



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

**(11) PI 0316993-6 B1**

**(22) Data do Depósito:** 12/11/2003

**(45) Data de Concessão:** 05/07/2016



---

**(54) Título:** DERIVADOS DE 5-(ACILAMINO)PIRAZOL PESTICIDAS

**(51) Int.Cl.:** A01N 43/56; C07D 231/44; C07D 401/12

**(30) Prioridade Unionista:** 03/12/2002 EP 02 027062.5

**(73) Titular(es):** MERIAL, INC.

**(72) Inventor(es):** STEFAN SCHNATTERER, DAVID WILLIAM HAWKINS, DANIELA JANS, MICHAEL MAIER, ANKE KUHLMANN, ERICH FRIEDRICH SANWALD, MARIA-THERESIA THÖNESSEN, KARL SEEGER

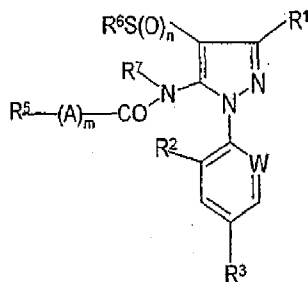
Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "DERIVADOS DE 5-(ACILAMINO)PIRAZOL PESTICIDAS".

A invenção refere-se a derivados de acilaminopirazóis 5- substituídos, processos para sua preparação a composições dos mesmos e ao seu uso para o controle de pragas, tal como artrópodes nocivos (inclusive insetos e acarídeos) e helmintos (inclusive nematódeos).

O controle de insetos ou helmintos, tal como nematódeos, com compostos de 1-arilpirazóis foi descrito, por exemplo, nas publicações de patente números WO 93,06089, WO 94/21606, WO 87/03781, EP 0295117, EP 659745, EP 679650, EP 201852 e U.S. 5.232.940. O controle de parasitas em animais com compostos de 1-arilpirazóis também foi descrito nas publicações de patente números WO 00/35884, EP 0846686, WO 98/24769 e WO 97/28126.

No entanto, o nível de ação e/ou a duração de ação desses compostos da técnica anterior não é inteiramente satisfatório em todas as áreas de aplicação, particularmente, contra determinados organismos ou se foram aplicadas concentrações baixas.

Como os pesticidas modernos precisam satisfazer uma ampla gama de exigências, por exemplo, no que se refere ao nível, à duração e ao espectro de ação, espectro de uso, toxicidade, combinação com outras substâncias ativas, combinação com adjuvantes ou sínteses de formulação, e como a ocorrência de resistências é possível, o desenvolvimento dessas substâncias nunca pode ser considerado como concluído, e há constantemente uma alta demanda por novos compostos, que sejam vantajosos em relação aos compostos conhecidos, pelo menos no que se refere a alguns aspectos.



(I)

na qual

$R^1$  é  $(C_1-C_6)$ -haloalquila, CN,  $NO_2$  ou halogênio;

$R^2$  é H, halogênio ou  $CH_3$ ;

$R^3$  é  $(C_1-C_3)$ -haloalquila,  $(C_1-C_3)$ -haloalcóxi ou  $S(O)_p(C_1-C_3)$ -

5 haloalquila;

W é N ou  $C-R^4$ ;

$R^4$  é halogênio ou  $CH_3$ ;

A é  $(C_2-C_6)$ -alquilenos ou  $(C_2-C_6)$ -haloalquilenos;

ou é  $(C_3-C_6)$ -alquilenos, no qual um carbono na cadeia é substi-

10 tuído por O, S, SO,  $SO_2$  ou  $NR^8$ , com a condição de que o grupo substituinte não esteja ligado ao  $R^5$  ou grupo carbonila adjacente; ou é

$(C_2-C_6)$ -alquenileno ou  $(C_2-C_6)$ -haloalquenileno; ou é

$-[(C_1-C_3)\text{-alquil}]_r\text{-aril-}[(C_1-C_3)\text{-alquil}]_s$ , ou  $[(C_1-C_3)\text{-alquil}]_r\text{-}$

heterociclil- $[(C_1-C_3)\text{-alquil}]_s$ , ou  $[(C_1-C_3)\text{-alquil}]_r\text{-}(C_3-C_6)\text{-cicloalquil-}[(C_1-C_3)\text{-}$

15  $\text{alquil}]_s$  ou  $-[(C_1-C_3)\text{-alquil}]_r\text{-}(C_5-C_6)\text{-cicloalquenil-}[(C_1-C_3)\text{-alquil}]_s$ , sendo que

nos quatro grupos mencionados por último arila, heterociclila, cicloalquila e cicloalquenila são não-substituídos ou substituídos por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em  $(C_1-C_6)$ -alquila,  $(C_1-C_6)$ -haloalquila,  $(C_1-C_6)$ -alcóxi,  $(C_1-C_6)$ -haloalcóxi,  $OR^{11}$ , CN,  $NO_2$ ,  $S(O)_pR^{10}$ ,  $COR^{10}$ ,  $CO-$   
20  $OR^{10}$ ,  $CONR^9R^{10}$ ,  $SO_2NR^9R^{10}$ ,  $NR^9R^{10}$ , OH,  $SO_3H$  e  $(C_1-C_6)$ -alquilidenimino;

$R^5$  é  $CONR^9R^{10}$  ou  $CO_2R^{10}$ , quando m for 0 ou 1; ou  $R^5$  é  $NR^9R^{17}$ , quando m for 1;

$R^6$  é  $(C_1-C_3)$ -alquila ou  $(C_1-C_3)$ -haloalquila;

25  $R^7$  é H,  $(C_2-C_6)$ -alquenila,  $(C_2-C_6)$ -haloalquenila,  $(C_2-C_6)$ -alquini-  
la,  $(C_2-C_6)$ -haloalquinila,  $(C_3-C_7)$ -cicloalquila,  $COR^{11}$ ,  $COR^{12}$ ,  $COR^{13}$ ,  $-CO_2-$   
 $(C_1-C_6)$ -alquila,  $-CO_2-(CH_2)_qR^{11}$ ,  $-CO_2-(CH_2)_qR^{13}$ ,  $-CO_2-(C_3-C_7)$ -cicloalquila,  
 $-CO_2-(C_1-C_6)$ -alquil- $(C_3-C_7)$ -cicloalquila,  $CO-(C_2-C_6)$ -alquenila,  $-CH_2R^{11}$  ou  
 $CH_2R^{13}$ ; ou  $(C_1-C_6)$ -alquila, não-substituída ou substituída por um ou mais

30 radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio,  $(C_1-C_6)$ -alcóxi,  $(C_1-C_6)$ -haloalcóxi,  $(C_3-C_7)$ -cicloalquila,  $S(O)_pR^{14}$ ,  $CO_2-(C_1-C_6)$ -alquila,  
 $-O(C=O)-(C_1-C_6)$ -alquila,  $NR^9R^{10}$ ,  $-CONR^9R^{10}$ ,  $SO_2NR^9R^{10}$ , OH, CN,  $NO_2$ ,

OR<sup>11</sup>, OR<sup>13</sup>, NR<sup>10</sup>COR<sup>9</sup>, NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup> e COR<sup>12</sup>;

R<sup>8</sup> é R<sup>9</sup>, CO-R<sup>9</sup>, CO-R<sup>11</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>12</sup> ou CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, substituído por amino;

R<sup>9</sup> é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquenila,  
 5 (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquinila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquinila, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-  
 cicloalquila ou -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila;

R<sup>10</sup> é R<sup>9</sup>, -[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil]<sub>q</sub>R<sup>11</sup>, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil-,  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil- ou (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil-S(O)<sub>p</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-  
 alquil-; ou

10 R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup> ou R<sup>9</sup> e R<sup>17</sup>, cada um, junto com o respectivo átomo de  
 N ligado, formam um anel de quatro a sete membros, saturado, que opcio-  
 nalmente contém um heteroátomo adicional no anel, que é escolhido de O, S  
 e N, sendo que o anel é não-substituído ou substituído por um ou mais radi-  
 cais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 15 haloalquila e CO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila;

R<sup>11</sup> é fenila não-substituída ou substituída por um ou mais radi-  
 cais escolhidos do grupo consistindo em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi, OR<sup>16</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, S(O)<sub>p</sub>R<sup>12</sup>,  
 COR<sup>9</sup>, COOH, COOR<sup>12</sup>, CONR<sup>9</sup>R<sup>15</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>R<sup>15</sup>, NR<sup>9</sup>R<sup>15</sup>, OH, SO<sub>3</sub>H e  
 20 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilidenoimino;

R<sup>12</sup> é (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila;

R<sup>13</sup> é heterociclila não-substituída ou substituída por um ou mais  
 radicais que consistem em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcóxi, S(O)<sub>p</sub>R<sup>12</sup>, OH e oxo;

25 R<sup>14</sup> é (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila ou  
 -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila;

R<sup>15</sup> é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila  
 ou -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila;

R<sup>16</sup> é fenila não-substituída ou substituída por um ou mais radi-  
 30 cais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi, CN, NO<sub>2</sub>, S(O)<sub>p</sub>R<sup>12</sup>, COR<sup>15</sup>,  
 COOH, COOR<sup>12</sup>, CONR<sup>9</sup>R<sup>15</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>R<sup>15</sup>, NR<sup>9</sup>R<sup>15</sup> e OH;

$R^{17}$  é  $R^{10}$ ,  $\text{CO}_2(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$ ,  $-\text{CH}_2\text{CO}_2(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$ ,  $\text{CO}_2\text{CH}_2R^{18}$  ou  $\text{CO}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$ ;

$R^{18}$  é fenila não-substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$ ,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-haloalquila}$  e  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alcóxi}$ ;

n e p são, independentemente um do outro, 0, 1 ou 2;

m e q são, independentemente um do outro, 0 ou 1;

r e s são, independentemente um do outro, 0 ou 1; e

cada heterociclila nos radicais acima mencionados é, independentemente, um radical heterocíclico com 3 a 7 átomos anelares e 1, 2 ou 3 heteroátomos no anel, escolhidos do grupo que consiste em N, O e S;

ou um sal pesticidamente aceitável dos mesmos.

Esses compostos possuem propriedades pesticidas valiosas.

A invenção também abrange qualquer estereoisômero, enantiômero ou isômero geométrico e misturas dos mesmos.

Pelo termo "sais pesticidamente aceitáveis" são designados sais cujos cátions ou ânions são conhecidos e aceitos na técnica para a formação de sais para uso pesticida. Sais apropriados com bases, por exemplo, formados por compostos da fórmula (I) que contêm um grupo ácido carboxílico, incluem sais de metais alcalinos (por exemplo, sódio e potássio), de metais alcalino-terrosos (por exemplo, cálcio e magnésio), de amônio e amina (por exemplo, dietanolamina, trietanolamina, octilamina, morfolina e dioctilmetilamina). Sais de adição de ácido apropriados, por exemplo, formados por compostos da fórmula (I), que contêm um grupo amino, incluem sais com ácidos inorgânicos, por exemplo, cloridratos, sulfatos, fosfatos e nitratos e sais com ácidos orgânicos, por exemplo, ácido acético.

Deve ser entendido que a condição acima está incluída apenas por razões da instabilidade química das porções específicas excluídas, e não por razões de técnica anterior.

Na presente especificação de patente, incluindo as reivindicações anexas, os substituintes citados acima têm os seguintes significados:

átomo de halogênio significa flúor, cloro, bromo ou iodo.

O termo "halo" antes do nome de um radical significa que esse radical está parcialmente ou completamente halogenado, quer dizer, substituído por F, Cl, Br ou I, em qualquer combinação, preferivelmente, por F ou Cl.

5 Grupos alquila e partes dos mesmos (a não ser que definido de modo diverso) podem ser de cadeia linear ou ramificada.

A expressão "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila" deve ser entendida como significando um radical hidrocarboneto não-ramificado ou ramificado, com 1, 2, 3, 4, 5, ou 6 átomos de carbono, tal como, por exemplo, um radical metila, etila, propila, isopropila, 1-butila, 2-butila, 2-metilpropila ou terc-butila.

Radicais alquila e também em grupos compósitos, a não ser que definidos de outro modo, têm, preferivelmente, 1 a 4 átomos de carbono.

15 "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalquila" significa um grupo alquila, mencionado sob a expressão "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila", no qual um ou mais átomos de hidrogênio estão substituídos pelo mesmo número de átomos de halogênio idênticos ou diferentes, tal como monohaloalquila, perhaloalquila, CF<sub>3</sub>, CHF<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>F, CHFCH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>, CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>, CHF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>FCHCl, CH<sub>2</sub>Cl, CCl<sub>3</sub>, CHCl<sub>2</sub> ou CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl.

20 A expressão "(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila" significa um grupo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, que é substituído por um grupo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi.

"-CO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila" significa, por exemplo, -CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-ciclopropila ou -CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>cicloexila. A expressão "[ (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil]-aril-[ (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil]," significa, por exemplo, -CH<sub>2</sub>-(1,4-fenileno)-CH<sub>2</sub>- ou -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-(1,3-fenileno)-CH<sub>2</sub>-.

25 A expressão "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquileno" deve ser entendida como significando uma cadeia de carbono saturada, não-ramificada ou ramificada, com 1 a 6 átomos de carbono.

A expressão "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquileno" deve ser entendida como significando uma cadeia de carbono saturada, não-ramificada ou ramificada, com 1 a 6 átomos de carbono, na qual um ou mais átomos de hidrogênio estão substituídos pelo mesmo número de átomos de halogênio idênticos ou diferentes.

A expressão "(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquenileno" deve ser entendida como significando uma cadeia de carbono saturada, não-ramificada ou ramificada, com 2 a 6 átomos de carbono, e que contém pelo menos uma dupla ligação que pode estar localizada em qualquer posição do respectivo radical não-saturado.

"(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alcóxi" significa um grupo alcóxi, cuja cadeia de carbono tem o significado dado sob a expressão "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila". "Haloalcóxi" é, por exemplo, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>F, CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> ou OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl.

"(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alquenila" significa uma cadeia de carbono não-cíclica, não-ramificada ou ramificada, com um número de átomos de carbono correspondente a essa série especificada e que contém pelo menos uma ligação dupla, que pode estar localizada em qualquer posição do respectivo radical insaturado. "(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alquenila", conseqüentemente, indica, por exemplo, o grupo vinila, alila, 2-metil-2-propenila, 2-butenila, pentila, 2-metil-pentenila ou hexenila.

"(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alquinila" significa uma cadeia de carbono não-cíclica, não-ramificada ou ramificada, com um número de átomos de carbono que corresponde a essa série especificada e que contém uma ligação tripla, que pode estar localizada em qualquer posição do respectivo radical insaturado. "(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alquinila", conseqüentemente, indica, por exemplo, o grupo propargila, 1-metil-2-propinila, 2-butinila ou 3-butinila.

Grupos cicloalquila e cicloalquenila são entendidos como incluir também estruturas em ponte, tal como norbornano e norborneno, que têm, preferivelmente, de três a sete átomos de carbono no anel e estão opcionalmente substituídos por halogênio ou alquila.

Em compostos da fórmula (I), são postos à disposição os seguintes radicais:

Um exemplo de alquila substituída por cicloalquila é ciclopropilmetila;

um exemplo de alquila substituída por alcóxi é metoximetila (CH<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>-); e

um exemplo de alquila substituída por alquiltio é metiltiometila

(CH<sub>3</sub>SCH<sub>2</sub>-).

Arila é um sistema aromático, mono- ou bicíclico, que contém seis a 10 átomos de carbono anelares, por exemplo, fenila, naftila, tetraidro-naftila, indenila, indanila e similar, preferivelmente, fenila.

- 5 Um grupo "heterociclila" pode ser saturado, insaturado ou heteroaromático; ele contém, preferivelmente, um ou mais, particularmente, 1, 2 ou 3, heteroátomos no anel heterocíclico, escolhidos, preferivelmente, do grupo que consiste em N, O e S; é, preferivelmente, um radical heterocíclico alifático, com 3 a 7 átomos anelares ou um radical heteroaromático com 5 ou
- 10 6 átomos anelares. O radical heterocíclico pode ser, por exemplo, um radical ou anel heteroaromático (heteroarila), tal como, por exemplo, um sistema aromático, mono-, bi- ou policíclico, no qual pelo menos 1 anel contém um ou mais heteroátomos, por exemplo, piridila, pirimidinila, piridazinila, pirazinila, triazinila, tienila, tiazolila, tiadiazolila, oxazolila, isoxazolila, furila, pirrolila,
- 15 la, pirazolila, imidazolila e triazolila, ou é um radical parcialmente ou totalmente hidrogenado, tal como oxiranila, oxetanila, oxolanila (=tetraidrofurila), oxanila, pirrolidila, piperidila, piperazinila, dioxolanila, oxazolinila, isoxazolinila, oxazolidinila, isoxazolidinila e morfolinila. O grupo "heterociclila" pode ser não-substituído ou substituído por um ou mais radicais (preferivelmente,
- 20 1, 2 ou 3 radicais), escolhidos do grupo que consiste em halogênio, alcóxi, haloalcóxi, alquiltio, hidroxila, amino, nitro, carboxila, ciano, alcóxicarbonila, alquilcarbonila, formila, carbamoila, mono- e dialquilaminocarbonila, amino substituído, tal como acilamino, mono- e dialquilamino, e alquilsulfinila, haloalquilsulfinila, alquilsulfonila, haloalquilsulfonila, alquila e haloalquila e,
- 25 adicionalmente, também oxo. O grupo oxo também pode estar presente nos heteroátomos anelares, nos quais são possíveis diversos números de oxidação, por exemplo, no caso de N e S.

O termo pragas significa pragas artrópodes (inclusive insetos e acarídeos) e helmintos (inclusive nematódeos).

- 30 Preferivelmente, R<sup>1</sup> é CN.  
Preferivelmente, R<sup>2</sup> é Cl.  
Preferivelmente, R<sup>3</sup> é CF<sub>3</sub>.



Preferivelmente, W é C-R<sup>4</sup> e R<sup>4</sup> é Cl.

Preferivelmente, arila é definida em A como fenila.

Preferivelmente, heterociclila é um radical heteroaromático com 5 ou 6 átomos anelares e 1, 2 ou 3 heteroátomos no anel, escolhidos do grupo que consiste em N, O e S, e é não-substituído ou substituído por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi e S(O)<sub>p</sub>R<sup>12</sup>. Preferivelmente, A é (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilenos; ou é (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilenos, no qual um carbono na cadeia está substituído por O, S, SO, SO<sub>2</sub> ou NR<sup>8</sup>, com a condição de que o grupo substituinte não esteja ligado ao R<sup>5</sup> ou grupo carbonila adjacente; ou é fenila não-substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi, CN ou NO<sub>2</sub>; ou é piridila, não-substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila e (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi.

Preferivelmente, R<sup>5</sup> é CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> ou CO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, quando m for 0 ou 1; ou R<sup>5</sup> é NR<sup>9</sup>R<sup>17</sup>, quando m for 1.

Preferivelmente, R<sup>6</sup> é (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila (mais preferivelmente, R<sup>6</sup> é CF<sub>3</sub>).

Preferivelmente, R<sup>7</sup> é H ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila.

Os seguintes valores são preferidos nas definições acima:

R<sup>8</sup> é R<sup>9</sup>, CO-R<sup>9</sup> ou CO-R<sup>11</sup>; sendo que R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup> são, independentemente um do outro, H ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila;

R<sup>11</sup> é fenila não-substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi, CN, S(O)<sub>p</sub>R<sup>12</sup> e NR<sup>9</sup>R<sup>15</sup>;

R<sup>12</sup> é (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila ou (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-haloalquila; e R<sup>15</sup> é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila;

R<sup>17</sup> é R<sup>10</sup>, CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>R<sup>18</sup> ou CO(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila;

e

R<sup>18</sup> é fenila não-substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-

haloalquila e (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi.

Uma classe preferida de compostos da fórmula (I) é aquela na qual:

5  $R^{10}$  é  $R^9$ ,  $-[(C_1-C_6)\text{-alquil}]_q\text{-}R^{11}$ , (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil- ou (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila;

$R^{17}$  é  $R^{10}$ , CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>R<sup>18</sup> ou CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila; e os outros valores são tais como definidos na fórmula (I).

Uma outra classe preferida de compostos da fórmula (I) é aquela na qual:

10  $R^1$  é CN;

$R^2$  é Cl;

$R^3$  é CF<sub>3</sub>;

W é CR<sup>4</sup> e R<sup>4</sup> é Cl;

15 A é (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilenos; ou é (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilenos, no qual um carbono na cadeia está substituído por O, S, SO, SO<sub>2</sub> ou NR<sup>8</sup>, com a condição de que o grupo substituinte não esteja ligado ao grupo R<sup>5</sup> ou carbonila adjacente; ou é fenila, não-substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, CN e NO<sub>2</sub>; ou é piridila, não-substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila e (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi;

20  $R^5$  é CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> ou CO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, quando m for 0 ou 1; ou R<sup>5</sup> é NR<sup>9</sup>R<sup>17</sup>, quando m for 1;

$R^6$  é (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila;

25  $R^7$  é hidrogênio ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila;

$R^8$  é R<sup>9</sup>, CO-R<sup>9</sup> ou CO-R<sup>11</sup>;

$R^9$  é H ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila;

30  $R^{10}$  é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquinila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquinila, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila,  $-(C_1-C_6)\text{-alquil-(C}_3\text{-C}_7\text{)-cicloalquila}$  ou  $-(CH_2)_qR^{11}$ ; ou

$R^9$  e R<sup>10</sup>, junto com o átomo de N ligado, formam um anel de cinco a seis membros, saturado, que opcionalmente contém um heteroátomo

adicional no anel, que é escolhido de O, S e N, sendo que o anel é não-substituído ou substituído por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio e (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila;

5  $R^{11}$  é fenila não-substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, CN, NO<sub>2</sub>, S(O)<sub>p</sub>R<sup>12</sup> e NR<sup>9</sup>R<sup>15</sup>;

$R^{12}$  é (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila;

$R^{15}$  é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila;

$R^{17}$  é R<sup>10</sup>, CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>R<sup>18</sup> ou CO(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila;

10 e

$R^{18}$  é fenila não-substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila e (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi.

15 Uma classe de compostos mais preferida da fórmula (I) é aquela na qual:

$R^1$  é CN;

$R^2$  é Cl;

$R^3$  é CF<sub>3</sub>;

W é CR<sup>4</sup> e R<sup>4</sup> é Cl;

20 i) m é 0;  $R^5$  é CONH(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, CON[(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquil]<sub>2</sub> ou CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila; e

$R^7$  é H ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila; ou

ii) m é 1;  $R^5$  é CO<sub>2</sub>H, CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila ou CON[(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquil]<sub>2</sub>;

25  $R^7$  é H ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila; e A é CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH=CH, CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>, fenila ou piridila; ou

30 iii) m é 1;  $R^5$  é NH(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, N[(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquil]<sub>2</sub>, NHCO(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila ou N[(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquil]CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila; ou NR<sup>9</sup>R<sup>17</sup>, em que R<sup>9</sup> e R<sup>17</sup>, juntos com o átomo de N ligado, formam um anel de pirrolidinila, piperidinila, morfolinila ou piperazinila, sendo que o anel é não-substituído ou substituído por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila e CO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila;  $R^7$  é H; e A é CH(CH)<sub>3</sub> ou CHCH<sub>2</sub>; e

$R^6$  é CF<sub>3</sub>.

Uma outra classe preferida de compostos da fórmula (I) é aquela na qual:

- 5  $R^1$  é CN;  
 $R^2$  é Cl;  
 $R^3$  é  $CF_3$ ;  
W é  $CR^4$  e  $R^4$  é Cl;  
 $m$  é 0;  
 $R^6$  é  $CF_3$ ; e  
i)  $R^5$  é  $CO_2R^{10}$ ;  
10  $R^7$  é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-alquenila ou benzila; e  
 $R^{10}$  é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-alquenila, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila, -(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila, -(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi, benzila ou -CH(CH<sub>3</sub>)fenila; ou  
ii)  $R^5$  é  $CONR^9R^{10}$ ; e  
15  $R^9$  e  $R^{10}$  são, independentemente um do outro, H ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, ou  $R^9$  e  $R^{10}$  juntos com o átomo de N ligado, formam um anel saturado de cinco ou seis membros, que opcionalmente contém um heteroátomo adicional no anel, que é escolhido de O, S e N; e  $R^7$  é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-alquenila, -(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi ou benzila.
- 20 Uma outra classe preferida de compostos da fórmula (I) é aquela na qual:
- $R^1$  é CN;  
 $R^2$  é Cl;  
 $R^3$  é  $CF_3$ ;  
25 W é  $CR^4$  e  $R^4$  é Cl;  
 $m$  é 1 e A é  $CH_2CH_2$ -;  
 $R^6$  é  $CF_3$ ; e  
i)  $R^5$  é  $CO_2R^{10}$ ;  
 $R^7$  é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-alquenila ou benzila; e  
30  $R^{10}$  é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-alquenila, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila, -(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila, -(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi, benzila, -CH(CH<sub>3</sub>)fenila, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil-S(O)<sub>p</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila; ou

(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil; ou

ii) R<sup>5</sup> é CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>; e

R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup> são, independentemente um do outro, H ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, ou R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup>, junto com o átomo de N ligado, formam um anel saturado de cinco ou seis membros, que opcionalmente contém um heteroátomo adicional no anel, que é escolhido de O, S e N; e R<sup>7</sup> é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-alquenila, -(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alcóxi ou benzila.

Uma outra classe preferida de compostos da fórmula (I) é aquela na qual:

10

R<sup>1</sup> é CN;

R<sup>2</sup> é Cl;

R<sup>3</sup> é CF<sub>3</sub>;

W é CR<sup>4</sup> e R<sup>4</sup> é Cl;

m é 1;

15

A é -CH=CH-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>-, 1,2-fenileno, 1,3-fenileno, 1,4-fenileno, 2,6-piridila ou 2,5-piridila;

R<sup>6</sup> é CF<sub>3</sub>;

R<sup>5</sup> é CO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>;

20

R<sup>7</sup> é metila; e

R<sup>10</sup> é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila ou benzila.

Uma outra classe de compostos da fórmula (I) é aquela na qual:

R<sup>1</sup> é CN;

R<sup>2</sup> é Cl;

25

R<sup>3</sup> é CF<sub>3</sub>;

W é CR<sup>4</sup> e R<sup>4</sup> é Cl;

m é 1;

30

A é 1,2-ciclopropila, 1,2-ciclobutila, trans-1,2-ciclopentila, 1,2,2-trimetil-1,3-ciclopentila, 2,3-(5-norbornenila), 1,2-cicloexila, 1,2-cicloexen-1-ila, 1,3-cicloexila ou 1,4-cicloexila;

R<sup>6</sup> é CF<sub>3</sub>;

R<sup>5</sup> é CO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>;

$R^7$  é metila; e

$R^{10}$  é H ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila.

Uma outra classe preferida de compostos da fórmula (I) é aquela na qual:

5  $R^1$  é CN;

$R^2$  é Cl;

$R^3$  é CF<sub>3</sub>;

W é CR<sup>4</sup> e R<sup>4</sup> é Cl;

m é 1;

10 A é -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>) ou -CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>-;

$R^5$  é NR<sup>9</sup>R<sup>17</sup>;

$R^6$  é CF<sub>3</sub>;

$R^7$  é H ou metila;

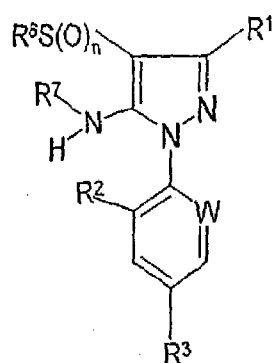
$R^9$  é H ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila; e

15  $R^{17}$  é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, -CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>fenila ou CO(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquila; ou

$R^9$  e  $R^{17}$ , juntos com o átomo de N ligado, formam um anel saturado de cinco ou seis membros, que opcionalmente contém um heteroátomo adicional no anel, que é escolhido de O, S e N, sendo que o anel é não-substituído ou substituído por CO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila.

Os compostos da fórmula geral (I) podem ser preparados pela aplicação ou adaptação de métodos conhecidos (isto é, métodos usados ou descritos anteriormente na literatura química). Deve ser entendido que em determinados casos, o uso de agentes de proteção, bem conhecidos na técnica, pode ser necessário, a fim de obter rendimentos satisfatórios. Na descrição abaixo de processos, quando símbolos que aparecem nas fórmulas não estão especificamente definidos, é entendido que os mesmos são "tais como definidos acima", de acordo com a primeira definição de cada símbolo na especificação.

30 De acordo com um aspecto da invenção, compostos da fórmula (I), nos quais  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , W, A, m e n são tais como definidos acima, podem ser preparados pela acilação de um composto da fórmula (II)



(II)

na qual  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $W$  e  $n$  são tais como definidos acima, com um composto da fórmula (III):



na qual  $R^5$ ,  $A$  e  $m$  são tais como definidos acima e  $L$  é um grupo de saída, tal como halogênio, carboxilato, sulfonato, heterociclo, isto é, compostos da fórmula (III) podem ser haletos de acila, anidridos de carbóxi, ésteres ativos e amidas ativas. Compostos da fórmula (III) podem ser gerados in situ dos ácidos carboxílicos correspondentes ou de seus sais. A reação é realizada, em geral, na presença de uma base, tal como amina terciária, um hidreto, hidróxido, carbonato ou alcoolato de metal alcalino, por exemplo, hidreto de sódio, hidróxido de potássio, carbonato de potássio ou etóxido de sódio, em um solvente, tal como dioxano, tetraidrofurano ou  $N,N$ -dimetilformamida, a uma temperatura de  $0^\circ$  a  $150^\circ C$  (preferivelmente,  $0^\circ$  a  $100^\circ C$ ).

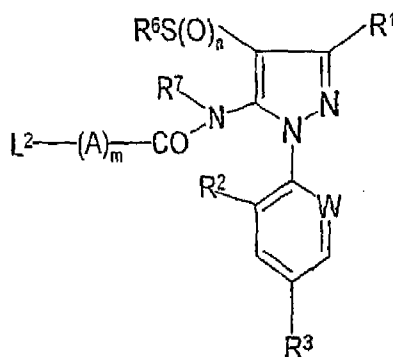
De acordo com um outro aspecto da invenção, compostos da fórmula (I), nos quais  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $W$ ,  $A$ ,  $m$  e  $n$  são tais como definidos acima, e  $R^7$  é tal como definido acima, com a exclusão de hidrogênio, podem ser preparados pela alquilação ou acilação do composto correspondente da fórmula (I), no qual  $R^7$  é hidrogênio, com um composto da fórmula (IV):



no qual  $R^7$  é tal como definido acima, com a exclusão de hidrogênio e  $L^1$  é

um grupo de saída, em geral, halogênio e, preferivelmente, cloro ou iodo. A reação é realizada, em geral, na presença de uma base, tal como hidreto de sódio, em um solvente, tal como dioxano, tetraidrofurano ou N,N-dimetilformamida, a uma temperatura de 0° a 100°C (preferivelmente, 0° a 50°C).

De acordo com um outro aspecto da invenção, compostos da fórmula (I), nos quais  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , W, A, e n são tais como definidos acima,  $R^5$  é  $NR^9R^{10}$  e m é 1, podem ser preparados pela substituição nucleófila de um composto correspondente da fórmula (V):



(V)

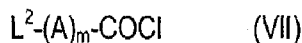
no qual  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , A, W e n são tais como definidos acima, m é 1 e  $L^2$  é um grupo de saída, tal como halogênio (preferivelmente, cloro) ou sulfonato, com um composto da fórmula (VI):



no qual  $R^9$  e  $R^{10}$  são tais como definidos acima. A reação é realizada, em geral, na presença de uma base, tal como uma amina terciária, por exemplo, trietilamina, ou um hidreto metálico, por exemplo, hidreto de sódio, em um solvente, tal como dioxano, tetraidrofurano ou N,N-dimetilformamida, a uma temperatura de 0° a 100°C (preferivelmente, 0° a 50°).

De acordo com um aspecto da invenção, intermediários da fórmula (V), nos quais  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , W, A,  $L^2$ , m e n são tais como definidos acima, podem ser preparados pela acilação de um composto da fórmula (II), usando um composto da fórmula (VII):





no qual  $L^2$ , A e m são tais como definidos acima. A reação é realizada, em geral, de acordo com o procedimento acima para a preparação de compostos da fórmula (I) de compostos das fórmulas (II) e (III).

De acordo com um outro aspecto da invenção, compostos da fórmula (I), nos quais  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , W, A e m são tais como definidos acima, e n é 1 ou 2, podem ser preparados oxidando um composto correspondente, no qual n é 0 ou 1. A oxidação é realizada, em geral, usando um perácido, tal como ácido 3-cloroperbenzóico em um solvente, tal como diclorometano ou 1,2-dicloroetano, a uma temperatura de 0°C à temperatura de refluxo do solvente.

Coleções de compostos da fórmula (I), que podem ser sintetizados pelo processo mencionado acima, também podem ser preparados em um modo paralelo, e isso pode ser efetuado manualmente ou de modo semi-automático ou totalmente automático. Nesse caso, é possível, por exemplo, automatizar o procedimento da reação, acabamento ou purificação dos produtos ou dos intermediários. No total, isso deve ser entendido como significando um procedimento tal como está descrito, por exemplo, por S.H. DeWitt em "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Volume 1, Verlag Escom 1997, páginas 69 a 77.

Uma série de aparelhos comercialmente disponíveis, tal como é oferecida, por exemplo, por Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra, ou H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleissheim, Alemanha ou Radleys Shirehill, Saffron Walden, Essex, Inglaterra, pode ser usada para o procedimento paralelo da reação e acabamento. Para a purificação paralela de compostos da fórmula (I) ou dos intermediários obtidos durante a preparação, pode ser feito uso, entre outros, de aparelhos de cromatografia, por exemplo, os de ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

Os aparelhos mencionados levam a um procedimento modular, no qual as etapas de processo individuais são automatizadas, mas opera-

ções manuais precisam ser realizadas entre as etapas de processo. Isso pode ser evitado usando sistemas de automatização semi-integrados ou totalmente integrados, nos quais os módulos de automatização em questão são operados, por exemplo, por robôs. Esses sistemas de automatização podem ser obtidos, por exemplo, de Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, USA.

Além do que foi descrito aqui, compostos da fórmula (I) podem ser preparados em métodos assistidos em parte ou totalmente por fase sólida. Para esse fim, etapas intermediárias individuais ou todas as etapas intermediárias da síntese ou de uma síntese adaptada para adequar-se ao procedimento em questão, são ligadas a uma resina sintética. Métodos de síntese assistidos por fase sólida estão descritos extensivamente na literatura especializada, por exemplo, Barry A. Bunin em "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998.

O uso de métodos de síntese assistidos por fase sólida permite uma série de protocolos que são conhecidos da literatura e que, por sua vez, podem ser realizados manualmente ou de modo automático. Por exemplo, o "método do saquinho de chá" (Houghten, US 4.631.211; Houghten et al., Proc. Natl. Acad. Sci., 1985, 82, 5131-5135), no qual são usados produtos por IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA, podem ser semi-automatizados. A automatização de sínteses paralelas, assistidas por fase sólida, é realizada com sucesso, por exemplo, por aparelhos de Argonaut Technologies, Inc. 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, USA ou MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454, Witten, Alemanha.

A preparação dos processos descritos no presente fornece compostos da fórmula (I) na forma de coleções de substâncias, que são chamadas de bibliotecas. A presente invenção também se refere a bibliotecas que compreendem pelo menos dois compostos da fórmula (I).

Alguns dos compostos da fórmula (V) são novos e, como tais, formam um outro aspecto da invenção, enquanto os outros compostos da fórmula (V) podem ser preparados por métodos conhecidos.

Compostos das fórmulas (II), (III), (IV), (VI) e (VII) são conheci-

dos e podem ser preparados por métodos conhecidos.

Os seguintes exemplos não-restritivos ilustram a preparação dos compostos da fórmula (I).

Espectros de RMN foram executados em deuteroclorofórmio, a  
5 não ser que indicado de outro modo.

Nos exemplos que se seguem, quantidades (também percentagens) estão baseadas em peso, a não ser que indicado de outro modo.

Os números dos compostos são indicados apenas para fins de referência.

10 Exemplo 1: 1-(2,6-Dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-5-(etoxicarbonil)carbonilamino-4-trifluormetiltiopirazol (Composto número 1-04)

A uma solução de 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-4-trifluormetiltiopirazol (10,0 g, 23,7 mmoles) em tetraidrofurano foram adicionadas trietilamina (3,36 g, 33,2 mmoles) e 4-dimetilaminopiridina  
15 (0,58 g, 4,7 mmoles), seguidas por adição, em gotas, de cloreto de etiloxalila (4,21 g, 30,9 mmoles) em tetraidrofurano, a 50-70°C. A mistura foi aquecida para refluxo por 8 horas. Após o acabamento extrativo (heptano-acetato de etila, água, HCl), o produto do título foi obtido (13,9 g).

Exemplo 2: 1-(2,6-Dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-5-N-(etoxicarbonil)carbonil-N-metilamino-4-trifluormetiltiopirazol (Composto número 1-19)  
20

A uma solução de 1-(2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-5-(etoxicarbonil)carbonilamino-4-trifluormetiltiopirazol (composto 1-04, 2,50 g, 4,8 mmoles) em N,N-dimetilformamida foi adicionado carbonato de potássio (0,80 g, 9,6 mmoles) e iodeto de metila (1,36 g, 5,8 mmoles). A mistura foi  
25 aquecida para 35-40°C por 6 horas. Após o acabamento extrativo, foi obtido o produto do título (2,29 g).

Exemplo 3: 1-(2,6-Dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-5-N-(2-carboxietil)carbonil-N-metilamino-4-trifluormetilsulfinilpirazol (Composto número 3-20)

A uma solução de 1-(2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluormetilsulfinilpirazol (3,0 g, 7,1 mmoles) em tetraidrofurano  
30 foi adicionado hidreto de sódio (60%, 0,32 g, 8,5 mmoles), depois, anidrido succínico (1,00 g, 10,6 mmoles). A mistura foi agitada a 25°C por 36 horas.

Após o acabamento extrativo e cromatografia de coluna com acetato de etila-metanol (95:5), foi obtido o produto do título (0,87 g).

Exemplo 4: 1-(2,6-Dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-5-(2-dietilaminopropionilamino)-4-trifluormetiltiopirazol (Composto número 7-13)

5 A uma solução de 5-(2-cloropropionilamino)-1-(2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-4-trifluormetiltiopirazol (2,0 g, 3,9 mmoles) em tetraidrofurano foram adicionados dietilamina (0,86 g, 11,7 mmoles) e iodeto de sódio (0,59 g, 3,9 mmoles). A mistura foi agitada a 130°C por 30 minutos em um recipiente fechado em um forno de microondas. Após o acabamento  
10 extrativo e cromatografia de coluna com heptano-acetato de etila (2:1), foi obtido o produto do título (0,71 g).

Exemplo 5: 1-(2,6-Dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-5-[3-(benziloxicarbonil-amino)-propionilamino]-4-trifluormetiltiopirazol (Composto número 7-50)

A uma solução de 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-  
15 ciano-4-trifluormetilsulfonilpirazol (1,0 g, 2,29 mmoles) em dioxano, foram adicionadas benziloxicarbonil-beta-alanina (0,56 g, 2,5 mmoles), dicicloexilcarbodiimida (0,61 g, 2,9 mmoles) e 4-dimetilaminopiridina (0,06 g, 0,46 mmol). A mistura foi agitada a 25°C por 4 horas. Após o acabamento extrativo (acetato de etila-água) e cromatografia de coluna com heptano-acetato de  
20 etila (1:1), foi obtido o produto do título (0,81 g).

Exemplo 6: 1-(2,6-Dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-5-(3-N-piperidinilpropionilamino)-4-trifluormetiltiopirazol (Composto número 7-73)

A uma solução de 3-cloropropionilamino-1-(2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-4-trifluormetiltiopirazol (0,8 g, 1,6 mmol) em tetraidrofurano  
25 no foi adicionada piperidina (0,32 g, 3,8 mmoles). A mistura foi aquecida para refluxo por 6 horas. Após o acabamento extrativo e cromatografia de coluna com heptano-acetato de etila (1:1), foi obtido o produto do título (0,80 g).

Os seguintes exemplos de intermediários ilustram a preparação  
30 de intermediários usados na síntese dos exemplos acima.

Exemplo de intermediário 1: 5-(2-Cloropropionilamino)-1-(2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-4-trifluormetiltiopirazol

A uma mistura de 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-4-trifluormetiltiopirazol (8,0 g, 19,0 mmoles) em tolueno foi adicionado  
 5 cloreto de 2-cloropropionila (3,62 g, 28,5 mmoles), depois, cloreto de zinco (0,77 g, 5,7 mmoles). A mistura foi aquecida para refluxo por 16 horas. Após o acabamento extrativo e recristalização com heptano-acetato de etila (1:1), foi obtido o produto do título (7,02 g), 19F-RMN: -43,7; -64,2 ppm.

Exemplo de intermediário 2: 3-Cloropropionilamino-1-(2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-4-trifluormetiltiopirazol

A uma mistura de 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil)-3-ciano-4-trifluormetiltiopirazol (10,0 g, 19,0 mmoles) em tolueno foi adicionado  
 15 cloreto de 3-cloropropionila (3,92 g, 30,9 mmoles), depois, cloreto de zinco (0,97 g, 7,1 mmoles). A mistura foi aquecida para refluxo por 4 horas. Após o acabamento extrativo e recristalização com heptano-acetato de etila (1:1), foi obtido o produto do título (9,05 g), 19F-RMN: -43,3; -63,7 ppm.

Os seguintes compostos preferidos mostrados nas Tabelas 1 a 8 também fazem parte da presente invenção, e foram ou podem ser preparados de acordo com, ou analogamente a, os Exemplos 1 a 6 acima mencionados ou os métodos gerais descritos acima. Quando subscritos são omitidos depois de átomos, fica entendido que eles estão subentendidos, por exemplo, CH3 significa CH<sub>3</sub>.

Nas tabelas, Et significa etila; i-Pr significa isopropila; t-Bu significa terc-butila; Ph significa fenila; cC3H5 significa ciclopropila; cC6H11 significa cicloexila; C2H4OMe significa 2-metoxietila; C3H6 significa propileno (-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-); C3H6CL significa 3-cloropropila; e 1,2-C6H4 significa fenila, que está ligada aos grupos R<sup>5</sup> e CONR<sup>7</sup> nas posições 1 e 7 (isto é, 1,2-fenileno).

Quando A é mostrado, o carbono no lado esquerdo de A está ligado a R<sup>5</sup>.

30 Z- e E- referem-se, respectivamente, aos isômeros cis e trans.

Valores de mudança de espectro de 19F-RMN são dados em ppm.

Tabela 1: Compostos da fórmula (I), nos quais os substituintes têm os seguintes significados:

$R^1 = \text{CN}$ ,  $R^2 = \text{Cl}$ ,  $W = \text{CR}^4$  e  $R^4 = \text{Cl}$ ,  $R^3 = \text{CF}_3$ ,  $R^6$  é  $\text{CF}_3$ ,  $m=0$ .

Composto número	$R^1$	$R^5$	n	pf. °C, RMN(ppm)
1- 01	H	COOMe	0	
1- 02	H	COOMe	1	$^{19}\text{F}$ : -63,8; -73,5
1- 03	H	COOMe	2	
1- 04	H	COOEt	0	$^{19}\text{F}$ : -43,3; -63,8
1- 05	H	COOEt	1	$^{19}\text{F}$ : -63,8; -73,4
1- 06	H	COOEt	2	
1- 07	H	COOnPr	0	
1- 08	H	COOnPr	1	
1- 09	H	COOnPr	2	
1- 10	H	COOnBu	0	
1- 11	H	COOnBu	1	
1- 12	H	COOnBu	2	
1- 13	H	COOCH <sub>2</sub> Ph	0	
1- 14	H	COOCH <sub>2</sub> Ph	1	
1- 15	H	COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
1- 16	Me	COOMe	0	$^{19}\text{F}$ : -42,7; -63,8
1- 17	Me	COOMe	1	$^{19}\text{F}$ : -64,0; -72,4
1- 18	Me	COOMe	2	
1- 19	Me	COOEt	0	$^{19}\text{F}$ : -42,7; -63,9
1- 20	Me	COOEt	1	$^{19}\text{F}$ : -64,0; -72,3-7
1- 21	Me	COOEt	2	
1- 22	Me	COOnPr	0	
1- 23	Me	COOnPr	1	pf. 124°C
1- 24	Me	COOnPr	2	
1- 25	Me	COOPr	0	

Composto número	R'	R <sup>o</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
1- 26	Me	COOiPr	1	19F:-63,9;-72,2-73,4
1- 27	Me	COOiPr	2	
1- 28	Me	COOnBu	0	
1- 29	Me	COOnBu	1	19F:-63,9;-72,2-73,4
1- 30	Me	COOnBu	2	
1- 31	Me	COOCH(Me)Et	0	
1- 32	Me	COOCH(Me)Et	1	
1- 33	Me	COOCH(Me)Et	2	
1- 34	Me	COOiBu	0	
1- 35	Me	COOiBu	1	
1- 36	Me	COOiBu	2	
1- 37	Me	COOtBu	0	
1- 38	Me	COOtBu	1	
1- 39	Me	COOtBu	2	
1- 40	Me	COOnC5H11	0	
1- 41	Me	COOnC5H11	1	
1- 42	Me	COOnC5H11	2	
1- 43	Me	COOCH2tBu	0	
1- 44	Me	COOCH2tBu	1	
1- 45	Me	COOCH2tBu	2	
1- 46	Me	COOnC6H13	0	
1- 47	Me	COOnC6H13	1	
1- 48	Me	COOnC6H13	2	
1- 49	Me	COOCH2CH=CH2	0	
1- 50	Me	COOCH2CH=CH2	1	
1- 51	Me	COOCH2CH=CH2	2	
1- 52	Me	COOcC5H9	0	
1- 53	Me	COOcC5H9	1	
1- 54	Me	COOcC5H9	2	
1- 55	Me	COOcC6H13	0	
1- 56	Me	COOcC6H13	1	
1- 57	Me	COOcC6H13	2	
1- 58	Me	COOCH2cC3H5	0	
1- 59	Me	COOCH2cC3H5	1	
1- 60	Me	COOCH2cC3H5	2	
1- 61	Me	COOCH2cC6H11	0	
1- 62	Me	COOCH2cC6H11	1	
1- 63	Me	COOCH2cC6H11	2	
1- 64	Me	COOC3H6Cl	0	
1- 65	Me	COOC3H6Cl	1	
1- 66	Me	COOC3H6Cl	2	

Composto número	R'	R <sup>s</sup>	n	pf. °C, RMN (ppm)
1- 67	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OMe	0	
1- 68	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OMe	1	
1- 69	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OMe	2	
1- 70	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OEt	0	
1- 71	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OEt	1	
1- 72	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OEt	2	
1- 73	Me	COOCH <sub>2</sub> Ph	0	
1- 74	Me	COOCH <sub>2</sub> Ph	1	
1- 75	Me	COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
1- 76	Me	COOCH(Me)Ph	0	
1- 77	Me	COOCH(Me)Ph	1	
1- 78	Me	COOCH(Me)Ph	2	
1- 79	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> Ph	0	
1- 80	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> Ph	1	
1- 81	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> Ph	2	
1- 82	Me	COOH	0	
1- 83	Me	COOH	1	
1- 84	Me	COOH	2	
1- 85	Et	COOMe	0	
1- 86	Et	COOMe	1	
1- 87	Et	COOMe	2	
1- 88	Et	COOEt	0	19F: -42,4; -63,9
1- 89	Et	COOEt	1	
1- 90	Et	COOEt	2	
1- 91	CH <sub>2</sub> Ph	COOMe	0	
1- 92	CH <sub>2</sub> Ph	COOMe	1	
1- 93	CH <sub>2</sub> Ph	COOMe	2	
1- 94	Alila	COOMe	0	
1- 95	Alila	COOMe	1	
1- 96	Alila	COOMe	2	
1- 97	Alila	COOEt	0	
1- 98	Alila	COOEt	1	
1- 99	Alila	COOEt	2	
1- 100	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> SMe	COOEt	2	19F: -64,3; -78,6
1- 101	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> SMe	COOEt	2	19F: -64,3; -78,6



Tabela 2: Compostos da fórmula (I), nos quais os substituintes têm os seguintes significados:

$R^1 = \text{CN}$ ,  $R^2 = \text{Cl}$ ,  $W = \text{CR}^4$  e  $R^4 = \text{Cl}$ ,  $R^3 = \text{CF}_3$ ,  $R^6$  é  $\text{CF}_3$ ,  $m=0$ .

Composto número	$R^1$	$R^5$	n	pf. °C, RMN(ppm)
2- 01	H	CONH2	0	
2- 02	H	CONH2	1	
2- 03	H	CONH2	2	
2- 04	H	CONHMe	0	
2- 05	H	CONHMe	1	
2- 06	H	CONHMe	2	
2- 07	H	CONHEt	0	
2- 08	H	CONHEt	1	
2- 09	H	CONHEt	2	
2- 10	H	CONHnPr	0	
2- 11	H	CONHnPr	1	
2- 12	H	CONHnPr	2	
2- 13	H	CONHiPr	0	
2- 14	H	CONHiPr	1	
2- 15	H	CONHiPr	2	
2- 16	H	CONHnBu	0	19F: -43,6; -64,2
2- 17	H	CONHnBu	1	
2- 18	H	CONHnBu	2	
2- 19	H	CONMe2	0	
2- 20	H	CONMe2	1	
2- 21	H	CONMe2	2	
2- 22	H	CONEt2	0	19F: -43,7; -64,2
2- 23	H	CONEt2	1	
2- 24	H	CONEt2	2	
2- 25	H	CONnPr2	0	
2- 26	H	CONnPr2	1	
2- 27	H	CONnPr2	2	
2- 28	H	CONnBu2	0	
2- 29	H	CONnBu2	1	
2- 30	H	CONnBu2	2	
2- 31	H	CO-N-pirrolidina	0	
2- 32	H	CO-N-pirrolidina	1	
2- 33	H	CO-N-pirrolidina	2	
2- 34	H	CO-N-piperidinila	0	
2- 35	H	CO-N-piperidinila	1	
2- 36	H	CO-N-piperidinila	2	
2- 37	H	CO-N-morfolinila	0	
2- 38	H	CO-N-morfolinila	1	
2- 39	H	CO-N-morfolinila	2	
2- 40	H	CO-N-4-Me-piperazinila	0	
2- 41	H	CO-N-4-Me-piperazinila	1	

Composto número	R <sup>7</sup>	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
2- 42	H	CO-N-4-Me-piperazinila	2	
2- 43	Me	CONH <sub>2</sub>	0	
2- 44	Me	CONH <sub>2</sub>	1	
2- 45	Me	CONH <sub>2</sub>	2	
2- 46	Me	CONHMe	0	
2- 47	Me	CONHMe	1	
2- 48	Me	CONHMe	2	
2- 49	Me	CONHEt	0	
2- 50	Me	CONHEt	1	
2- 51	Me	CONHEt	2	
2- 52	Me	CONHnPr	0	
2- 53	Me	CONHnPr	1	
2- 54	Me	CONHnPr	2	
2- 55	Me	CONHiPr	0	
2- 56	Me	CONHiPr	1	
2- 57	Me	CONHiPr	2	
2- 58	Me	CONHnBu	0	
2- 59	Me	CONHnBu	1	
2- 60	Me	CONHnBu	2	
2- 61	Me	CONMe <sub>2</sub>	0	
2- 62	Me	CONMe <sub>2</sub>	1	
2- 63	Me	CONMe <sub>2</sub>	2	
2- 64	Me	CONEt <sub>2</sub>	0	19F: 43,2; -64,2
2- 65	Me	CONEt <sub>2</sub>	1	19F: 63,8; -72,6
2- 66	Me	CONEt <sub>2</sub>	2	
2- 67	Me	CONnPr <sub>2</sub>	0	
2- 68	Me	CONnPr <sub>2</sub>	1	19F: 63,8; -72,6
2- 69	Me	CONnPr <sub>2</sub>	2	
2- 70	Me	CONnBu <sub>2</sub>	0	
2- 71	Me	CONnBu <sub>2</sub>	1	
2- 72	Me	CONnBu <sub>2</sub>	2	
2- 73	Me	CO-N-pirrolidinila	0	
2- 74	Me	CO-N-pirrolidinila	1	19F: 64,3; -72,9
2- 75	Me	CO-N-pirrolidinila	2	
2- 76	Me	CO-N-piperidinila	0	
2- 77	Me	CO-N-piperidinila	1	19F: 64,2; -73,0
2- 78	Me	CO-N-piperidinila	2	
2- 79	Me	CO-N-morfolinila	0	
2- 80	Me	CO-N-morfolinila	1	
2- 81	Me	CO-N-morfolinila	2	
2- 82	Me	CO-N-4-Me-piperazinila	0	

Composto número	R <sup>7</sup>	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
2- 83	Me	CO-N-4-Me-piperazinila	1	
2- 84	Me	CO-N-4-Me- piperazinila	2	
2- 85	Et	CONMe <sub>2</sub>	0	
2- 86	Et	CONMe <sub>2</sub>	1	
2- 87	Et	CONMe <sub>2</sub>	2	
2- 88	Et	CONEt <sub>2</sub>	0	
2- 89	Et	CONEt <sub>2</sub>	1	
2- 90	Et	CONEt <sub>2</sub>	2	
2- 91	CH <sub>2</sub> OMe	CONEt <sub>2</sub>	0	
2- 92	CH <sub>2</sub> OMe	CONEt <sub>2</sub>	1	
2- 93	CH <sub>2</sub> OMe	CONEt <sub>2</sub>	2	
2- 94	CH <sub>2</sub> Ph	CONEt <sub>2</sub>	0	
2- 95	CH <sub>2</sub> Ph	CONEt <sub>2</sub>	1	
2- 96	CH <sub>2</sub> Ph	CONEt <sub>2</sub>	2	
2- 97	Alila	CONEt <sub>2</sub>	0	
2- 98	Alila	CONEt <sub>2</sub>	1	
2- 99	Alila	CONEt <sub>2</sub>	2	
2- 100	nPr	CONEt <sub>2</sub>	0	
2- 101	nPr	CONEt <sub>2</sub>	1	
2- 102	nPr	CONEt <sub>2</sub>	2	

Tabela 3: Compostos da fórmula (I), nos quais os substituintes têm os seguintes significados:

R<sup>1</sup> = CN, R<sup>2</sup> = Cl, W = CR<sup>4</sup> e R<sup>4</sup> = Cl, R<sup>3</sup> = CF<sub>3</sub>, R<sup>6</sup> é CF<sub>3</sub>, m=1, A = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>

Composto número	R <sup>7</sup>	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
3- 01	H	COOH	0	
3- 02	H	COOH	1	
3- 03	H	COOH	2	
3- 04	H	COOMe	0	
3- 05	H	COOMe	1	
3- 06	H	COOMe	2	
3- 07	H	COOEt	0	
3- 08	H	COOEt	1	
3- 09	H	COOEt	2	
3- 10	H	COOnPr	0	
3- 11	H	COOnPr	1	
3- 12	H	COOnPr	2	
3- 13	H	COOnBu	0	

Composto número	R'	R <sup>o</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
3- 14	H	COOnBu	1	
3- 15	H	COOnBu	2	
3- 16	H	COOCH <sub>2</sub> Ph	0	
3- 17	H	COOCH <sub>2</sub> Ph	1	
3- 18	H	COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
3- 19	Me	COOH	0	
3- 20	Me	COOH	1	19F: 63,7; -72,2
3- 21	Me	COOH	2	
3- 22	Me	COOMe	0	
3- 23	Me	COOMe	1	19F: -63,8; -72,3
3- 24	Me	COOMe	2	
3- 25	Me	COOEt	0	
3- 26	Me	COOEt	1	19F: -63,9; -72,3
3- 27	Me	COOEt	2	
3- 28	Me	COOnPr	0	
3- 29	Me	COOnPr	1	
3- 30	Me	COOnPr	2	
3- 31	Me	COOiPr	0	
3- 32	Me	COOiPr	1	
3- 33	Me	COOiPr	2	
3- 34	Me	COOnBu	0	
3- 35	Me	COOnBu	1	19F: -63,8; -72,3
3- 36	Me	COOnBu	2	
3- 37	Me	COOCH(Me)Et	0	
3- 38	Me	COOCH(Me)Et	1	
3- 39	Me	COOCH(Me)Et	2	
3- 40	Me	COOiBu	0	
3- 41	Me	COOiBu	1	
3- 42	Me	COOiBu	2	
3- 43	Me	COOtBu	0	
3- 44	Me	COOtBu	1	
3- 45	Me	COOtBu	2	
3- 46	Me	COOnC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	0	
3- 47	Me	COOnC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	1	
3- 48	Me	COOnC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	2	
3- 49	Me	COOCH <sub>2</sub> tBu	0	
3- 50	Me	COOCH <sub>2</sub> tBu	1	
3- 51	Me	COOCH <sub>2</sub> tBu	2	
3- 52	Me	COOnC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	0	
3- 53	Me	COOnC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	1	
3- 54	Me	COOnC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	2	

Composto número	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
3- 55	Me	COOCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	0	
3- 56	Me	COOCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	1	
3- 57	Me	COOCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	2	
3- 58	Me	COOCC <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	0	
3- 59	Me	COOCC <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	1	
3- 60	Me	COOCC <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	2	
3- 61	Me	COOCC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	0	
3- 62	Me	COOCC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	1	
3- 63	Me	COOCC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	2	
3- 64	Me	COOCH <sub>2</sub> cC <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	0	
3- 65	Me	COOCH <sub>2</sub> cC <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	1	
3- 66	Me	COOCH <sub>2</sub> cC <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	2	
3- 67	Me	COOCH <sub>2</sub> cC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	0	
3- 68	Me	COOCH <sub>2</sub> cC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	1	
3- 69	Me	COOCH <sub>2</sub> cC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	2	
3- 70	Me	COOC <sub>3</sub> H <sub>6</sub> Cl	0	
3- 71	Me	COOC <sub>3</sub> H <sub>6</sub> Cl	1	
3- 72	Me	COOC <sub>3</sub> H <sub>6</sub> Cl	2	
3- 73	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OMe	0	
3- 74	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OMe	1	
3- 75	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OMe	2	
3- 76	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OEt	0	
3- 77	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OEt	1	
3- 78	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OEt	2	
3- 79	Me	COOCH <sub>2</sub> Ph	0	
3- 80	Me	COOCH <sub>2</sub> Ph	1	
3- 81	Me	COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
3- 82	Me	COOCH(Me)Ph	0	
3- 83	Me	COOCH(Me)Ph	1	
3- 84	Me	COOCH(Me)Ph	2	
3- 85	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> Ph	0	
3- 86	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> Ph	1	
3- 87	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> Ph	2	
3- 88	Et	COOMe	0	
3- 89	Et	COOMe	1	
3- 90	Et	COOMe	2	
3- 91	Et	COOEt	0	
3- 92	Et	COOEt	1	
3- 93	Et	COOEt	2	
3- 94	CH <sub>2</sub> Ph	COOMe	0	
3- 95	CH <sub>2</sub> Ph	COOMe	1	

Composto número	R <sup>7</sup>	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
3- 96	CH <sub>2</sub> Ph	COOMe	2	
3- 97	Alila	COOMe	0	
3- 98	Alila	COOMe	1	
3- 99	Alila	COOMe	2	
3- 100	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> NMe <sub>2</sub>	0	
3- 101	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> NMe <sub>2</sub>	1	
3- 102	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> NMe <sub>2</sub>	2	
3- 103	Me	COO(C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O) <sub>2</sub> Me	0	
3- 104	Me	COO(C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O) <sub>2</sub> Me	1	
3- 105	Me	COO(C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O) <sub>2</sub> Me	2	
3- 100	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> SMe	0	
3- 101	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> SMe	1	19F: -64,2; -72,8
3- 102	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> SMe	2	
3- 103	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> SOMe	0	
3- 104	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> SOMe	1	
3- 105	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> SOMe	2	
3- 106	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> Me	0	
3- 107	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> Me	1	
3- 108	Me	COOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> SO <sub>2</sub> Me	2	
3- 109	Me	COO(C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O) <sub>2</sub> Me	0	
3- 110	Me	COO(C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O) <sub>2</sub> Me	1	19F: -63,8; -72,3
3- 111	Me	COO(C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O) <sub>2</sub> Me	2	

Tabela 4: Compostos da fórmula (I), nos quais os substituintes têm os seguintes significados:

R<sup>1</sup> = CN, R<sup>2</sup> = Cl, W = CR<sup>4</sup> e R<sup>4</sup> = Cl, R<sup>3</sup> = CF<sub>3</sub>, R<sup>6</sup> é CF<sub>3</sub>, m=1, A = CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>

Composto número	R <sup>7</sup>	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
4- 01	H	CONH <sub>2</sub>	0	
4- 02	H	CONH <sub>2</sub>	1	
4- 03	H	CONH <sub>2</sub>	2	
4- 04	H	CONHMe	0	
4- 05	H	CONHMe	1	
4- 06	H	CONHMe	2	
4- 07	H	CONHEt	0	
4- 08	H	CONHEt	1	
4- 09	H	CONHEt	2	
4- 10	H	CONHnPr	0	
4- 11	H	CONHnPr	1	

Composto número	R'	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
4- 12	H	CONHnPr	2	
4- 13	H	CONHiPr	0	
4- 14	H	CONHiPr	1	
4- 15	H	CONHiPr	2	
4- 16	H	CONHnBu	0	
4- 17	H	CONHnBu	1	
4- 18	H	CONHnBu	2	
4- 19	H	CONMe <sub>2</sub>	0	
4- 20	H	CONMe <sub>2</sub>	1	
4- 21	H	CONMe <sub>2</sub>	2	
4- 22	H	CONEt <sub>2</sub>	0	<sup>19</sup> F: -43,9; -63,7
4- 23	H	CONEt <sub>2</sub>	1	<sup>19</sup> F: -63,8; -72,0
4- 24	H	CONEt <sub>2</sub>	2	
4- 25	H	CONnPr <sub>2</sub>	0	
4- 26	H	CONnPr <sub>2</sub>	1	
4- 27	H	CONnPr <sub>2</sub>	2	
4- 28	H	CONnBu <sub>2</sub>	0	
4- 29	H	CONnBu <sub>2</sub>	1	
4- 30	H	CONnBu <sub>2</sub>	2	
4- 31	H	CO-N-pirrolidinila	0	
4- 32	H	CO-N-pirrolidinila	1	
4- 33	H	CO-N-pirrolidinila	2	
4- 34	H	CO-N-piperidinila	0	
4- 35	H	CO-N-piperidinila	1	
4- 36	H	CO-N-piperidinila	2	
4- 37	H	CO-N-morfolinila	0	
4- 38	H	CO-N-morfolinila	1	
4- 39	H	CO-N-morfolinila	2	
4- 40	H	CO-N-4-Me-piperazinila	0	
4- 41	H	CO-N-4-Me-piperazinila	1	
4- 42	H	CO-N-4-Me-piperazinila	2	
4- 43	Me	CONH <sub>2</sub>	0	
4- 44	Me	CONH <sub>2</sub>	1	
4- 45	Me	CONH <sub>2</sub>	2	
4- 46	Me	CONHMe	0	
4- 47	Me	CONHMe	1	
4- 48	Me	CONHMe	2	
4- 49	Me	CONHEt	0	
4- 50	Me	CONHEt	1	
4- 51	Me	CONHEt	2	
4- 52	Me	CONHnPr	0	

Composto número	R'	R <sup>o</sup>	n	pf. °C, RMN (ppm)
4- 53	Me	CONHnPr	1	
4- 54	Me	CONHnPr	2	
4- 55	Me	CONHiPr	0	
4- 56	Me	CONHiPr	1	
4- 57	Me	CONHiPr	2	
4- 58	Me	CONHnBu	0	
4- 59	Me	CONHnBu	1	
4- 60	Me	CONHnBu	2	
4- 61	Me	CONMe2	0	
4- 62	Me	CONMe2	1	19F: -63,7; -72,2
4- 63	Me	CONMe2	2	
4- 64	Me	CONEt2	0	
4- 65	Me	CONEt2	1	
4- 66	Me	CONEt2	2	
4- 67	Me	CONnPr2	0	
4- 68	Me	CONnPr2	1	
4- 69	Me	CONnPr2	2	
4- 70	Me	CONnBu2	0	
4- 71	Me	CONnBu2	1	
4- 72	Me	CONnBu2	2	
4- 73	Me	CO-N-pirrolidinila	0	
4- 74	Me	CO-N-pirrolidinila	1	
4- 75	Me	CO-N-pirrolidinila	2	
4- 76	Me	CO-N-piperidinila	0	
4- 77	Me	CO-N-piperidinila	1	
4- 78	Me	CO-N-piperidinila	2	
4- 79	Me	CO-N-morfolinila	0	
4- 80	Me	CO-N-morfolinila	1	
4- 81	Me	CO-N-morfolinila	2	
4- 82	Me	CO-N-4-Me-piperazinila	0	
4- 83	Me	CO-N-4-Me-piperazinila	1	
4- 84	Me	CO-N-4-Me-piperazinila	2	
4- 85	Et	CONMe2	0	
4- 86	Et	CONMe2	1	
4- 87	Et	CONMe2	2	
4- 88	Et	CONEt2	0	
4- 89	Et	CONEt2	1	
4- 90	Et	CONEt2	2	
4- 91	CH2OMe	CONEt2	0	
4- 92	CH2OMe	CONEt2	1	
4- 93	CH2OMe	CONEt2	2	



Composto número	R <sup>7</sup>	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
4- 94	CH <sub>2</sub> Ph	CONEt <sub>2</sub>	0	
4- 95	CH <sub>2</sub> Ph	CONEt <sub>2</sub>	1	
4- 96	CH <sub>2</sub> Ph	CONEt <sub>2</sub>	2	
4- 97	Alila	CONEt <sub>2</sub>	0	
4- 98	Alila	CONEt <sub>2</sub>	1	
4- 99	Alila	CONEt <sub>2</sub>	2	
4- 100	nPr	CONEt <sub>2</sub>	0	
4- 101	nPr	CONEt <sub>2</sub>	1	
4- 102	nPr	CONEt <sub>2</sub>	2	

Tabela 5: Compostos da fórmula (I), nos quais os substituintes têm os seguintes significados:

R<sup>1</sup> = CN, R<sup>2</sup> = Cl, W = CR<sup>4</sup> e R<sup>4</sup> = Cl, R<sup>3</sup> = CF<sub>3</sub>, R<sup>6</sup> é CF<sub>3</sub>, m=1, R<sup>7</sup> = Me

Composto número	A	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
5- 01	Z- CH=CH	COOH	0	
5- 02	Z- CH=CH	COOH	1	
5- 03	Z- CH=CH	COOH	2	
5- 04	Z- CH=CH	COOMe	0	
5- 05	Z- CH=CH	COOMe	1	
5- 06	Z- CH=CH	COOMe	2	
5- 07	Z- CH=CH	COOEt	0	
5- 08	Z- CH=CH	COOEt	1	
5- 09	Z- CH=CH	COOEt	2	
5- 10	Z- CH=CH	COOnPr	0	
5- 11	Z- CH=CH	COOnPr	1	
5- 12	Z- CH=CH	COOnPr	2	
5- 13	Z- CH=CH	COOnBu	0	
5- 14	Z- CH=CH	COOnBu	1	
5- 15	Z- CH=CH	COOnBu	2	
5- 16	Z- CH=CH	COOCH <sub>2</sub> Ph	0	
5- 17	Z- CH=CH	COOCH <sub>2</sub> Ph	1	
5- 18	Z- CH=CH	COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
5- 19	E- CH=CH	COOH	0	
5- 20	E- CH=CH	COOH	1	
5- 21	E- CH=CH	COOH	2	
5- 22	E- CH=CH	COOMe	0	
5- 23	E- CH=CH	COOMe	1	
5- 24	E- CH=CH	COOMe	2	

Composto número	A	R <sup>5</sup>	n	pf.°C, RMN(ppm)
5- 25	E- CH=CH	COOEt	0	
5- 26	E- CH=CH	COOEt	1	19F: -64,3; -72,7
5- 27	E- CH=CH	COOEt	2	
5- 28	E- CH=CH	COOnPr	0	
5- 29	E- CH=CH	COOnPr	1	
5- 30	E- CH=CH	COOnPr	2	
5- 31	E- CH=CH	COOnBu	0	
5- 32	E- CH=CH	COOnBu	1	
5- 33	E- CH=CH	COOnBu	2	
5- 34	E- CH=CH	COOCH <sub>2</sub> Ph	0	
5- 35	E- CH=CH	COOCH <sub>2</sub> Ph	1	
5- 36	E- CH=CH	COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
5- 37	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOH	0	
5- 38	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOH	1	
5- 39	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOH	2	
5- 40	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOMe	0	
5- 41	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOMe	1	
5- 42	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOMe	2	
5- 43	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOEt	0	
5- 44	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOEt	1	19F: -64,3; -72,7
5- 45	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOEt	2	
5- 46	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOnPr	0	
5- 47	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOnPr	1	
5- 48	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOnPr	2	
5- 49	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOnBu	0	
5- 50	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOnBu	1	
5- 51	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOnBu	2	
5- 52	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOCH <sub>2</sub> Ph	0	
5- 53	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOCH <sub>2</sub> Ph	1	
5- 54	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub>	COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
5- 55	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOH	0	
5- 56	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOH	1	
5- 57	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOH	2	
5- 58	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOMe	0	
5- 59	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOMe	1	
5- 60	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOMe	2	
5- 61	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOEt	0	
5- 62	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOEt	1	
5- 63	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOEt	2	
5- 64	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOnPr	0	
5- 65	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOnPr	1	

Composto número	A	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
5-66	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOnPr	2	
5-67	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOnBu	0	
5-68	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOnBu	1	
5-69	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOnBu	2	
5-70	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOCH <sub>2</sub> Ph	0	
5-71	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOCH <sub>2</sub> Ph	1	
5-72	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub>	COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
5-73	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>	COOH	0	
5-74	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>	COOH	1	19F: -63,7; -72,1
5-75	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>	COOH	2	
5-76	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>	COOMe	0	
5-77	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>	COOMe	1	
5-78	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>	COOMe	2	
5-79	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>	COOEt	0	
5-80	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>	COOEt	1	
5-81	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub>	COOEt	2	
5-82	CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub>	COOH	0	
5-83	CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub>	COOH	1	
5-84	CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub>	COOH	2	
5-85	CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub>	COOMe	0	
5-86	CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub>	COOMe	1	
5-87	CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub>	COOMe	2	
5-88	CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub>	COOEt	0	
5-89	CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub>	COOEt	1	
5-90	CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub>	COOEt	2	
5-91	1,2-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOH	0	
5-92	1,2-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOH	1	
5-93	1,2-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOH	2	
5-94	1,2-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOMe	0	
5-95	1,2-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOMe	1	19F: -64,1; -73,1
5-96	1,2-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOMe	2	
5-97	1,2-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOEt	0	
5-98	1,2-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOEt	1	
5-99	1,2-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOEt	2	
5-100	1,3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOH	0	
5-101	1,3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOH	1	19F: -64,3; -72,2
5-102	1,3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOH	2	
5-103	1,3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOMe	0	
5-104	1,3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOMe	1	19F: -63,8; -71,7
5-105	1,3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOMe	2	
5-106	1,3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOEt	0	

Composto número	A	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
5- 107	1,3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOEt	1	
5- 108	1,3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOEt	2	
5- 109	1,4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOH	0	
5- 110	1,4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOH	1	19F: -63,8; -71,9
5- 111	1,4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOH	2	
5- 112	1,4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOMe	0	
5- 113	1,4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOMe	1	19F: -64,2; -72,3
5- 114	1,4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOMe	2	
5- 115	1,4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOEt	0	
5- 116	1,4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOEt	1	
5- 117	1,4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	COOEt	2	
5- 118	2,6-piridila	COOH	0	
5- 119	2,6-piridila	COOH	1	
5- 120	2,6-piridila	COOH	2	
5- 121	2,6-piridila	COOMe	0	
5- 122	2,6-piridila	COOMe	1	19F: -64,3; -73,9
5- 123	2,6-piridila	COOMe	2	
5- 124	2,6-piridila	COOEt	0	
5- 125	2,6-piridila	COOEt	1	
5- 126	2,6-piridila	COOEt	2	
5- 127	2,5-piridila	COOH	0	
5- 128	2,5-piridila	COOH	1	
5- 129	2,5-piridila	COOH	2	
5- 130	2,5-piridila	COOMe	0	
5- 131	2,5-piridila	COOMe	1	19F: -64,3; -72,4
5- 132	2,5-piridila	COOMe	2	
5- 133	2,5-piridila	COOEt	0	
5- 134	2,5-piridila	COOEt	1	
5- 135	2,5-piridila	COOEt	2	

Tabela 6: Compostos da fórmula (I), nos quais os substituintes têm os seguintes significados:

R<sup>1</sup> = CN, R<sup>2</sup> = Cl, W = CR<sup>4</sup> e R<sup>4</sup> = Cl, R<sup>3</sup> = CF<sub>3</sub>, R<sup>6</sup> é CF<sub>3</sub>, m=1, R<sup>7</sup> = Me

Composto número	A	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
6- 01	1,2- ciclopropila	COOH	0	
6- 02	1,2- ciclopropila	COOH	1	
6- 03	1,2- ciclopropila	COOH	2	
6- 04	1,2- ciclopropila	COOMe	0	

Composto número	A	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
6- 05	1,2-ciclopropila	COOMe	1	
6- 06	1,2-ciclopropila	COOMe	2	
6- 07	1,2-ciclopropila	COOEt	0	
6- 08	1,2-ciclopropila	COOEt	1	
6- 09	1,2-ciclopropila	COOEt	2	
6- 10	1,2-ciclobutila	COOH	0	
6- 11	1,2-ciclobutila	COOH	1	
6- 12	1,2-ciclobutila	COOH	2	
6- 13	1,2-ciclobutila	COOMe	0	
6- 14	1,2-ciclobutila	COOMe	1	
6- 15	1,2-ciclobutila	COOMe	2	
6- 16	1,2-ciclobutila	COOEt	0	
6- 17	1,2-ciclobutila	COOEt	1	
6- 18	1,2-ciclobutila	COOEt	2	
6- 19	trans-1,2-ciclopentila	COOH	0	
6- 20	trans-1,2-ciclopentila	COOH	1	
6- 21	trans-1,2-ciclopentila	COOH	2	
6- 22	trans-1,2-ciclopentila	COOMe	0	
6- 23	trans-1,2-ciclopentila	COOMe	1	
6- 24	trans-1,2-ciclopentila	COOMe	2	
6- 25	trans-1,2-ciclopentila	COOEt	0	
6- 26	trans-1,2-ciclopentila	COOEt	1	
6- 27	trans-1,2-ciclopentila	COOEt	2	
6- 28	1,2,2- trimetil -1,3-ciclopentila	COOH	0	
6- 29	1,2,2- trimetil -1,3-ciclopentila	COOH	1	
6- 30	1,2,2- trimetil -1,3-ciclopentila	COOH	2	
6- 31	1,2,2- trimetil -1,3-ciclopentila	COOMe	0	
6- 32	1,2,2- trimetil -1,3-ciclopentila	COOMe	1	
6- 33	1,2,2- trimetil -1,3-ciclopentila	COOMe	2	
6- 34	1,2,2- trimetil -1,3-ciclopentila	COOEt	0	
6- 35	1,2,2- trimetil -1,3-ciclopentila	COOEt	1	
6- 36	1,2,2- trimetil -1,3-ciclopentila	COOEt	2	
6- 37	2,3-(5- norbornenila)	COOH	0	
6- 38	2,3-(5- norbornenila)	COOH	1	
6- 39	2,3-(5- norbornenila)	COOH	2	
6- 40	2,3-(5- norbornenila)	COOMe	0	
6- 41	2,3-(5- norbornenila)	COOMe	1	
6- 42	2,3-(5- norbornenila)	COOMe	2	
6- 43	2,3-(5- norbornenila)	COOEt	0	
6- 44	2,3-(5- norbornenila)	COOEt	1	
6- 45	2,3-(5- norbornenila)	COOEt	2	

Composto número	A	R <sup>3</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
6- 46	1,2-ciclohexila	COOH	0	
6- 47	1,2-ciclohexila	COOH	1	
6- 48	1,2-ciclohexila	COOH	2	
6- 49	1,2-ciclohexila	COOMe	0	
6- 50	1,2-ciclohexila	COOMe	1	
6- 51	1,2-ciclohexila	COOMe	2	
6- 52	1,2-ciclohexila	COOEt	0	
6- 53	1,2-ciclohexila	COOEt	1	
6- 54	1,2-ciclohexila	COOEt	2	
6- 55	1,2-ciclohexila	COOH	0	
6- 56	1,2-ciclohexila	COOH	1	
6- 57	1,2-ciclohex-1-enila	COOH	2	
6- 58	1,2-ciclohex-1-enila	COOMe	0	
6- 59	1,2-ciclohex-1-enila	COOMe	1	
6- 60	1,2-ciclohex-1-enila	COOMe	2	
6- 61	1,2-ciclohex-1-enila	COOEt	0	
6- 62	1,2-ciclohex-1-enila	COOEt	1	
6- 63	1,2-ciclohex-1-enila	COOEt	2	
6- 64	1,3-ciclohexila	COOH	0	
6- 65	1,3-ciclohexila	COOH	1	
6- 66	1,3-ciclohexila	COOH	2	
6- 67	1,3-ciclohexila	COOMe	0	
6- 68	1,3-ciclohexila	COOMe	1	
6- 69	1,3-ciclohexila	COOMe	2	
6- 70	1,3-ciclohexila	COOEt	0	
6- 71	1,3-ciclohexila	COOEt	1	
6- 72	1,3-ciclohexila	COOEt	2	
6- 73	1,4-ciclohexila	COOH	0	
6- 74	1,4-ciclohexila	COOH	1	
6- 75	1,4-ciclohexila	COOH	2	
6- 76	1,4-ciclohexila	COOMe	0	
6- 77	1,4-ciclohexila	COOMe	1	
6- 78	1,4-ciclohexila	COOMe	2	
6- 79	1,4-ciclohexila	COOEt	0	
6- 80	1,4-ciclohexila	COOEt	1	
6- 81	1,4-ciclohexila	COOEt	2	

Tabela 7: Compostos da fórmula (I), nos quais os substituintes têm os seguintes significados:

$R^1 = \text{CN}$ ,  $R^2 = \text{Cl}$ ,  $W = \text{CR}^4$  e  $R^4 = \text{Cl}$ ,  $R^3 = \text{CF}_3$ ,  $R^6$  é  $\text{CF}_3$ ,  $m=1$ ,  $R^7 = \text{H}$

Composto número	A	$R^5$	n	pf. °C, RMN(ppm)
7- 01	CH(CH <sub>3</sub> )	NH <sub>2</sub>	0	
7- 02	CH(CH <sub>3</sub> )	NH <sub>2</sub>	1	
7- 03	CH(CH <sub>3</sub> )	NH <sub>2</sub>	2	
7- 04	CH(CH <sub>3</sub> )	NHMe	0	
7- 05	CH(CH <sub>3</sub> )	NHMe	1	
7- 06	CH(CH <sub>3</sub> )	NHMe	2	
7- 07	CH(CH <sub>3</sub> )	NHEt	0	
7- 08	CH(CH <sub>3</sub> )	NHEt	1	
7- 09	CH(CH <sub>3</sub> )	NHEt	2	
7- 10	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe <sub>2</sub>	0	
7- 11	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe <sub>2</sub>	1	
7- 12	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe <sub>2</sub>	2	
7- 13	CH(CH <sub>3</sub> )	NEt <sub>2</sub>	0	19F: -44,3; -64,2
7- 14	CH(CH <sub>3</sub> )	NEt <sub>2</sub>	1	
7- 15	CH(CH <sub>3</sub> )	NEt <sub>2</sub>	2	
7- 16	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOtBu	0	
7- 17	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOtBu	1	
7- 18	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOtBu	2	
7- 19	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	0	19F: -43,9; -64,1
7- 20	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	1	
7- 21	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
7- 22	CH(CH <sub>3</sub> )	NHCOMe	0	
7- 23	CH(CH <sub>3</sub> )	NHCOMe	1	
7- 24	CH(CH <sub>3</sub> )	NHCOMe	2	
7- 25	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe-COOtBu	0	
7- 26	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe-COOtBu	1	
7- 27	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe-COOtBu	2	
7- 28	CH(CH <sub>3</sub> )	NnPr <sub>2</sub>	0	
7- 29	CH(CH <sub>3</sub> )	NnPr <sub>2</sub>	1	
7- 30	CH(CH <sub>3</sub> )	NnPr <sub>2</sub>	2	
7- 31	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	0	
7- 32	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	1	
7- 33	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	2	
7- 34	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHMe	0	19F: -44,5; -64,1
7- 35	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHMe	1	
7- 36	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHMe	2	
7- 37	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHEt	0	
7- 38	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHEt	1	
7- 39	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHEt	2	
7- 40	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	0	19F: -44,6; -64,1
7- 41	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	1	

Composto número	A	R <sup>3</sup>	n	pf. °C, RMN (ppm)
7- 42	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	2	
7- 43	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	0	19F: -44,2; -64,2
7- 44	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	1	
7- 45	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	2	
7- 46	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOtBu	0	
7- 47	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOtBu	1	
7- 48	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOtBu	2	
7- 49	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	0	
7- 50	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	1	19F: -63,5; -70,9
7- 51	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
7- 52	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCOMe	0	
7- 53	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCOMe	1	
7- 54	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCOMe	2	
7- 55	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe-COOtBu	0	
7- 56	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe-COOtBu	1	
7- 57	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe-COOtBu	2	
7- 58	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	0	
7- 59	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	1	
7- 60	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	2	
7- 61	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnPr	0	
7- 62	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnPr	1	
7- 63	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnPr	2	
7- 64	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnBu	0	
7- 65	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnBu	1	
7- 66	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnBu	2	
7- 67	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	0	
7- 68	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	1	
7- 69	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	2	
7- 70	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-pirrolidinila	0	
7- 71	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-pirrolidinila	1	
7- 72	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-pirrolidinila	2	
7- 73	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-piperidinila	0	19F: -44,0; -64,2
7- 74	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-piperidinila	1	
7- 75	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-piperidinila	2	
7- 76	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-morfolinila	0	
7- 77	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-morfolinila	1	
7- 78	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-morfolinila	2	
7- 79	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N(Me)-CH <sub>2</sub> COOEt	0	19F: -44,2; -64,1
7- 80	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N(Me)-CH <sub>2</sub> COOEt	1	
7- 81	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N(Me)-CH <sub>2</sub> COOEt	2	
7- 82	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOMe-piperidinila	0	19F: -44,0; -64,2
7- 83	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOMe piperidinila	1	



Composto número	A	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
7- 84	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOMe piperidinila	2	
7- 85	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOEt-piperazinila	0	19F: -43,8; -64,1
7- 86	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOEt-piperazinila	1	
7- 87	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOEt-piperazinila	2	
7- 88	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	0	
7- 89	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	1	
7- 90	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	2	
7- 91	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHMe	0	
7- 92	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHMe	1	
7- 93	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHMe	2	
7- 94	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHEt	0	
7- 95	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHEt	1	
7- 96	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHEt	2	
7- 97	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	0	
7- 98	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	1	
7- 99	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	2	
7- 100	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	0	
7- 101	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	1	
7- 102	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	2	
7- 103	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	0	
7- 104	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	1	
7- 105	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	2	
7- 106	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnPr	0	
7- 107	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnPr	1	
7- 108	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnPr	2	
7- 109	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnBu	0	
7- 110	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnBu	1	
7- 111	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnBu	2	
7- 112	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	0	
7- 113	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	1	
7- 114	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	2	
7- 115	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-pirrolidinila	0	
7- 116	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-pirrolidinila	1	
7- 117	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-pirrolidinila	2	
7- 118	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-piperidinila	0	
7- 119	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-piperidinila	1	
7- 120	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-piperidinila	2	
7- 121	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-morfolinila	0	
7- 122	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-morfolinila	1	
7- 123	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-morfolinila	2	

Tabela 8: Compostos da fórmula (I), nos quais os substituintes têm os seguintes significados:

$R^1 = \text{CN}$ ,  $R^2 = \text{Cl}$ ,  $W = \text{CR}^4$  e  $R^4 = \text{Cl}$ ,  $R^3 = \text{CF}_3$ ,  $R^6$  é  $\text{CF}_3$ ,  $m=1$ ,  $R^7 = \text{Me}$

Composto numero	A	$R^5$	n	pf. °C, RMN (ppm)
8- 01	CH(CH <sub>3</sub> )	NH <sub>2</sub>	0	
8- 02	CH(CH <sub>3</sub> )	NH <sub>2</sub>	1	
8- 03	CH(CH <sub>3</sub> )	NH <sub>2</sub>	2	
8- 04	CH(CH <sub>3</sub> )	NHMe	0	
8- 05	CH(CH <sub>3</sub> )	NHMe	1	
8- 06	CH(CH <sub>3</sub> )	NHMe	2	
8- 07	CH(CH <sub>3</sub> )	NHEt	0	
8- 08	CH(CH <sub>3</sub> )	NHEt	1	
8- 09	CH(CH <sub>3</sub> )	NHEt	2	
8- 10	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe <sub>2</sub>	0	
8- 11	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe <sub>2</sub>	1	
8- 12	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe <sub>2</sub>	2	
8- 13	CH(CH <sub>3</sub> )	NEt <sub>2</sub>	0	
8- 14	CH(CH <sub>3</sub> )	NEt <sub>2</sub>	1	
8- 15	CH(CH <sub>3</sub> )	NEt <sub>2</sub>	2	
8- 16	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOtBu	0	
8- 17	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOtBu	1	
8- 18	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOtBu	2	
8- 19	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	0	
8- 20	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	1	
8- 21	CH(CH <sub>3</sub> )	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
8- 22	CH(CH <sub>3</sub> )	NHCOMe	0	
8- 23	CH(CH <sub>3</sub> )	NHCOMe	1	
8- 24	CH(CH <sub>3</sub> )	NHCOMe	2	
8- 25	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe-COOtBu	0	
8- 26	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe-COOtBu	1	
8- 27	CH(CH <sub>3</sub> )	NMe-COOtBu	2	
8- 28	CH(CH <sub>3</sub> )	NnPr <sub>2</sub>	0	
8- 29	CH(CH <sub>3</sub> )	NnPr <sub>2</sub>	1	
8- 30	CH(CH <sub>3</sub> )	NnPr <sub>2</sub>	2	
8- 31	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	0	
8- 32	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	1	
8- 33	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	2	
8- 34	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHMe	0	
8- 35	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHMe	1	
8- 36	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHMe	2	

Composto número	A	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN (ppm)
8- 37	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHEt	0	
8- 38	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHEt	1	
8- 39	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHEt	2	
8- 40	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	0	
8- 41	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	1	
8- 42	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	2	
8- 43	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	0	19F: -42,8; -63,9
8- 44	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	1	
8- 45	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	2	
8- 46	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOtBu	0	
8- 47	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOtBu	1	
8- 48	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOtBu	2	
8- 49	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	0	
8- 50	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	1	
8- 51	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NH-COOCH <sub>2</sub> Ph	2	
8- 52	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCOMe	0	
8- 53	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCOMe	1	
8- 54	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCOMe	2	
8- 55	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe-COOtBu	0	
8- 56	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe-COOtBu	1	
8- 57	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NMe-COOtBu	2	
8- 58	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	0	
8- 59	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	1	
8- 60	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	2	
8- 61	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnPr	0	
8- 62	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnPr	1	
8- 63	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnPr	2	
8- 64	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnBu	0	
8- 65	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnBu	1	
8- 66	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHnBu	2	
8- 67	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	0	
8- 68	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	1	
8- 69	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	2	
8- 70	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N- pirrolidinila	0	
8- 71	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N- pirrolidinila	1	
8- 72	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N- pirrolidinila	2	
8- 73	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N- piperidinila	0	
8- 74	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N- piperidinila	1	
8- 75	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N- piperidinila	2	
8- 76	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N- morfolinila	0	
8- 77	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N- morfolinila	1	

Composto número	A	R <sup>5</sup>	n	pf. °C, RMN(ppm)
8- 78	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-morfolinila	2	
8- 79	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N(Me)-CH <sub>2</sub> COOEt	0	
8- 80	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N(Me)-CH <sub>2</sub> COOEt	1	
8- 81	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N(Me)-CH <sub>2</sub> COOEt	2	
8- 82	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOMe-piperidinila	0	
8- 83	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOMe-piperidinila	1	
8- 84	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOMe-piperidinila	2	
8- 85	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOEt-piperazinila	0	
8- 86	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOEt-piperazinila	1	
8- 87	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	N-4-COOEt-piperazinila	2	
8- 88	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	0	
8- 89	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	1	
8- 90	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	2	
8- 91	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHMe	0	
8- 92	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHMe	1	
8- 93	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHMe	2	
8- 94	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHEt	0	
8- 95	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHEt	1	
8- 96	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHEt	2	
8- 97	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	0	
8- 98	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	1	
8- 99	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NMe <sub>2</sub>	2	
8- 100	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	0	
8- 101	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	1	
8- 102	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NEt <sub>2</sub>	2	
8- 103	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	0	
8- 104	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	1	
8- 105	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NnPr <sub>2</sub>	2	
8- 106	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnPr	0	
8- 107	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnPr	1	
8- 108	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnPr	2	
8- 109	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnBu	0	
8- 110	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnBu	1	
8- 111	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHnBu	2	
8- 112	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	0	
8- 113	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	1	
8- 114	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph	2	
8- 115	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-pirrolidinila	0	
8- 116	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-pirrolidinila	1	
8- 117	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-pirrolidinila	2	
8- 118	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-piperidinila	0	
8- 119	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-piperidinila	1	

Composto número	A	R <sup>5</sup>	n	Pf. °C, RMN (ppm)
8-120	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-piperidinila	2	
8-121	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-morfolinila	0	
8-122	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-morfolinila	1	
8-123	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub>	N-morfolinila	2	

De acordo com um outro aspecto da presente invenção, é posto à disposição um método para o controle de pragas em um local, que compreende a aplicação de uma quantidade eficaz de um composto da fórmula (I) ou de um sal do mesmo. Para esse fim, o referido composto é normalmente usado na forma de uma composição pesticida (isto é, em associação com diluentes ou veículos compatíveis e/ou agentes tensoativos, apropriados para uso em composições pesticidas), por exemplo, tal como descrito abaixo.

O termo "composto da invenção", tal como é usado abaixo, abrange um alquilaminopirazol 5-substituído da fórmula (I), tal como definido acima e um sal pesticidamente aceitável do mesmo.

Um aspecto da presente invenção, tal como definida acima, é um método para o controle de pragas em um local. O local inclui, por exemplo, a própria praga, o lugar (planta, campo, floresta, pomar, curso de água, solo, produto da planta ou similar) onde a praga habita ou se alimenta, ou um lugar suscetível a uma futura infestação pela praga. O composto da invenção pode, portanto, ser aplicado diretamente na praga, no lugar onde a praga habita ou se alimenta, ou no lugar suscetível a uma futura infestação pela praga. Tal como é evidente dos usos de pesticida precedentes, a presente invenção oferece compostos pesticidamente ativos e métodos de uso dos referidos compostos, para o controle de diversas espécies de pragas, que incluem: artrópodes, especialmente insetos ou aracnídeos, tal como ácaro ou nematódeos de plantas. Desse modo, o composto da invenção pode ser usado vantajosamente em usos práticos, por exemplo, em culturas agrícolas ou horticolas, na silvicultura, na medicina veterinária ou criação de animais ou na saúde pública.

Os compostos da invenção podem ser usados, por exemplo, nas seguintes aplicações e contra as seguintes pragas:

Para controle dos insetos do solo, tal como lagarta das raízes do milho, cupins (especialmente para proteção de estruturas), larvas de raízes, 5 larvas de elaterídeos, gorgulhos de raízes, brocas de rizomas, lagartas de agrotídeos, afídios de raízes, ou larvas de insetos. Também podem ser usados para conferir atividade contra nematódeos patogênicos de plantas, tais como nematódeos de nódulos de raízes, de cistos, traças, de lesões ou de hastes ou bulbos, ou contra ácaros. Para o controle de pragas do solo, por 10 exemplo, lagarta das raízes do milho, os compostos são vantajosamente aplicados ou incorporados em uma quantidade eficaz no solo, no qual as culturas estão plantadas ou virão a ser plantadas ou nas sementes ou raízes de plantas em crescimento.

No setor de saúde pública, os compostos são especialmente 15 úteis no controle de muitos insetos, especialmente moscas de lixo ou outras pragas de dípteros, tal como moscas domésticas, moscas de estábulo, moscas soldado, mosca dos chifres, mosca de cervídeos, moscas de eqüinos, mosquitos-pólvora, maruins, borrachudos ou mosquitos.

Na proteção de produtos armazenadas, por exemplo, cereais, 20 inclusive grãos ou farinha, nozes moídas, rações animais, madeira ou materiais domésticos, por exemplo, tapetes e têxteis, os compostos da invenção são úteis contra o ataque por artrópodes, mais especialmente, besouros, inclusive brocas, traças ou ácaros, por exemplo, *Ephestia* spp. (traças de farinha), *Antrenus* spp. (besouros de tapete), *Tribolium* spp. (besouros de 25 farinha), *Sitophilus* spp. (carrunchos de grãos) ou *Acarus* spp. (ácaros).

No controle de baratas, formigas ou cupins ou pragas artrópodes similares em locais domésticos ou industriais infestados ou no controle de larvas de mosquito em cursos de água, poços, reservatórios ou outras águas correntes ou paradas.

30 Para o tratamento de fundações, estruturas ou solo, na prevenção do ataque em construções por cupins, por exemplo, *Reticulitermes* spp., *Heterotermes* spp. *Coptotermes* spp..

Na agricultura contra adultos, larvas e ovos de Lepidoptera (borboletas e traças), por exemplo, *Heliothis* spp., tal como *Heliothis virescens* (lagarta do tabaco), *Heliothis armigera* e *Heliothis zea*. Contra adultos e larvas de Coleoptera (besouros), por exemplo, *Anthonomus* spp., por exemplo, *grandis* (broca do algodão), *Leptinotarsa decemlineata* (besouro da batata Colorado), *Diabrotica* spp. (lagartas das raízes do milho). Contra Hemiptera (Hemiptera e Homoptera), por exemplo, *Psylla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* spp., *Nephotettix* spp. (grilo da folha de arroz). *Nilaparvata* spp.

Contra Diptera, por exemplo, *Musca* spp.. Contra Thysanoptera, tal como *Thrips tabaci*. Contra Orthoptera, tal como *Locusta* e *Schistocerca* spp., (gafanhotos e grilos), por exemplo, *Gryllus* spp., e *Acheta* spp., por exemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Locusta migratoria migratorioides* e *Schistocerca gregaria*. Contra Collembola, por exemplo, *Periplaneta* spp. e *Blatella* spp. (baratas). Contra artrópodes de importância agrícola, tal como Acari (ácaros), por exemplo, *Tetranychus* spp. e *Panonychus* spp..

Contra nematódeos que atacam plantas ou árvores de importância para agricultura, silvicultura ou horticultura, quer diretamente, quer por disseminação de doenças bacterianas, virais, micoplasmáticas ou fúngicas. Por exemplo, nematódeos de nódulos das raízes, tal como *Meloidogyne* spp. (por exemplo, *M. incognita*).

No setor de medicina veterinária ou criação de animais ou na conservação de saúde pública contra artrópodes, que são parasíticos internamente ou externamente sobre vertebrados, particularmente vertebrados de sangue quente, por exemplo, animais domésticos, por exemplo, gado, ovelhas, cabras, equinos, porcos, galinhas, cães ou gatos, por exemplo, Acarina, inclusive carrapatos (por exemplo, carrapatos de corpo mole, inclusive *Argasidae* spp., por exemplo, *Argas* spp. e *Ornithodoros* spp. (por exemplo, *Ornithodoros moubata*); carrapatos de corpo duro, inclusive *Ixodidae* spp., por exemplo, *Boophilus* spp., por exemplo, *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus* spp., por exemplo, *Rhipicephalus appendiculatus* e *Rhipice-*

phalus sanguineus; ácaros (por exemplo, *Damalinia* spp.); pulgas (por exemplo, *Ctenocephalides* spp., por exemplo, *Ctenocephalides felis* (pulga felina) e *Ctenocephalides canis* (pulga canina)); piolhos, por exemplo, *Mentopon* spp.; Diptera (por exemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Musca* spp.,  
 5 *Hypoderma* spp.); Hemiptera; Dictyoptera (por exemplo, *Periplaneta* spp., *Blattella* spp.); Hymenoptera; por exemplo, contra infecções do trato gastrintestinal causadas por vermes nematódeos parasíticos, por exemplo, membros da família dos Trichostrongylidae.

Em um aspecto preferido da invenção, os compostos da fórmula  
 10 (I) são usados para o controle de parasitas de animais. Preferivelmente, o animal a ser tratado é um animal de estimação doméstico, tal como um cão ou um gato.

Em um outro aspecto da invenção, os compostos da fórmula (I) ou sais ou composições dos mesmos são usados para a preparação de um  
 15 medicamento veterinário.

No uso prático para o controle de artrópodes, especialmente insetos ou aracnídeos, tal como ácaros, ou pragas nematódeos de plantas, um método compreende, por exemplo, aplicar às plantas ou ao meio no qual elas crescem, uma quantidade eficaz de um composto da invenção. Para um  
 20 método desse tipo, o composto da invenção é aplicado, em geral, ao local no qual a infestação dos artrópodes ou nematódeos deve ser controlada, a uma quantidade eficaz de, aproximadamente, 2 g a aproximadamente 1 kg do composto ativo por hectare de local tratado. Sob condições ideais, dependendo da praga a ser controlada, uma quantidade mais baixa pode oferecer  
 25 proteção adequada. Por outro lado, condições climáticas adversas, resistência da praga ou outros fatores podem exigir que o ingrediente ativo seja usado a quantidades mais altas. A quantidade ótima depende, usualmente, de diversos fatores, por exemplo, do tipo de praga que está sendo controlada, do tipo ou do estágio de crescimento da planta infestada, da distância entre  
 30 fileiras ou também do método de aplicação. Preferivelmente, uma faixa de quantidade eficaz do composto ativo é de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g/ha, mais preferivelmente, de aproximadamente 50 g/ha



a aproximadamente 200 g/ha.

Quando uma praga se encontra no solo, o composto ativo, geralmente em uma composição formulada, é distribuído uniformemente sobre a área a ser tratada (isto é, espalhado livremente ou tratamento em faixas) de qualquer modo conveniente e é aplicado a quantidades de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 ai/h, preferivelmente, de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g ai/ha. Quando aplicado como imersão de raízes de plantas novas ou irrigação por gotejamento em plantas, a solução líquida ou suspensão contém de aproximadamente 0,075 a aproximadamente 1000 mg ai/l, preferivelmente, de aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg ai/l. A aplicação pode ser feita, caso desejado, no campo ou na área de crescimento da plantação, em geral, ou na proximidade da semente ou planta a ser protegida contra ataque. O composto da invenção pode ser lavado para dentro do solo por pulverização com água sobre a área ou pode ser deixada por conta da ação natural das chuvas. Durante ou após a aplicação, o composto formulado, caso desejado, pode ser distribuído mecanicamente no solo, por exemplo, por aração, uso de discos ou uso de correntes de arrasto. A aplicação pode ser feita antes da plantação, durante a plantação, após a plantação, mas antes que ocorra a brotação, ou após a brotação.

O composto da invenção e métodos de controle de pragas com o mesmo são de especial valor na proteção do campo, forragem, plantação, estufa, pomar ou culturas de vinhas, ou de plantas ornamentais, ou da plantação ou árvores de floresta, por exemplo: cereais (tal como trigo ou arroz), algodão, vegetais (tal como pimentas), culturas de campo (tal como beterrabas de açúcar, soja e óleo de semente de colza), pastagens ou culturas de forragem (tal como milho ou sorgo), pomares ou bosques (tal como de frutas com sementes ou caroços), plantas ornamentais, flores ou vegetais ou arbustos sob vidro ou em jardins ou parques, ou árvores de floresta (tanto decíduas como de folhas permanentes) em florestas, plantações ou viveiros.

Também são valiosos na proteção de madeira (em pé, cortada, transformada, armazenada ou estrutural) contra ataque, por exemplo, por

vespões ou besouros ou cupins. Eles têm aplicações na proteção de produtos armazenados, tal como grãos, frutos, nozes, condimentos ou tabaco, quer inteiros, triturados ou compostos em produtos, contra ataque de traças, besouros, ácaros ou carunchos de grãos. Também são protegidos produtos

5 animais armazenados, tal como peles, pêlos, lã ou penas, em forma natural ou transformada (por exemplo, tapetes ou têxteis) contra ataque de traças ou besouros, bem como carne, peixe ou grãos armazenados, contra ataque de besouros, ácaros ou moscas.

Além disso, o composto da invenção e métodos de uso do mesmo são de valor especial no controle de artrópodes ou helmintos que são

10 nocivos, ou disseminam ou atuam como vetores de doenças de animais domésticos, por exemplo, os mencionados acima e, mais especialmente, no controle de carrapatos, ácaros, piolhos, pulgas, mosquitos-pólvora ou moscas que picam, irritam e de miíase. Os compostos da invenção são particularmente úteis no controle de artrópodes ou helmintos que estão presentes

15 dentro de animais hospedeiros domésticos ou que se alimentam na ou sobre a pele ou chupam o sangue do animal, sendo que para esse fim, eles podem ser administrados oral, parenteral, percutânea ou topicamente.

As composições descritas abaixo para aplicação a culturas em

20 crescimento ou locais de crescimento de culturas, ou como um revestimento de semente podem, em geral, ser usadas alternativamente na proteção de produtos armazenados, materiais domésticos, propriedades ou áreas do meio ambiente geral. Meios apropriados para aplicar os compostos da invenção incluem: a culturas em crescimento, como sprays foliares (por exemplo, como um spray nos sulcos), pós, grânulos, nebulizações ou espumas ou

25 também como suspensões de composições finamente divididas ou encapsuladas, como tratamentos do solo ou de raízes por banhos líquidos, pós, granulados, fumaças ou espumas; a sementes de culturas por meio de aplicação como revestimentos de semente por pastas fluidas líquidas ou pós;

30 a animais infestados ou expostos à infestação por artrópodes ou helmintos, por aplicação parenteral, oral ou tópica de composições, nas quais o ingrediente ativo apresenta uma ação imediata e/ou prolongada por

um período de tempo contra os artrópodes ou helmintos, por exemplo, por incorporação na ração ou formulações farmacêuticas apropriadas, de ingestão oral, iscas comestíveis, lambedouros de sal, suplementos dietéticos, formulações para despejar, sprays, banhos, imersões, duchas, jatos, pós, graxas, xampus, cremes, ceras para besuntar ou sistemas de autotrata-  
5 mento de animais de criação;

ao meio ambiente em geral ou em lugares específicos, onde as pragas podem estar ocultas, inclusive produtos armazenados, madeira, materiais domésticos ou locais domésticos ou industriais, como sprays, nebulizações, pós, fumaças, ceras para besuntar, vernizes, granulados ou iscas,  
10 ou em abastecimentos por gotejamento a cursos de água, cavidades, reservatórios ou outra água corrente ou parada.

Os compostos da fórmula (I) são particularmente úteis para o controle de parasitas dos animais quando aplicados oralmente, e, em um  
15 outro aspecto preferido da invenção, os compostos da fórmula (I) são usados para o controle de parasitas de animais por aplicação oral. Os compostos da fórmula (I) ou sais dos mesmos podem ser administrados antes, durante ou após as refeições. Os compostos da fórmula (I) ou sais dos mesmos podem ser misturados com um veículo e/ou com alimentos.

20 O composto da fórmula (I) ou sal do mesmo é administrado oralmente em uma dose ao animal, em uma faixa de dosagem de, em geral, 0,1 a 500 mg/kg do composto da fórmula (I) ou sal do mesmo por quilograma do peso corporal do animal (mg/kg).

A frequência de tratamento do animal, preferivelmente, do animal doméstico a ser tratado pelo composto da fórmula (I) ou sal do mesmo  
25 é, em geral, de aproximadamente uma vez por semana a aproximadamente uma vez ao ano, preferivelmente, de aproximadamente uma vez a cada duas semanas a uma vez a cada três meses.

Os compostos da invenção podem ser administrados de modo  
30 especialmente vantajoso com outro material parasiticamente eficaz, tal como um endoparasiticida e/ou um ectoparasiticida e/ou um endectoparasiticida. Por exemplo, esses compostos incluem lactonas macrocíclicas, tal como

avermectinas ou milbemecinas, por exemplo, ivermectina, piratel ou um regulador de crescimento de insetos, tal como lufenuron ou metoprene.

Os compostos da fórmula (I) também podem ser usados para controlar organismos nocivos em culturas de plantas modificadas geneticamente, conhecidas, ou plantas geneticamente modificadas ainda a ser desenvolvidas. Em geral, as plantas transgênicas distinguem-se por propriedades especialmente vantajosas, por exemplo, por resistências a determinados agentes de proteção de cultura, resistências a doenças de plantas ou agentes patogênicos de doenças de plantas, tal como determinados insetos ou microorganismos, tais como fungos, bactérias ou vírus. Outras propriedades especiais referem-se, por exemplo, ao material colhido, no que se refere a quantidade, qualidade, propriedades de armazenamento, composição e constituintes específicos. Desse modo, são conhecidas plantas transgênicas, nas quais o conteúdo de amido está aumentado, ou a qualidade do amido está alterada, ou nas quais o material colhido tem uma composição de ácidos graxos diferente.

O uso em culturas transgênicas economicamente importantes de plantas úteis e ornamentais é preferido, por exemplo, em cereais, tal como trigo, cevada, centeio, aveia, painço, arroz, mandioca e milho ou então culturas de beterraba de açúcar, algodão, soja, óleo de semente de colza, batatas, tomates, ervilhas e outros tipos de vegetais.

Quando usados em culturas transgênicas, particularmente aquelas que têm resistências a insetos, os efeitos são freqüentemente observados, além dos efeitos contra organismos nocivos a serem observados em outras culturas, que são específicos para aplicação na cultura transgênica em questão, por exemplo, um espectro alterado ou especificamente ampliado de pragas que não podem ser controladas, ou quantidades de aplicação modificadas, que podem ser usadas para aplicação.

A invenção refere-se, portanto, também ao uso de compostos da fórmula (I) para controlar organismos nocivos em plantas de cultura transgênicas.

De acordo com um outro aspecto da presente invenção, é posta

à disposição uma composição pesticida, que compreende um ou mais compostos da invenção, tal como definidos acima, em associação com e, preferivelmente, dispersos homogeneamente em um ou mais diluentes ou veículos e/ou agentes tensoativos compatíveis, pesticidamente aceitáveis [isto é, diluentes ou veículos ou agentes tensoativos do tipo geralmente aceito na técnica como sendo apropriado para uso em composições pesticidas e que são compatíveis com compostos da invenção].

Na prática, os compostos da invenção na maioria das vezes formam parte das composições. Essas composições podem ser usadas para controlar artrópodes, especialmente insetos e aracnídeos, tal como ácaros, ou nematódeos de plantas. As composições podem ser de qualquer tipo conhecido na técnica, apropriado para aplicação à praga desejada, em qualquer local ou área interna ou externa. Essas composições contêm pelo menos um composto da invenção como ingrediente ativo, em combinação ou associação com um ou mais outros componentes compatíveis, que são, por exemplo, veículos ou diluentes, adjuvantes, agentes tensoativos, sólidos ou líquidos, ou similar, apropriados para o uso pretendido e que são aceitáveis agrônomicamente ou medicamente. Essas composições, que podem ser preparadas por qualquer modo conhecido na técnica, igualmente formam uma parte desta invenção.

Os compostos da invenção, em suas formulações comercialmente disponíveis e nas formas de uso preparadas dessas formulações podem estar presentes em misturas com outras substâncias ativas, tal como inseticidas, substâncias atrativas, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, fungicidas, substâncias reguladoras de crescimento ou herbicidas.

Os pesticidas incluem, por exemplo, ésteres fosfóricos, carbamatos, ésteres carboxílicos, formamidas, compostos de estanho e materiais produzidos por microorganismos.

Componentes preferidos em misturas são:

1. do grupo dos compostos de fósforo  
acefato, azametifos, azinfos-etila, azinfos-metila, bromofos, bromofos-etila, cadusafos (F-67825), cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpi-

rifos-metila, demeton, demeton-S-metila, demeton-S-metil sulfona, dialifos, diazinon, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitriotion, fensulfotion, fention, fonofos, formotion, fostiazato, heptenofos, isazofos, isotioato, isoxation, malation, metacrifos, metamidofos, metidation, salition, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metila, paration, paration-metila, fentoato, forato, fosalona, fosfolan, fosfocarb (BAS-301), fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos, pirimifos-etila, pirimifos-metila, profenofos, propafos, proetamfos, protiofos, piraclofos, piridapention, quinalfos, sulprofos, temefos, terbufos, tebupirimfos, tetraclovinfos, tiometon, triazofos, triclorfon, vamidotion;

#### 2. do grupo dos carbamatos

alanicarb (OK-135), aldicarb, 2-sec-butilfenilmetilcarbamato (BPMC), carbarila, carbofuran, carbosulfan, cloetocarb, benfuracarb, etiofencarb, furatiocarb, HCN-801, isoprocarb, metomila, 5-metil-m-cumenilbutiril(metil)carbamato, oxamila, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, 1-metiltio(etilidenoamino)-N-metil-N-morfolinotio)carbamato (UC 51717), triazamato;

#### 3. do grupo dos ésteres carboxílicos

acrinatrin, alletrin, alfametrin, 5-benzil-3-furilmetil-(E)-(1R)-cis-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenometil)ciclopropanocarboxilato, beta-ciflutrin, alfa-cipermetrin, beta-cipermetrin, bioalletrin, bioalletrin((S)-ciclopentilisômero), bioresmetrin, bifentrin, (RS)-1-ciano-1-(6-fenóxi-2-piridil)metil-(1RS)-trans-3-(4-terc-butilfenil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato (NCI 85193), cicloprotrin, ciflutrin, cihalotrin, cititrin, cipermetrin, cifenotrin, deltametrin, empentrin, fenvalerato, fenflutrin, fenpropatrin, fenvalerato, flucitrinato, flumetrin, fluvalinato (isômero-D), imiprotrin (S-41311), lambda-cihalotrin, permetrin, fenotrin (isômero (R)), pralletrin, piretrins (produtos naturais), resmetrin, teflutrin, tetrametrin, teta-cipermetrin, tralometrin, transflutrin, zeta-Cipermetrin (F-56701);

#### 4. do grupo das amidinas

amitraz, clordimeform;

#### 5. do grupo dos compostos de estanho

cihexatin, fenbutatin óxido;

6. outros

abamectin, ABG-9008, acetamiprid, acequinocila, Anagrafa falcitera, AKD-1022, AKD-3059, ANS-118, azadiractin, *Bacillus turingiensis*, *Beauveria bassiana*, bensultap, bifenazato, binapacril, BJL-932, bromopropilato, BTG-504, BTG-505, buprofezin, camfeclor, cartap, clorobenzilato, clorfenapir, clorfluazuron, 2-(4-clorofenil)-4,5-difeniltiofeno (UBI-T 930), clorfentezina, cloproxifen, cromafenozida, clotianida, ciclopropanocarboxilato de 2-naftilmetila (Ro12-0470), ciromazin, diaclofen (tiametoxam), diafenthiuron, DBI-10 3204, 2-cloro-N-(3,5-dicloro-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluor-1-propilóxi)fenil)carbamoil)-2-carboximidato de etila, DDT, dicofol, diflubenzuron, N-(2,3-diidro-3-metil-1,3-tiazol-2-ilideno)-2,4-xilidina, diidroximetildiidroxi-pirrolidina, dinobuton, dinocap, diofenolan, benzoato de emamectina, endosulfan, etiprol (sulfetiprol), etofenprox, etoxazol, fenazaquin, fenoxicarb, 15 fipronil, fluazuron, flumite (flufenzina, SZI-121), 2-fluor-5-(4-(4-etoxifenil)-4-metil-1-pentil)difeniléter (MTI 800), vírus de granulose e poliedrose nuclear, fenpiroximato, fentiofent, fluacripirim, flubenzimina, flubrocitrinato, flucicloxuron, flufenoxuron, flufenzina, flufenprox, fluproxifeno, gamma-HCH, halfenozida, halofenprox, hexaflumuron (DE-473), hexitiazox, HOI-9004, hidrametilnon (AC 217300), IKI-220, indoxacarb, ivermectina, L-14165, imidacloprid, 20 indoxacarb (DPX-MP062), kanemite (AKD-2023), lufenuron, M-020, metoxifenozida, milbemectin, NC-196, neemgard, nidinoterfuran, nitenpiram, 2-nitrometil-4,5-diidro-6H-tiazina (DS52618), 2-nitrometil-3,4-diidro-tiazol (SD 35651), 2-nitrometilen-1,2-tiazinan-3-ilcarbamaaldeído (WL 108477), novaluron, 25 piridaryl, propargite, protrifentbut, pimetrozina, piridaben, pirimidifen, piriproxifen, NC-196, NC-1111, NNI-9768, novaluron (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, OK-9802, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, silafluofen, silomadina (CG-177), spinosad, spiroticlofen, SU-9118, tebufenozide, tebufenpirad, teflubenzuron, tetradifon, tetrasul, tiacloprid, tiociclam, tiametoxam, tolfenpirad, triazamato, trietoxispinosin A, triflumuron, verbutin, vertalec (mikotal), YI-5301.

Os componentes citados acima para combinações são substân-

cias ativas conhecidas, muitas das quais estão descritas em Ch.R. Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 12th Edition, British Crop Protection Council, Farnham 2000.

As doses de uso eficazes dos compostos usados na invenção podem variar dentro de amplos limites, particularmente, dependendo da natureza da praga a ser eliminada ou grau de infestação, por exemplo, de culturas com essas pragas. Em geral, as composições de acordo com a invenção usualmente contêm aproximadamente 0,05 a aproximadamente 95% (em peso) de um ou mais ingredientes ativos de acordo com a invenção, aproximadamente 1 a aproximadamente 95% de um ou mais veículos sólidos ou líquidos e, opcionalmente, aproximadamente 0,1 a aproximadamente 50% de um ou mais outros componentes compatíveis, tal como agentes tensoativos ou similar. Na presente descrição, o termo "veículo" significa um ingrediente orgânico ou inorgânico, natural ou sintético, com o qual o ingrediente ativo é combinado para facilitar sua aplicação, por exemplo, à planta, a sementes ou ao solo. Esse veículo é, portanto, geralmente inerte e precisa ser aceitável (por exemplo, agronomicamente aceitável, particularmente para a planta tratada).

O veículo pode ser um sólido, por exemplo, argilas, silicatos naturais ou sintéticos, sílica, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por exemplo, sais de amônio), minerais naturais triturados, tal como caulins, argilas, talco, carvão, quartzo, atapulgita, montmorilonita, bentonita ou terra diatomácea, ou minerais sintéticos triturados, tal como sílica, alumina ou silicatos, especialmente silicatos de alumínio ou magnésio. Como veículos sólidos para granulados são apropriados os seguintes: rochas naturais trituradas e fracionadas, tal como calcita, mármore, pedra-pomes, sepiolita e dolomita; granulados sintéticos de farinhas inorgânicas ou orgânicas; granulados de material orgânico, tal como pó de serragem, cascas de coco, espigas de milho, palha de milho e hastes de tabaco; diatomite, fosfato tricálcio, cortiça em pó, ou negro-de-fumo absorvente; polímeros, resinas, ceras solúveis em água; ou fertilizantes sólidos. Essas composições podem conter, caso desejado, um ou mais agentes de umectação, dispersão, emulsificação ou coloração, que,



quando sólidos, também podem servir como diluente.

O veículo também pode ser líquido, por exemplo: água, álcoois, particularmente, butanol ou glicol, bem como seus éteres ou ésteres, particularmente, acetato metilglicol; cetonas, particularmente, acetona, ciclohexanona, metiletilcetona, metilisobutircetona ou isoforona; frações de petróleo, tal como hidrocarbonetos parafínicos ou aromáticos, particularmente, xilenos ou alquilnaftalenos; óleos minerais ou vegetais; hidrocarbonetos alifáticos clorados, particularmente, tricloroetano ou cloreto de metileno; hidrocarbonetos aromáticos clorados, particularmente, clorobenzenos; solventes solúveis em água ou fortemente polares, tal como dimetilformamida, dimetilsulfóxido ou N-metilpirrolidona; gases liquefeitos; ou similar ou misturas dos mesmos.

O agente tensoativo pode ser um emulsificante, agente de dispersão ou umectante do tipo iônico ou não-iônico ou uma mistura desses agentes tensoativos. Entre os mesmos estão, por exemplo, sais de ácidos poliacrílicos, sais de ácidos lignossulfônicos, sais de ácidos fenolsulfônicos ou naftalenossulfônicos, policondensados de óxido de etileno com álcoois graxos ou ácidos graxos ou ésteres graxos ou aminas graxas, fenóis substituídos (particularmente, alquilfenóis ou arilfenóis), sais de ésteres de ácido sulfossuccínico, derivados de taurina (particularmente, alquiltauratos), ésteres fosfóricos de álcoois ou de policondensados de óxido de etileno com fenóis, ésteres de ácidos graxos com polióis, ou derivados funcionais de sulfato, sulfonato ou fosfato dos compostos acima. A presença de pelo menos um agente tensoativo é geralmente essencial quando o ingrediente ativo e/ou o veículo inerte forem apenas ligeiramente solúveis em água ou não forem solúveis em água e o veículo da composição para aplicação for água.

Composições da invenção podem conter ainda outros aditivos, tal como adesivos ou corantes. Adesivos, tal como carboximetilcelulose ou polímeros naturais ou sintéticos, em forma de pós, granulados ou látex, tal como goma arábica, polivinilálcool, acetato de polivinila, fosfolipídios naturais, tal como cefalinas ou lecitinas ou fosfolipídios sintéticos, podem ser usados nas formulações. É possível usar corantes, tal como pigmentos inorgânicos, por exemplo: óxidos de ferro, óxidos de titânio ou azul da Prússia;

corantes orgânicos, tal como corantes de alizarina, corantes azo ou corantes de ftalocianina metálica; ou nutrientes de vestígio, tal como sais de ferro, manganês, boro, cobre, cobalto, molibdênio ou zinco.

Para sua aplicação agrícola, os compostos da invenção estão, portanto, em geral, na forma de composições, que estão em diversas formas sólidas ou líquidas. Formas de composições sólidas, que podem ser usadas, são pós de polvilhamento (com um conteúdo do composto da invenção, variando até 80%), pós umectáveis ou granulados (inclusive granulados dispersíveis em água), particularmente os obtidos por extrusão, compactação, impregnação de um veículo granulado, ou granulação a partir de um pó (o conteúdo do composto da invenção nesses pós ou granulados umectáveis é dentre aproximadamente 0,5 e aproximadamente 80%). Composições sólidas, homogêneas ou heterogêneas, que contêm um ou mais compostos da invenção, por exemplo, granulados, péletes, briquetes ou cápsulas, podem ser usadas para tratar água parada ou corrente por um período de tempo. Um efeito similar pode ser obtido usando alimentação por gotejamento ou intermitente de concentrados dispersíveis em água, tal como descrito no presente. Composições líquidas incluem, por exemplo, soluções ou suspensões aquosas ou não-aquosas (tal como concentrados emulsificáveis, emulsões, agentes de derramamento, dispersões ou soluções) ou aerossóis. Composições líquidas também incluem, particularmente, concentrados emulsificáveis, dispersões, emulsões, agentes de inundação, aerossóis, pós umectáveis (ou pós para pulverização), agentes de derramamento secos ou pastas como formas de composições que são líquidas ou destinam-se a formar composições líquidas quando aplicadas, por exemplo, como sprays aquosos (incluindo de volume baixo e volume ultrabaixo) ou como nebulizações ou aerossóis.

Composições líquidas, por exemplo, na forma de concentrados emulsificáveis ou solúveis, na maioria das vezes compreendem aproximadamente 5 a aproximadamente 80% em peso do ingrediente ativo, enquanto as emulsões que estão prontas para aplicação contêm, por sua vez, aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20% do ingrediente ativo. Além do sol-

vente, os concentrados emulsificáveis ou solúveis podem conter, quando necessário, aproximadamente 2 a aproximadamente 50% de aditivos apropriados, tal como estabilizadores, agentes tensoativos, agentes de penetração, inibidores de corrosão, corantes ou adesivos. Emulsões de qualquer  
5 concentração necessária, que são particularmente apropriadas para aplicação, por exemplo, em plantas, podem ser obtidas desses concentrados por diluição com água. Essas composições estão incluídas no âmbito das composições que podem ser usadas na presente invenção. As emulsões podem ser do tipo de água-em-óleo ou óleo-em-água e podem ter uma consistência  
10 espessa.

As composições líquidas desta invenção podem, além de aplicações normais de uso agrícola, ser usadas, por exemplo, para tratar substratos ou locais infestados ou propensos à infestação por artrópodes (ou outras pragas controladas por compostos desta invenção), incluindo instalações,  
15 áreas de armazenamento externo ou interno ou de processamento, recipientes ou equipamento ou água parada ou corrente.

Todas essas dispersões ou emulsões aquosas ou misturas de pulverização podem ser aplicadas, por exemplo, a culturas por qualquer meio apropriado, principalmente por pulverização, em quantidades que são,  
20 em geral, da ordem de aproximadamente 100 a aproximadamente 1.200 litros de mistura de pulverização por hectare, mas podem ser mais altas ou mais baixas (por exemplo, volume baixo ou ultrabaixo), dependendo da necessidade ou técnica de aplicação. O composto ou composições de acordo com a invenção são aplicados convenientemente à vegetação e, particularmente, a raízes ou folhas com pragas a ser eliminadas. Outro método de  
25 aplicação dos compostos ou composições de acordo com a invenção é por quimigação, isto é, a adição de uma formulação que contém o ingrediente ativo à água de irrigação. Essa irrigação pode ser irrigação por sprinkler para pesticidas foliares ou pode ser irrigação do solo ou irrigação do subsolo,  
30 para solo ou para pesticidas sistêmicos.

As suspensões concentradas, que podem ser aplicadas por pulverização, são preparadas de modo a produzir um produto fluido estável,

que não se sedimenta (moagem fina) e usualmente contém de aproximadamente 10 a aproximadamente 75% em peso de ingrediente ativo, de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 30% de agentes tensoativos, de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10% de agentes tixotrópicos, de aproximadamente 0 a aproximadamente 30% de aditivos apropriados, tal com agentes antiespumantes, inibidores de corrosão, estabilizadores, agentes de penetração, adesivos e, como veículo, água ou um líquido orgânico, no qual o ingrediente ativo é pouco solúvel ou insolúvel. Alguns sólidos orgânicos ou sais inorgânicos podem ser dissolvidos no veículo para ajudar a evitar a sedimentação ou como agentes anticongelantes para água.

Os pós umectáveis (ou pós para pulverização) usualmente são preparados de tal modo que eles contêm de aproximadamente 10 a aproximadamente 80% em peso de ingrediente ativo, de aproximadamente 20 a aproximadamente 90% de um veículo sólido, de aproximadamente 0 a aproximadamente 5% de um umectante, de aproximadamente 3 a aproximadamente 10% de um agente de dispersão e, quando necessário, de aproximadamente 0 a aproximadamente 80% de um ou mais estabilizadores e/ou outros aditivos, tal como agentes de penetração, adesivos, agentes antiaglomeração, corantes ou similar. Para obter esses pós umectáveis, o ingrediente ativo é intensivamente misturado em um misturador apropriado com substâncias adicionais, que podem ser impregnadas no material de enchimento poroso e é triturado usando um moinho ou outro triturador apropriado. Isso produz pós umectáveis, cuja umectabilidade e suspensibilidade são vantajosas. Eles podem ser suspensos em água para dar qualquer concentração desejada e essa suspensão pode ser usada de modo muito vantajoso, particularmente para aplicação à folhagem da planta. Os "granulados dispersíveis em água (WG)" (granulados que são facilmente dispersíveis em água) têm composições que são substancialmente próximas às de pós umectáveis. Eles podem ser preparados por granulação de formulações descritas para pós umectáveis, quer por uma via úmida (contendo ingrediente ativo finamente dividido com material de enchimento inerte e um pouco de água, por exemplo, 1 a 20% em peso, ou com uma solução aquosa de

um agente de dispersão ou aglutinantes, seguida de secagem e peneiramento ou por uma via seca (compactação, seguida de trituração e peneiramento).

As quantidades e concentrações das composições formulada podem variar de acordo com o método de aplicação ou da natureza da  
5 composições ou uso das mesmas. Falando de um modo geral, as composições para aplicação para controlar pragas artrópodes ou de nematódeos de plantas geralmente contêm de aproximadamente 0,00001% a aproximadamente 95%, mais particularmente, de aproximadamente 0,0005% a aproximadamente 50% em peso de um ou mais compostos da invenção, ou de ingredi  
10 entes ativos totais (isto é, os compostos da invenção, junto com outras substâncias tóxicas para artrópodes ou nematódeos de plantas, agentes de sinergia elementos de traço ou estabilizadores). As composições efetivas usadas e sua quantidade de aplicação são escolhidas para obter o(s) efeito(s) desejado(s) pelo  
15 fazendeiro, produtor de animais de criação, clínico médico ou veterinário, operador de controle de pragas ou outra pessoa versada na técnica.

Composições sólidas ou líquidas para aplicação tópica a animais, madeira, produtos armazenados ou materiais domésticos usualmente contêm de aproximadamente 0,00005% a aproximadamente 90%, mais particularmente, de aproximadamente 0,001% a aproximadamente 10% em peso  
20 de um ou mais compostos da invenção. Para administração a animais, oralmente ou parenteralmente, inclusive composições sólidas ou líquidas percutâneas, as mesmas normalmente contêm de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 90% em peso de um ou mais compostos da invenção. Forragens medicinais normalmente contêm de aproximadamente 0,001% a  
25 aproximadamente 3% em peso de um ou mais compostos da invenção. Concentrados ou suplementos para misturar com forragens normalmente contêm de aproximadamente 5% a aproximadamente 90%, preferivelmente, de aproximadamente 5% a aproximadamente 50% em peso de um ou mais compostos da invenção. Lamedouros de sal mineral normalmente contêm de apro  
30 ximadamente 0,1% a aproximadamente 10% em peso de um ou mais compostos da fórmula (I) ou sais pesticidamente aceitáveis dos mesmos.

Pós ou composições líquidas para aplicação a animais de cria-

ção, mercadorias, instalações ou áreas externas podem conter de aproximadamente 0,0001% a aproximadamente 15%, mais especialmente, de aproximadamente 0,005% a aproximadamente 2,0% em peso de um ou mais compostos da invenção.

- 5                   Concentrações apropriadas em águas tratadas são dentre aproximadamente 0,0001 ppm e aproximadamente 20 ppm, mais particularmente, aproximadamente 0,001 ppm a aproximadamente 5,0 ppm de um ou mais compostos da invenção e podem ser usadas terapeuticamente em criação de peixes, com tempos de exposição apropriados. Iscas comestíveis podem  
10                   conter de aproximadamente 0,01% a aproximadamente 5%, preferivelmente, de aproximadamente 0,01% a aproximadamente 1,0% em peso de um ou mais compostos da invenção.

- Quando administrados a vertebrados, parenteralmente, oralmente ou por meios percutâneos ou outros meios, a dosagem dos compostos da invenção depende da espécie, idade ou saúde do vertebrado e da natureza e grau de sua infestação efetiva ou potencial por pragas artrópodes ou de helmintos. Uma dose única de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 100 mg, preferivelmente, aproximadamente 2,0 a aproximadamente 20,0 mg por kg de peso corporal do animal, ou doses de aproximadamente  
20                   0,01 a aproximadamente 20,0 mg, preferivelmente, aproximadamente 0,1 a aproximadamente 5,0 mg, por kg de peso corporal do animal, por dia, para medicação contínua, geralmente é apropriada por administração oral ou parenteral. Pelo uso de formulações ou dispositivos de liberação contínua, as doses diárias necessárias por um período de meses podem ser combinadas  
25                   e administradas aos animais em uma única ocasião.

- As composições abaixo dos Exemplos 2A-2M ilustram composições para uso contra artrópodes, especialmente ácaros ou insetos, ou nematódeos de plantas, que compreendem, como ingrediente ativo, compostos da invenção, tal como os descritos nos exemplos preparativos. As composições descritas nos Exemplos 2A-2M podem ser diluídas, cada qual, para dar  
30                   uma composição pulverizável, a concentrações apropriadas para uso no campo. Descrições químicas genéricas dos ingredientes (para os quais to-

das as percentagens abaixo são em por cento em peso), usadas nos EXEMPLOS 2A-2M de composição exemplificadas abaixo, são as seguintes:

	Nome Comercial	Descrição Química
	Ethylan BCP	Condensado de nonilfenol óxido de etileno
5	Soprophor BSU	Condensado de tristirilfenol óxido de etileno
	Arylan CA	Solução de 70% p/v de dodecilbenzenossulfonato de cálcio
	Solvesso 150	Solvente aromático leve C10
	Arylan S	Dodecilbenzenossulfonato de sódio
	Darvan NO <sub>2</sub>	Lignossulfato de sódio
10	Celite PF	Veículo de silicato de magnésio sintético
	Sopropon T36	Sais de sódio de ácidos policarboxílicos
	Rhodigel 23	Goma xantana de polissacarídeo
	Bentone 38	Derivado orgânico de montmorilonita de magnésio
	Aerosil	Dióxido de silicone microfino

15 EXEMPLO 2A

Um concentrado solúvel em água é preparado com a seguinte composição:

	Ingrediente ativo	7%
	Ethylan BCP	10%
20	N-metilpirrolidona	83%

A uma solução de Ethylan BP dissolvida em uma parte de N-metilpirrolidona é adicionado o ingrediente ativo com aquecimento e agitação até estar dissolvido. A solução resultante é completada para volume com o restante do solvente.

25 EXEMPLO 2B

Um concentrado emulsificável (EC) é preparado com a seguinte composição:

	Ingrediente ativo	25% (max)
	Soprophor BSU	10%
30	Arylan CA	5%
	N-metilpirrolidona	50%
	Solvesso 150	10%

Os três primeiros componentes são dissolvidos em N-metilpirrolidona e a isso é adicionado depois o Solvesso 150, para dar o volume final.

#### EXEMPLO 2C

5 Um pó umectável (WP) é preparado com a seguinte composição:

	Ingrediente ativo	40%
	Arylan S	2%
	Darvan NO <sub>2</sub>	5%
10	Celite PF	53%

Os ingredientes são misturados e triturados com um martelo hidráulico para um pó, com um tamanho de partícula de menos de 50 microns.

#### EXEMPLO 2D

15 Uma formulação aquosa fluida é preparada com a seguinte composição:

	Ingrediente ativo	40,00%
	Ethylan BCP	1,00%
	Sopropon T360	0,20%
	Etilenoglicol	5,00%
20	Rhodigel 230	0,15%
	Água	53,65%

Os ingredientes são misturados intimamente e são triturados em um moinho de esferas, até que um tamanho de partícula médio de menos 3 microns seja obtido.

#### 25 EXEMPLO 2E

Um concentrado de suspensão emulsificável é preparado com a seguinte composição:

	Ingrediente ativo	30,0%
	Ethylan BCP	10,0%
30	Bentone 38	0,5%
	Solvesso 150	59,5%

Os ingredientes são misturados intimamente e são triturados em



um moinho de esferas, até que um tamanho de partícula médio de menos 3 microns seja obtido.

#### EXEMPLO 2F

Um granulado dispersível em água é preparado com a seguinte  
5 composição:

Ingrediente ativo	30%
Darvan No 2	15%
Arylan S	8%
Celite PF	47%

10 Os ingredientes são misturados, micronizados em um moinho de energia de fluido e depois granulados em um peletizador rotativo por pulverização com água (até 10%). Os granulados resultantes são secos em um secador de camada fluida para remover o excesso de água.

#### EXEMPLO 2G

15 Um pó de polvilhamento é preparado com a seguinte composição:

Ingrediente ativo	1 a 10%
Pó de talco superfino	99 a 90%

Os ingredientes são misturados intimamente e triturados adicionalmente tanto quanto necessário para obter um pó fino. Esse pó pode ser  
20 aplicado a um local de infestação por artrópodes, por exemplo, aterros sanitários, produtos armazenados ou materiais domésticos ou animais infestados, ou sob o risco de infestação por artrópodes, para controlar os artrópodes, por ingestão oral. Meios apropriados para distribuir o pó de polvilhamento no local da infestação por artrópodes incluem sopradores mecânicos,  
25 agitadores manuais ou dispositivos de autotratamento de animais de criação.

#### EXEMPLO 2H

Uma isca comestível é preparada com a seguinte composição:

Ingrediente ativo	0,1 a 1,0%
30 Farinha de trigo	80%
Melado	19,9 a 19%

Os ingredientes são misturados intimamente e moldados tal

- como necessário em um molde de isca. Essa isca comestível pode ser distribuída no local, por exemplo, instalações domésticas ou industriais, por exemplo, cozinhas, hospitais ou lojas, ou áreas externas, infestadas por artrópodes, por exemplo, formigas, gafanhotos, baratas ou moscas, para controlar os artrópodes por ingestão oral.

#### EXEMPLO 2I

Uma formulação de solução é preparada com a seguinte composição:

	Ingrediente ativo	15%
10	Dimetil sulfóxido	85%

- O ingrediente ativo é dissolvido em dimetil sulfóxido com mistura e/ou aquecimento, conforme necessário. Essa solução pode ser aplicada percutaneamente como uma aplicação de derramamento a animais domésticos infestados por artrópodes ou, após esterilização por filtração através de uma membrana de politetrafluoretileno (0,22 micrometros de tamanho de poro), por injeção parenteral, a uma quantidade de aplicação de 1,2 a 12 ml de solução por 100 kg de peso corporal do animal.

#### EXEMPLO 2J

Um pó umectável é preparado com a seguinte composição:

20	Ingrediente ativo	50%
	Ethylan BCP	5%
	Aerosil	5%
	Celite PF	40%

- O Ethylan BCP é absorvido sobre o Aerosil, que é depois misturado com os outros ingredientes e triturado em um martelo hidráulico, para dar um pó umectável, que pode ser diluído com água para uma concentração de 0,001% a 2% em peso do composto ativo e aplicado a um local de infestação por artrópodes, por exemplo, larvas dípteras ou nematódeos de plantas, por pulverização, ou a animais domésticos infestados ou sob risco de infestação por artrópodes, por pulverização ou imersão, ou por administração oral em água de beber, para controlar os artrópodes.

EXEMPLO 2K

Uma composição de bolo de liberação lenta é formada de granulados que contêm os seguintes componentes em percentagens variáveis (similares aos descritos para as composições precedentes), dependendo da

5 necessidade:

Ingrediente ativo

Agente de densidade

Agente de liberação lenta

Aglutinante

10 Os ingredientes misturados intimamente são moldados para granulados, que são comprimidos em um bolo, com uma gravidade específica de 2 ou mais. O mesmo pode ser administrado oralmente a animais domésticos ruminantes, para retenção dentro do rúmen reticular, para dar uma liberação lenta, contínua, do composto ativo por um período de tempo pro-

15 longado, para controlar a infestação de animais domésticos ruminantes por artrópodes.

EXEMPLO 2L

Uma composição de liberação lenta na forma de granulados, péletes, briquetes ou similar pode ser preparada com as seguintes composi-

20 ções:

Ingrediente ativo	0,5 a 25%
Cloreto de polivinila	75 a 99,5%
Ftalato de dioctila	(plastificante)

Os componentes são misturados e depois moldados em forma-

25 tos apropriados por extrusão de fusão ou moldagem. Essas composições são úteis, por exemplo, para adição à água parada ou para a fabricação de coleiras ou apêndices de identificação de orelha, para prender em animais domésticos, para controlar pragas por liberação lenta.

EXEMPLO 2M

Um granulado dispersível em água é preparado com a seguinte composição:

	Ingrediente ativo	85% (max)
5	Polivinilpirrolidona	5%
	Argila de atapulguita	6%
	Lauril sulfato de sódio	2%
	Glicerina	2%

Os ingredientes são misturados como uma pasta fluida de 45% com água e triturados a úmido para um tamanho de partícula de 4 microns, depois secos por pulverização para remover a água.

MÉTODOS DE USO PESTICIDA

Os procedimentos de teste representativos abaixo, usando compostos da invenção, foram realizados para determinar a atividade parasiticida e pesticida dos compostos da invenção.

MÉTODO A: Método de análise para testar a sistemicidade de compostos contra *Ctenocephalides felis* (pulgas felinas)

Um recipiente de teste foi enchido com 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Um cilindro de vidro foi fechado em uma extremidade com parafilme e colocado em cima do recipiente de teste. A solução de composto de teste foi então pipetada em sangue bovino e adicionada ao cilindro de gás. Os *Ctenocephalides felis* foram mantidos nesse teste de cão artificial (sangue, 37°C, 40-60% de umidade relativa; *Ctenocephalides felis* 20-22°C, 40-60% de umidade relativa) e a avaliação foi realizada a 24 e 48 horas após a aplicação.

Os compostos números 2-22, 3-04, 3-35, 4-20, 5-95, 5-113, 7-13, 7-34, 7-40, 7-73, 7-85, 7-79 deram pelo menos 90% de controle de *Ctenocephalides felis*, a uma concentração de teste de 5 ppm ou menos.

MÉTODO B: Teste de *Diabrotica undecimpunctata* (largarta de raízes de milho do sul)

Dois dias antes da aplicação, sementes de milho foram embebidas em água sob condições de calor, para favorecer uma rápida germina-

ção. Um dia antes da aplicação, ovos de *Diabrotica undecimpunctata* foram transferidos para uma metade de um papel de filtro japonês colocado em uma placa Petri de plástico. Depois, uma semente de milho brotada foi colocada em um suporte umedecido ao lado do papel de filtro. Três gotas de 200  
 5 microlitros da solução de composto de teste foram cuidadosamente pipetados sobre o ovo. O restante da solução foi colocado sobre o milho e depois a placa Petri foi fechada. Os ovos tratados nos placas Petri foram mantidos em uma câmara de climatização por 6 dias. A eficácia do composto (porcentagem de ovos e/ou larvas mortos em comparação com o controle não-tratado)  
 10 foi avaliada 6 dias após a aplicação usando um microscópio binocular.

Os compostos números 1-02, 1-05, 1-16, 1-20, 1-88, 3-20 e 3-35 deram pelo menos 90% de controle de *Diabrotica undecimpunctata*, a uma concentração de teste de 10 ppm.

**MÉTODO C:** Teste de *Nephotettix cincticeps* (gafanhoto de folhas de arroz)

15 As folhas de 12 plantas de arroz com um comprimento de haste de 8 cm foram imersas por 5 segundos em uma solução aquosa do composto de teste formulado. Depois de ter escorrido a solução, as plantas de arroz tratadas dessa maneira foram colocadas em uma placa Petri e inoculadas com aproximadamente 20 larvas (estágio L3) de *Nephotettix cincticeps*. A placa Petri foi fechada e depois armazenada em uma câmara climati-  
 20 zada (16 horas de luz/dia, 25°C, 40-60% de umidade relativa). Após 6 dias de armazenamento, foi determinada a mortalidade percentual das larvas de gafanhoto de folhas.

O composto número 1-20 deu pelo menos 98% de mortalidade  
 25 de larvas de *Nephotettix cincticeps*, a uma concentração de teste de 100 ppm.

**MÉTODO D:** Método de teste para testar atividade de contato contra *Ctenocephalides felis* (pulga felina)

Soluções dos compostos de teste foram despejadas sobre papel  
 30 de filtro, secas e o papel de filtro foi colocado em tubos de teste e infestado com 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Os *Ctenocephalides felis* tratados foram mantidos em uma câmara climatizada (26°C, 80% de umidade relati-

va) e a eficácia percentual foi determinada 24 horas e 48 horas após a aplicação, em comparação com o controle não-tratado.

Os compostos 3-35, 7-13, 7-34 deram pelo menos 70% de controle de contato de *Ctenocephalides felis*, a uma concentração de teste de 1000 ppm.

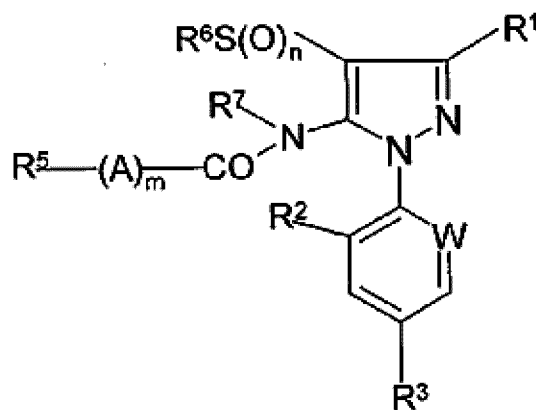
MÉTODO E: Método de teste para testar atividade de contato contra *Rhipicephalus sanguineus* (carrapato canino marrom)

Soluções dos compostos de teste foram despejadas sobre papel de filtro, secas e o papel de filtro foi colocado em tubos de teste e infestado com 20-30 larvas de *Rhipicephalus sanguineus* e os tubos foram fechados com um grampo. Os *Rhipicephalus sanguineus* tratados foram mantidos em uma câmara climatizada (25°C, 90% de umidade relativa) e a eficácia percentual foi determinada 24 horas após a aplicação, em comparação com o controle não-tratado.

Os compostos 3-04, 3-35, 7-13, 7-34 deram pelo menos 70% de controle de contato de *Rhipicephalus sanguineus*, a uma concentração de teste de 100 ppm.

## REIVINDICAÇÕES

1. Composto **caracterizado pelo** fato de apresentar a fórmula (I):



5

(I)

em que:

$R^1$  é  $(C_1-C_6)$ -haloalquila, CN,  $NO_2$  ou halogênio;

$R^2$  é H, halogênio ou  $CH_3$ ;

$R^3$  é  $(C_1-C_3)$ -haloalquila,  $(C_1-C_3)$ -haloalcóxi ou  $S(O)_p$ -

10  $(C_1-C_3)$ -haloalquila;

$W$  é N ou  $C-R^4$ ;

$R^4$  é halogênio ou  $CH_3$ ;

$A$  é  $(C_2-C_6)$ -alquileno ou  $(C_2-C_6)$ -haloalquileno;

ou é  $(C_3-C_6)$ -alquileno, no qual um carbono na cadeia é

15 substituído por O, S, SO,  $SO_2$  ou  $NR^8$ , com a condição de que o grupo substituinte não esteja ligado ao grupo  $R^5$  ou carbonila adjacente; ou é

$(C_2-C_6)$ -alquenileno ou  $(C_2-C_6)$ -haloalquenileno; ou é

$-\text{[(C}_1\text{-C}_3\text{)-alquil]}_r\text{-aril-[(C}_1\text{-C}_3\text{)alquil]}_s\text{-}$ , ou  $[(\text{C}_1\text{-C}_3)\text{-alquil}]_r\text{-heterociclicil-[(C}_1\text{-C}_3\text{)-alquil]}_s\text{-}$ , ou  $[(\text{C}_1\text{-C}_3)\text{-alquil}]_r(\text{C}_3\text{-C}_6)\text{-cicloalquil-[(C}_1\text{-C}_3\text{)-alquil]}_s\text{-}$  ou  $-\text{[(C}_1\text{-C}_3\text{)-alquil]}_r\text{-(C}_5\text{-C}_6\text{)-cicloalquenil-[(C}_1\text{-C}_3\text{)-alquil]}_s$ , sendo que  
 5 nos quatro grupos mencionados por último arila, heterociclicila, cicloalquila e cicloalquenila são não substituídas ou substituídas por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$ ,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-haloalquila}$ ,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alcóxi}$ ,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-haloalcóxi}$ ,  $\text{OR}^{11}$ ,  $\text{CN}$ ,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{S(O)}_p\text{R}^{10}$ ,  $\text{COR}^{10}$ ,  $\text{COOR}^{10}$ ,  $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ ,  
 10  $\text{SO}_2\text{NR}^9\text{R}^{10}$ ,  $\text{NR}^9\text{R}^{10}$ ,  $\text{OH}$ ,  $\text{SO}_3\text{H}$  e  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquilidenoimino}$ ;

$\text{R}^5$  é  $\text{CONR}^9\text{R}^{10}$  quando  $m$  for 0 ou 1; ou  $\text{R}^5$  é  $\text{NR}^9\text{R}^{17}$  quando  $m$  for 1; ou  $\text{R}^5$  é  $\text{CO}_2\text{R}^{10}$  quando  $m$  for 0;

$\text{R}^6$  é  $(\text{C}_1\text{-C}_3)\text{-alquila}$  ou  $(\text{C}_1\text{-C}_3)\text{-haloalquila}$ ;

15  $\text{R}^7$  é  $\text{H}$ ,  $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{-alquenila}$ ,  $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{-haloalquenila}$ ,  $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{-alquinila}$ ,  $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{-haloalquinila}$ ,  $(\text{C}_3\text{-C}_7)\text{-cicloalquila}$ ,  $\text{COR}^{11}$ ,  $\text{COR}^{12}$ ,  $\text{COR}^{13}$ ,  $-\text{CO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_6\text{)-alquila}$ ,  $-\text{CO}_2\text{-(CH}_2\text{)}_q\text{R}^{11}$ ,  $-\text{CO}_2\text{-(CH}_2\text{)}_q\text{R}^{13}$ ,  $-\text{CO}_2\text{-(C}_3\text{-C}_7\text{)-cicloalquila}$ ,  $-\text{CO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_6\text{)-alquil-(C}_3\text{-C}_7\text{)-cicloalquila}$ ,  $\text{CO-(C}_2\text{-C}_6\text{)-alquenila}$ ,  $-\text{CH}_2\text{R}^{11}$  ou  $\text{CH}_2\text{R}^{13}$ ; ou  
 20  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$ , não substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alcóxi}$ ,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-haloalcóxi}$ ,  $(\text{C}_3\text{-C}_7)\text{-cicloalquila}$ ,  $\text{S(O)}_p\text{R}^{14}$ ,  $\text{CO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_6\text{)-alquila}$ ,  $\text{O-(C=O)-(C}_1\text{-C}_6\text{)-alquila}$ ,  $\text{NR}^9\text{R}^{10}$ ,  $-\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ ,  $\text{SO}_2\text{NR}^9\text{R}^{10}$ ,  $\text{OH}$ ,  $\text{CN}$ ,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{OR}^{11}$ ,  $\text{OR}^{13}$ ,



$\text{NR}^{10}\text{COR}^9$ ,  $\text{NR}^{10}\text{SO}_2\text{R}^{14}$  e  $\text{COR}^{12}$ ;

$\text{R}^8$  é  $\text{R}^9$ ,  $\text{CO-R}^9$ ,  $\text{CO-R}^{11}$ ,  $\text{CO}_2\text{R}^{12}$  ou  $\text{CO-(C}_1\text{-C}_6\text{)-alquila}$ ,  
substituído por amino;

$\text{R}^9$  é H,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$ ,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-haloalquila}$ ,  $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{-}$   
5  $\text{alquenila}$ ,  $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{-haloalquenila}$ ,  $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{-alquinila}$ ,  $(\text{C}_2\text{-C}_6)\text{-}$   
 $\text{haloalquinila}$ ,  $(\text{C}_3\text{-C}_7)\text{-cicloalquila}$  ou  $-(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquil-(C}_3\text{-}$   
 $\text{C}_7)\text{-cicloalquila}$ ;

$\text{R}^{10}$  é  $\text{R}^9$ ,  $-(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquil}]_q\text{R}^{11}$ ,  $(\text{C}_1\text{-C}_3)\text{-alcóxi-(C}_1\text{-C}_3)\text{-}$   
 $\text{alquil-}$ ,  $(\text{C}_1\text{-C}_3)\text{-alcóxi-(C}_1\text{-C}_3)\text{-alcóxi-(C}_1\text{-C}_3)\text{-alquil-}$  ou  
10  $(\text{C}_1\text{-C}_3)\text{-alquil-S(O)}_p\text{-(C}_1\text{-C}_3)\text{-alquil-}$ ; ou

$\text{R}^9$  e  $\text{R}^{10}$  ou  $\text{R}^9$  e  $\text{R}^{17}$ , cada um, junto com o respectivo  
átomo de N ligado, formam um anel de quatro a sete membros,  
saturado, que opcionalmente contém um heteroátomo adicional  
no anel, que é escolhido dentre O, S e N, sendo que o anel  
15 é não substituído ou substituído por um ou mais radicais  
escolhidos do grupo que consiste em halogênio,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-}$   
 $\text{alquila}$ ,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-haloalquila}$  e  $\text{CO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$ ;

$\text{R}^{11}$  é fenila não substituída ou substituída por um ou  
mais radicais escolhidos de halogênio,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$ ,  $(\text{C}_1\text{-}$   
20  $\text{C}_6)\text{-haloalquila}$ ,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alcóxi}$ ,  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-haloalcóxi}$ ,  $\text{OR}^{16}$ ,  
 $\text{CN}$ ,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{S(O)}_p\text{R}^{12}$ ,  $\text{COR}^9$ ,  $\text{COOH}$ ,  $\text{COOR}^{12}$ ,  $\text{CONR}^9\text{R}^{15}$ ,  $\text{SO}_2\text{NR}^9\text{R}^{15}$ ,  
 $\text{NR}^9\text{R}^{15}$ ,  $\text{OH}$ ,  $\text{SO}_3\text{H}$  e  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquilidenoimino}$ ;

$\text{R}^{12}$  é  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$  ou  $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-haloalquila}$ ;

$\text{R}^{13}$  é heterociclila não substituída ou substituída por

um ou mais radicais que consistem em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi, S(O)<sub>p</sub>R<sup>12</sup>, OH e oxo;

R<sup>14</sup> é (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila ou -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila;

R<sup>15</sup> é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila ou -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila;

R<sup>16</sup> é fenila não substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalcóxi, CN, NO<sub>2</sub>, S(O)<sub>p</sub>R<sup>12</sup>, COR<sup>15</sup>, COOH, COOR<sup>12</sup>, CONR<sup>9</sup>R<sup>15</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>R<sup>15</sup>, NR<sup>9</sup>R<sup>15</sup> e OH;

R<sup>17</sup> é CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, -CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>R<sup>18</sup> ou CO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila;

R<sup>18</sup> é fenila não substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila e (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcóxi;

n e p são, independentemente um do outro, 0, 1 ou 2;

m e q são, independentemente um do outro, 0 ou 1;

r e s são, independentemente um do outro, 0 ou 1; e

cada heterociclila nos radicais acima mencionados é, independentemente, um radical heterocíclico com 3 a 7 átomos anelares e 1, 2 ou 3 heteroátomos no anel,

escolhidos do grupo que consiste em N, O e S;

ou um sal pesticidamente aceitável dos mesmos.

2. Composto ou um sal do mesmo, de acordo com a reivindicação 1, **caracterizado pelo** fato de que:

5  $R^{10}$  é  $R^9$ ,  $-[(C_1-C_6)\text{-alquil}]_q R^{11}$ ,  $(C_1-C_3)\text{-alcóxi-(C}_1\text{-C}_3\text{)-alquil-}$  ou  $(C_1-C_3)\text{-alcóxi-(C}_1\text{-C}_3\text{)-alcóxi-(C}_1\text{-C}_3\text{)-alquil-}$ ;

$R^{17}$  é  $CO_2(C_1-C_6)\text{-alquila}$ ,  $CO_2CH_2R^{18}$  ou  $CO(C_1-C_6)\text{-alquila}$ ; e os outros valores são tais como definidos na fórmula (I).

3. Composto ou um sal do mesmo, de acordo com a  
10 reivindicação 1 ou 2, **caracterizado pelo** fato de que  $R^1$  é CN.

4. Composto ou um sal do mesmo, de acordo com a reivindicação 1, 2 ou 3, **caracterizado pelo** fato de que  $R^2$  é Cl.

15 5. Composto ou um sal do mesmo, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 4, **caracterizado pelo** fato de que  $R^3$  é  $CF_3$ .

6. Composto ou um sal do mesmo, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 5, **caracterizado pelo** fato de  
20 que A é  $(C_1-C_6)\text{-alquilenos}$ ; ou é  $(C_1-C_6)\text{-alquilenos}$ , no qual um carbono na cadeia está substituído por O, S, SO,  $SO_2$  ou  $NR^8$ , com a condição de que o grupo substituinte não esteja ligado ao grupo  $R^5$  ou carbonila adjacente; ou é fenila não substituída ou substituída por

um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi, CN e NO<sub>2</sub>; ou é piridila não substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que  
 5 consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquila e (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcóxi.

7. Composto ou um sal do mesmo, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 6, **caracterizado pelo** fato de que R<sup>6</sup> é CF<sub>3</sub>.

10 8. Composto ou um sal do mesmo, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 7, **caracterizado pelo** fato de que:

R<sup>1</sup> é CN;

R<sup>2</sup> é Cl;

15 R<sup>3</sup> é CF<sub>3</sub>;

W é CR<sup>4</sup> e R<sup>4</sup> é Cl;

A é (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilenos; ou é (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilenos no qual um carbono na cadeia está substituído por O, S, SO, SO<sub>2</sub> ou NR<sup>8</sup>, com a condição de que o grupo substituinte não esteja  
 20 ligado ao grupo R<sup>5</sup> ou carbonila adjacente; ou é fenila não substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, CN e NO<sub>2</sub>; ou é piridila não substituída ou substituída por um ou mais

radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila e (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi;

R<sup>5</sup> é CONR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> quando m for 0 ou 1; ou R<sup>5</sup> é NR<sup>9</sup>R<sup>17</sup> quando m for 1; ou R<sup>5</sup> é CO<sub>2</sub>R<sup>10</sup> quando m for 0;

5 R<sup>6</sup> é (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila;

R<sup>7</sup> é hidrogênio ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila;

R<sup>8</sup> é R<sup>9</sup>, CO-R<sup>9</sup> ou CO-R<sup>11</sup>;

R<sup>9</sup> é H ou (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila;

10 R<sup>10</sup> é H, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquenila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-alquinila, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-haloalquinila, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila, -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alquil-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-cicloalquila ou -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>11</sup>; ou

15 R<sup>9</sup> e R<sup>10</sup>, juntos com o átomo de N ligado, formam um anel de cinco a seis membros, saturado, que opcionalmente contém um heteroátomo adicional no anel, que é escolhido dentre O, S e N, sendo que o anel é não-substituído ou substituído por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio e (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila;

20 R<sup>11</sup> é fenila não substituída ou substituída por um ou mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alcóxi, CN, NO<sub>2</sub>, S(O)<sub>p</sub>R<sup>12</sup> e NR<sup>9</sup>R<sup>15</sup>;

R<sup>12</sup> é (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-alquila ou (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-haloalquila;

$R^{15}$  é H,  $(C_1-C_2)$ -alquila ou  $(C_1-C_2)$ -haloalquila;

$R^{17}$  é  $CO_2(C_1-C_2)$ -alquila,  $CO_2CH_2R^{18}$  ou  $CO(C_1-C_2)$ -alquila;

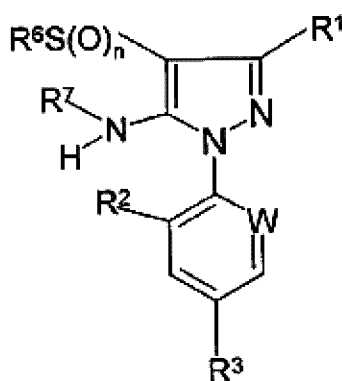
e

$R^{18}$  é fenila não substituída ou substituída por um ou

5 mais radicais escolhidos do grupo que consiste em halogênio,  $(C_1-C_2)$ -alquila,  $(C_1-C_2)$ -haloalquila e  $(C_1-C_2)$ -alcóxi.

9. Processo para a preparação de um composto de fórmula (I) ou um sal do mesmo como definido em qualquer  
10 uma das reivindicações 1 a 8 **caracterizado pelo** fato de que compreende:

a) quando  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , W, A, m e n forem tais como definidos na reivindicação 1, reagir um composto de fórmula (II)



(II)

em que  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , W e n são tais como definidos na reivindicação 1, com um composto de fórmula (III):



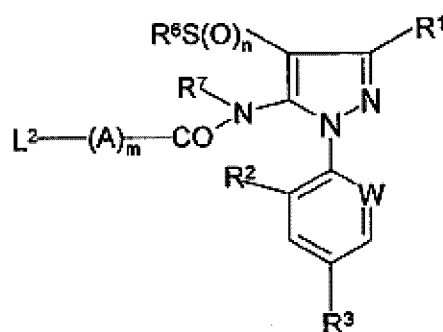
em que  $R^5$ , A e m são tais como definidos na reivindicação 1 e L é um grupo de saída; ou

b) quando  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ , W, A, m e n forem tais como definidos na reivindicação 1, e  $R^7$  for tal como definido na reivindicação 1, com a exclusão de hidrogênio, alquilar ou acilar o composto correspondente de fórmula (I), em que  $R^7$  é hidrogênio, com um composto de fórmula (IV):



em que  $R^7$  é tal como definido na reivindicação 1, com a exclusão de hidrogênio, e  $L^1$  é um grupo de saída;

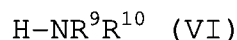
c) quando  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , W, A e n são tais como definidos na reivindicação 1,  $R^5$  for  $NR^9R^{10}$  e m for 1, substituir nucleofilicamente um composto correspondente de fórmula (V):



(V)

em que  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , A, W e n são tais como definidos na reivindicação 1, m é 1 e  $L^2$  é um grupo de

saída, com um composto de fórmula (VI):



em que  $\text{R}^9$  e  $\text{R}^{10}$  são tais como definidos na reivindicação 1; ou

- 5        d) quando  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ ,  $\text{R}^3$ ,  $\text{R}^5$ ,  $\text{R}^6$ ,  $\text{R}^7$ , W, A,  $\text{L}^2$ , m e n forem tais como definidos na reivindicação 1, acilar um composto de fórmula (II) com um composto de fórmula (VII):



10        em que  $\text{L}^2$ , A e m são tais como definidos na reivindicação 1; ou

      e) quando  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ ,  $\text{R}^3$ ,  $\text{R}^5$ ,  $\text{R}^6$ ,  $\text{R}^7$ , W, A e m forem tais como definidos na reivindicação 1, e n for 1 ou 2, oxidar um composto correspondente, no qual n é 0 ou 1; e

15        f) caso desejado, converter um composto resultante de fórmula (I) em um sal pesticidamente aceitável do mesmo.

10. Composição pesticida **caracterizada pelo** fato de que compreende um composto de fórmula (I) ou um sal pesticidamente aceitável do mesmo, tal como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 8, em associação com um  
20        diluente ou veículo e/ou agente tensoativo pesticidamente aceitável.

11. Uso de um composto de fórmula (I) ou sal do mesmo como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 8 **caracterizado pelo** fato de ser para a preparação de um



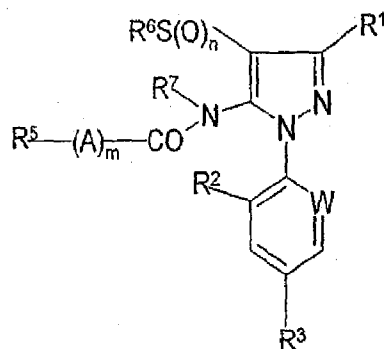
medicamento veterinário para o controle de pragas.

12. Uso de uma composição como definida na reivindicação 10 **caracterizado pelo** fato de ser para a preparação de um medicamento veterinário para o controle de  
5 pragas.

## RESUMO

Patente de Invenção: "DERIVADOS DE 5-(ACILAMINO)PIRAZOL PESTICIDAS".

A presente invenção refere-se a derivados de acilaminopirazol  
5 substituídos da fórmula (I)



(I)

ou sais dos mesmos, nos quais os diversos símbolos são tais como definidos na descrição, processos para preparação dos mesmos, composições dos mesmos, e uso dos mesmos para o controle de pragas, tal como artrópodes (por exemplo, insetos e aracnídeos) e helmintos.