haloalquila C_1-C_3 ou alcóxi C_1-C_2 ;

- k é 1 ou 2;

- G é G-1, G-2, G-15, G-26, G-27, G-36, G-37 ou G-38,

- Q é Q-1, Q-2, Q-8, Q-23 ou Q-41;

10 - R^5 é alquila C_1-C_4 , alquenila C_2-C_4 ou ciano;

- R^6 é H-45,

contanto que quando k for 1, R^4 está ligado na posição 3 ou 5 de U-1, e na posição 3 e 5 de U-1, e na posição 2 ou 3 de U-50, e quando k for 2, um R^4 independentemente selecionado está ligado em cada uma das posição 2 e 5 de U-1 e cada uma das poições 2 e 5 de U-50.

12. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 11, em que:

- X é X^1 ; e

- G é G-1.

13. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 11, em que:

20 - X é X^1 ; e

- G é G-2.

14. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 11, em que:

- X é X^1 ; e

- G é G-15.

25 15. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 11, em que:

- X é X^1 ; e

- G é G-26.

16. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 11, em que:

- X é X¹; e

- G é G-36.

17. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 11, em que:

- X é X²; e

- G é G-1.

18. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 11, em que:

- X é X²; e

- G é G-2.

19. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1,

selecionado a partir do grupo que consiste em:

1-[4-[4-[[metil[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]amino]metil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona,

- 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-L-[4-[4-[[[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]amino]metil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]etanona,

- N-[[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil]metil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]acetamida,

- N-[[2-[1-[2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]-4-piperidinil]-4-tiazolil]metil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]formamida,

- N-metil-2-[1-[3-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-oxopropil]-4-piperidinil]-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil]-4-thiazolcarboxamida, e

- etil 4-[4-[[metil(1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil)amino]carbonila]-2-tiazolil]-α-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-β-oxo-1-piperidinapropanoato.

20. MÉTODO PARA O CONTROLE DAS DOENÇAS VEGETAIS CAUSADAS POR PATÓGENOS VEGETAIS FÚNGICOS OOMYCETE, que compreende a aplicação no vegetal ou parte do mesmo, ou na semente ou muda vegetal, de uma quantidade fungicida eficaz de um

composto que possui uma fórmula correspondente à de Fórmula 1, conforme descrita na reivindicação 1.

21. COMPOSIÇÃO FUNGICIDA, que compreende (1) um composto que possui uma fórmula correspondente à Fórmula 1 conforme descrita na reivindicação 1; e (2) pelo menos algum outro fungicida.

22. COMPOSIÇÃO FUNGICIDA, que compreende (1) uma quantidade fungicida eficaz de um composto que possui uma fórmula correspondente à Fórmula 1, conforme descrita na reivindicação 1; e (2) pelo menos um componente adicional selecionado a partir do grupo que consiste em tensoativos, diluentes sólidos e diluentes líquidos.

PT0806214-5

RESUMO**“COMPOSTO, MÉTODO PARA O CONTROLE DAS DOENÇAS VEGETAIS
CAUSADAS POR PATÓGENOS VEGETAIS FÚNGICOS OOMYCETE E
COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS”**

5 A presente invenção se refere aos compostos de Fórmula 1, incluindo todos os isômeros geométricos e estereoisômeros, N-óxidos e seus sais, à Fórmula 1 do presente em que R_1 , R_2 , A, G, W1, Q, X, Z e n são conforme definidos no presente relatório descritivo. Também estão descritas as composições contendo os compostos de Fórmula 1 e os métodos para o

10 controle de doenças vegetais causadas por um patógeno fúngico que compreende a aplicação de uma quantidade eficaz de um composto ou uma composição da presente invenção.