

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

(21) **PI0706733-0 A2**

(22) Data de Depósito: 18/01/2007
(43) Data da Publicação: 05/04/2011
(RPI 2100)



(51) *Int.Cl.*:
C07D 403/04
C07D 403/14
A01N 43/54
A01P 3/00

(54) Título: **DERIVADO DE AMINOPIRIMIDINA E AGENTE DE CONTROLE DE DOENÇA DE PLANTA PARA USO AGRÍCOLA OU HORTICULTURAL**

(30) Prioridade Unionista: 23/01/2006 JP 2006-014392

(73) Titular(es): Ihara Chemical Industry CO. LTD, Kumiai Chemical Industry CO. LTD

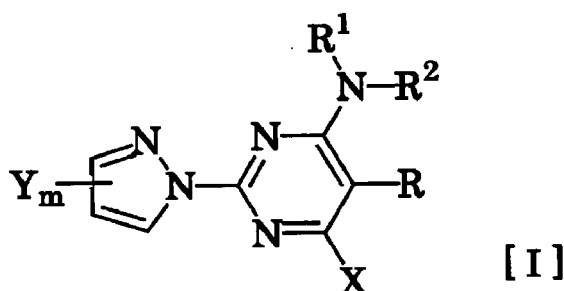
(72) Inventor(es): Atsushi Kogure, Hirokazu Arai, Junichiro Bessho, Masao Nakatani, Norihisa Yonekura, Ryo Hanai, Yuuki Hirano

(74) Procurador(es): Dannemann, Siemsen, Bigler & Ipanema Moreira

(86) Pedido Internacional: PCT JP2007050674 de 18/01/2007

(87) Publicação Internacional: WO 2007/083692 de 26/07/2007

(57) Resumo: DERIVADO DE AMINOPIRIMIDINA E AGENTE DE CONTROLE DE DOENÇA DE PLANTA PARA USO AGRÍCOLA OU HORTICULTURAL. A presente invenção refere-se a um derivado de aminopirimidina que exiba um efeito significativo sobre uma doença de planta e um agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural que contém como um ingrediente ativo o derivado de aminopirimidina, um agente de controle de doença de planta caracterizado por conter como um ingrediente ativo um ou mais compostos selecionados dos derivados de aminopirimidina representados pela Fórmula Geral [1]: em que R é um substituinte tal como um grupo 02-10 alquila; R¹ e R² são cada qual independentemente um átomo de hidrogênio ou um substituinte tal como um grupo 01-10 alquila opcionalmente substituído; X e um átomo de hidrogênio ou um substituinte selecionado do Grupo Substituinte predefinido; Y é um substituinte selecionado de um Grupo Substituinte predefinido; e m é um número inteiro de 0 a 3 e sais agricolamente aceitáveis destes. O agente soluciona os problemas de agentes de controle de doença de planta convencionais e também tem excelente efeito de controle, eficácia residual e similares.



[I]



Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**DERIVADO DE AMINOPIRIMIDINA E AGENTE DE CONTROLE DE DOENÇA DE PLANTA PARA USO AGRÍCOLA OU HORTICULTURAL**".

Campo Técnico

5 A presente invenção refere-se a um novo derivado de aminopirimidina e um agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural.

Antecedente da Técnica

10 Neste contexto, foi reportado em, por exemplo, Documento de Patente 1, Documento de Patente 2, Documento de Patente 3, Documento de Patente 4 e Documento de Patente 5, que um certo tipo de derivados de aminopirimidina tem um efeito de controle de doença. Entretanto, o derivado de aminopirimidina descrito no relatório descritivo do presente pedido não é descrito nestes documentos. Além disso, vários derivados de aminopirimidina foram sintetizados e reportados no Documento de Não-Patente 1 e similares, porém não existe nenhum relato relacionado com o efeito de controle de doença.

 Documento de Patente 1: JP-A Nº S54-115384 (Reivindicações e outros)

20 Documento de Patente 2: JP-A Nº S55-036402 (Reivindicações e outros)

 Documento de Patente 3: WO 2002/074753 (Reivindicações e outros)

25 Documento de Patente 4: WO 2004/103978 (Reivindicações e outros)

 Documento de Patente 5: JP-A Nº 2005-232081 (Reivindicações e outros)

 Documento de Não-Patente 1: *Revista de Chimie*, Vol. 38 Nº 8, p. 674-679,

30 Descrição da Invenção

Problemas a serem Solucionados pela Invenção

 Para desenvolver-se colheitas agrícolas e horticólicas, muitos

agentes e controle têm sido usados contra doenças de colheita. Entretanto, com os agentes de controle tradicionais, nesse contexto houve casos onde o efeito de controle é insuficientemente exibido ou seu uso é limitado devido à emergência de resistência de organismo patogênico ao fármaco, ou fitotoxicidade ou contaminação às plantas é causada, ou dos pontos de vista de toxicidade ao homem e bestas e peixes e efeito sobre o ambiente, existem muito poucos agentes de controle que são satisfatórios. Conseqüentemente, o advento de um agente de controle de doença que tem poucos dos tais defeitos e pode ser seguramente usado foi exigido.

Um objeto da invenção é fornecer um agente de controle de doença de planta que é livre dos problemas acima mencionados possuídos pelo agente de controle de doença de planta tradicional e também tem excelente efeito de controle, eficácia residual e similares.

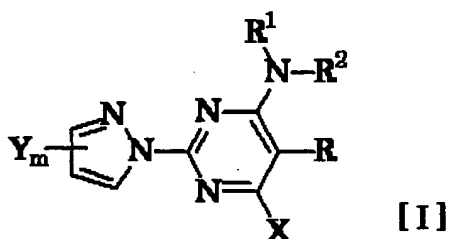
Métodos para Solucionar os Problemas

Sob estas circunstâncias, os presentes inventores conduziram estudos extensivos sobre o efeito de controle de doença e segurança para colheitas e como um resultado, eles descobriram que um novo derivado de aminopirimidina tem excelente efeito de controle de doença e segurança para as colheitas. Desse modo, eles completaram a invenção.

Isto é, a invenção fornece os seguintes (1) a (8):

(1) um agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural, que é caracterizado por conter como um ingrediente ativo um ou mais compostos selecionados de derivados de aminopirimidina representados pela Fórmula Geral [I]:

[Fórmula Química 1]



em que

R é um grupo C₁₋₁₀ alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo

C₃₋₈ cicloalquil C1-3 alquila, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C2-6 alquênica, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C₃₋₈ cicloalquênica, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ hidroxialquila, um grupo C₁₋₆ alcóxi C₁₋₆ alquila, um grupo 1,3-dioxoln-2-ila ou um grupo 2,3-dioxan-2-ila;

- 5 R1 e R2 são cada qual independentemente um átomo de hidrogênio, um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α , um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α , um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquênica, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, enquanto R1 e R2 podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R1 e R2 são ligados;

20 X é um átomo de hidrogênio ou um substituinte selecionado do Grupo Substituinte α ;

Y é um substituinte selecionado do Grupo Substituinte α ;

e

- 25 m é um número inteiro de 0 a 3,
enquanto o Grupo Substituinte α sendo definido como segue:

"Grupo Substituinte α ":

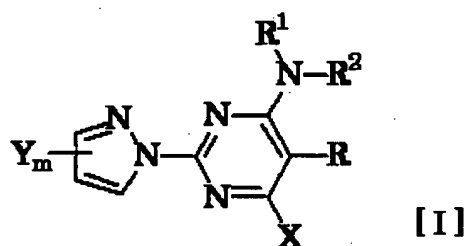
- um átomo de halogênio, um grupo C1-10 alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C1-3 alquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquênica, um grupo C1-10 alcóxi, um grupo C₁₋₆ alcóxi C1-3 alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquilóxi, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C1-3 alquilóxi, um grupo C₁₋₆ haloalcóxi, um grupo C2-6 alquinilóxi, um grupo C2-6 alqueni-

lói, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C₁₋₆ alquiltio, um grupo C₁₋₆ alquil-sulfonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquiltio, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo ciano, um grupo amino, um grupo nitro, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ hidroxialquila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)amino, um grupo di(C₁₋₆ alquil)amino, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo carboxila, um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila, um grupo carbamoila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo tiol, um grupo tiocianato, um grupo tri(C₁₋₆ alquil)silila, um grupo benzilói opcionalmente substituído, um grupo hidroximinometila, um grupo C₁₋₆ alcóxiiminometila e um grupo fenila opcionalmente substituído] e sais agricolamente aceitáveis destes;

(2) um derivado de aminopirimidina representado pela Fórmula

Geral (I)

[Fórmula Química 2]



em que

R é um grupo C₂₋₁₀ alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C₁₋₃ alquila, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C₂₋₆ alquenila, um grupo C₂₋₆ alquinila, um grupo C₃₋₈ cicloalquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ hidroxialquila, um grupo C₁₋₆ alcóxi C₁₋₆ alquila, um grupo 1,3-dioxolan-2-ila ou um grupo 1,3-dioxan-2-ila;

R¹ e R² são cada qual independentemente um átomo de hidrogênio, um grupo C₁₋₁₀ alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α, um grupo C₁₋₁₀ alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₂₋₆ alquinila, um grupo C₂₋₆ alquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila, um grupo carbamoila, um

- grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, enquanto R¹ e R² podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R¹ e R² são ligados;
- 10 X é um átomo de hidrogênio ou um substituinte selecionado do Grupo Substituinte α;
- Y é um substituinte selecionado do Grupo Substituinte α;
- e
- m é um número inteiro de 0 a 3,
- 15 enquanto o Grupo Substituinte α sendo definido como segue:
- "Grupo Substituinte α":
- um átomo de halogênio, um grupo C₁₋₁₀ alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C₁₋₃ alquila, um grupo C₂₋₆ alquinila, um grupo C₂₋₆ alquenila, um grupo C₁₋₁₀ alcóxi, um grupo C₁₋₆ alcóxi C₁₋₃ alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquilóxi, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C₁₋₃ alquilóxi, um grupo C₁₋₆ haloalcóxi, um grupo C₂₋₆ alquinilóxi, um grupo C₂₋₆ alqueni-
 20 lóxi, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C₁₋₆ alquiltio, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquiltio, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo ciano, um
 25 grupo amino, um grupo nitro, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ hidroxilalquila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)amino, um grupo di(C₁₋₆ alquil)amino, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo carboxila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo tiol, um grupo tiocianato, um grupo tri(C₁₋₆ alquil)silila, um grupo benzilóxi opcionalmente substituído, um grupo hidroximinometila, um grupo C₁₋₆ alcoxiiminometila e um grupo fenila opcionalmente substituído ou um sal agricolamente aceitável destes;
- 30

(3) o derivado de aminopirimidina ou um sal agricolamente aceitável destes como descrito em (2),

em que, na Fórmula Geral [I],

R^1 é um átomo de hidrogênio, um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α , um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α , um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila e

R^2 é um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α , um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α , um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcóxi-carbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, enquanto R^1 e R^2 podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R^1 e R^2 são ligados;

(4) o derivado de aminopirimidina ou um sal agricolamente aceitável destes como descrito em (2),

em que, na Fórmula Geral [I],

R^1 é um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte β , um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α , um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil) aminossulfonila ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila e

R^2 é um átomo de hidrogênio, um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α , um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α , um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil) aminossulfonila ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila,

enquanto R^1 e R^2 podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros é independentemente substituído com 1 a 4 átomos de halogênio e/ou um grupo C₁₋₆ haloalquila) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R^1 e R^2 são ligados, onde Grupo Substituinte β sendo definido como segue:

"Grupo Substituinte β ":

um átomo de halogênio, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C₃₋₈ cicloalquilóxi, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C1-3 alquilóxi, um grupo C₁₋₆ haloalalcóxi, um grupo C2-6 alquinilóxi, um grupo C2-6 alquenilóxi, um grupo C₁₋₆

haloalquila, um grupo C₁₋₆ alquiltio, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquiltio, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo ciano, um grupo nitro, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo carboxila, um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila e um grupo tri(C₁₋₆ alquil)silila;

(5) o derivado de aminopirimidina ou um sal agricolamente aceitável destes como descrito em (2),

em que, na Fórmula Geral [I],

10 R¹ é um átomo de hidrogênio, um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α, um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila e

20 R² é um átomo de hidrogênio, um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte β, um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituinte α, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, enquanto R¹ e R² podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros é independentemente substituído com 1 a 4 átomos de halogênio e/ou um grupo C₁₋₆ haloalquila) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio

gênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R^1 e R^2 são ligados,

onde Grupo Substituente β sendo definido como segue:

"Grupo Substituente β ":

5 um átomo de halogênio, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C₃₋₈ cicloalquilóxi, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C1-3 alquilóxi, um grupo C₁₋₆ haloalcóxi, um grupo C2-6 alquinilóxi, um grupo C2-6 alquenilóxi, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C₁₋₆ alquiltio, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquiltio, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila,
10 um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo ciano, um grupo nitro, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo carboxila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila e um grupo tri(C₁₋₆ alquil)silila;

(6) o derivado de aminopirimidina ou um sal agricolamente aceitável destes como descrito em (5),
15

em que, na Fórmula Geral [I],

R^2 é um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituente β , um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados
20 de Grupo Substituente α , um grupo C2-6 alquinila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila ou
25 um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, enquanto R^1 e R^2 podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros é independentemente substituído com 1 a 4 átomos de halogênio e/ou um grupo C₁₋₆ haloalquila) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de
30 nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R^1 e R^2 são ligados;

(7) um agente de controle de doença de planta para uso agrícola

ou horticultural, que é caracterizado por conter como um ingrediente ativo um ou mais compostos selecionados do derivado de aminopirimidina como descrito em qualquer um de (2) a (6) e um sal agricolamente aceitável; e

- (8) um método de utilizar um agente, que inclui aplicar uma
 5 quantidade eficaz de um ou mais compostos selecionados do derivado de aminopirimidina como descrito em qualquer um de (2) a (6) e um sal agricolamente aceitável destes para alvejar colheitas úteis ou solo, para proteger as colheitas úteis de doença de planta.

Vantagem da Invenção

- 10 O derivado de aminopirimidina da Invenção (a seguir, referido como 'composto do presente pedido') é um novo composto conhecido em literaturas.

- O agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural de acordo com a invenção tem um efeito de controle elevado
 15 sobre *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani*, *Erysifegraminis*, *Septoria nodorum*, *Septoria tritici*, *Puccinia recondite*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Botrytis cinerea*, *Colletotrichum lagenarium*, *Venturia inaequalis*, *Physalospora piricola*, *Plasmopara viticola* e similares e também tem uma característica de exibir excelente eficácia residual e resistência à chuma sem causar um dano
 20 à colheita. Desse modo, o agente é útil como um agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural.

Melhor Modo para Realizar a Invenção

Definição de símbolos e termos usados no presente relatório descritivo como mostrado abaixo.

- 25 O átomo de halogênio representa um átomo de flúor, um átomo de cloro, um átomo de bromo, ou um átomo de iodo.

Uma notação tal como C₁₋₆ refere-se a um número de átomos de carbono do seguinte substituinte, que é de 1 a 6 neste caso.

- O grupo C₁₋₆ alquila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo alquila de cadeia linear ou ramificada tendo
 30 1 a 6 átomos de carbono. Exemplos destes podem incluir grupos tais como metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, sec-butila, isobutila, terc-butila, n-

pentila, 1-metilbutila, 2-metilbutila, 3-metilbutila, 1-etilpropila, 1,1-dimetilpropila, 1,2-dimetilpropila, neopentila, n-hexila, 1-metilpentila, 2-metilpentila, 3-metilpentila, 4-metilpentila, 1-etilbutila, 2-etilbutila, 1,1-dimetilbutila, 1,2-dimetilbutila, 1,3-dimetilbutila, 2,2-dimetilbutila, 2,3-dimetilbutila, 3,3-dimetilbutila, 1,1,2-trimetilpropila, 1,2,2-trimetilpropila, 1-etil-1-metilpropila e 1-etil-2-metilpropila.

O grupo C₁₋₁₀ alquila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo alquila de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 10 átomos de carbono. Exemplos destes podem incluir grupos tais como heptila, 1-metilhexila, 5-metilhexila, 1,1-dimetilpentila, 2,2-dimetilpentila, 4,4-dimetilpentila, 1-etilpentila, 2-etilpentila, 1,1,3-trimetilbutila, 1,2,2-trimetilbutila, 1,3,3-trimetilbutila, 2,2,3-trimetilbutila, 2,3,3-trimetilbutila, 1-propilbutila, 1,1,2,2-tetrametilpropila, octila, 1-metilheptila, 3-metilheptila, 6-metilheptila, 2-etilhexila, 5,5-dimetilhexila, 2,4,4-trimetilpentila, 1-etil-1-metilpentila, n-nonila, 1-metiloctila, 2-metiloctila, 3-metiloctila, 7-metiloctila, 1-etilheptila, 1,1-dimetilheptila, 6,6-dimetilheptila, decila, 1-metilnonila, 2-metilnonila, 6-metilnonila, 1-etiloctila, 1-propilheptila e n-decila, além dos exemplos acima de grupo C₁₋₆ alquila.

O grupo C₃₋₈ cicloalquila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo cicloalquila tendo 3 a 8 átomos de carbono. Exemplos destes podem incluir grupos tais como ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, ciclohexila, cicloheptila e ciclooctila.

O grupo C₃₋₈ cicloalquil C1-3 alquila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo cicloalquil-alquila onde a porção cicloalquila tem os mesmos significados como definido acima e a porção alquila é um grupo alquila de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 3 átomos de carbono. Exemplos podem incluir grupos tais como ciclopropilmetila, 1-ciclopropiletila, 2-ciclopropiletila, 1-ciclopropilpropila, 2-ciclopropilpropila, 3-ciclopropilpropila, ciclobutilmetila, ciclopentilmetila e cicloexilmetila.

O grupo C₁₋₆ haloalquila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo alquila de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono enquanto o grupo é substituído com 1 a 13

átomos de halogênio que podem ser iguais a ou diferentes um do outro. Exemplos destes podem incluir grupos tais como fluorometila, clorometila, bromometila, difluor-5 metila, diclorometila, trifluorometila, triclorometila, clorodifluorometila, bromodifluorometila, 2-fluoroetila, 1-cloroetila, 2-cloroetila, 1-bromoetila, 2-bromoetila, 2,2-difluoroetila, 2-cloro-2,2-difluoroetila, 1,2-dicloroetila, 2,2-dicloroetila, 2,2,2-trifluoroetila, 2,2,2-tricloroetila, 1,1,2,2-tetrafluoroetila, pentafluoroetila, 2-bromo-2-cloroetila, 2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetila, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetila, 1-cloropropila, 2-cloropropila, 3-cloropropila, 2-bromopropila, 3-bromopropila, 2-bromo-1-metiletila, 3-iodopropila, 2,3-dicloropropila, 2,3-15 dibromopropila, 3,3,3-trifluoropropila, 3,3,3-tricloropropila, 3-bromo-3,3-difluoropropila, 3,3-dicloro-3-fluoropropila, 2,2,3,3-tetrafluoropropila, 1-bromo-3,3,3-trifluoropropila, 2,2,3,3,3-pentafluoropropila, 2,2,2-trifluor-1-trifluorometiletila, heptafluoropropila, 1,2,2,2-tetrafluor-20 1-trifluorometiletila, 2,3-dicloro-1,1,2,3,3-pentafluoropropila, 1-fluor-1-metiletila, 1-metil-2,2,2-trifluoroetila, 2-clorobutila, 3-clorobutila, 4-clorobutila, 2-cloro-1,1-dimetiletila, 4-bromobutila, 3-bromo-2-metilpropila, 2-bromo-1,1-dimetiletila, 2,2-dicloro-1,1-dimetiletila, 2-cloro-1-clorometil-2-metiletila, 4,4,4-trifluorobutila, 3,3,3-trifluor-1-metilpropila, 3,3,3-trifluor-2-metilpropila, 2,3,4-triclorobutila, 2,2,2-tricloro-1,1-dimetiletila, 4-cloro-4,4-difluorobutila, 4,4-dicloro-4-fluorobutila, 4-bromo-4,4-difluorobutila, 2,4-dibromo-4,4-difluorobutila, 3,4-dicloro-3,4,4-trifluorobutila, 3,3-dicloro-4,4,4-trifluorobutila, 4-bromo-3,3,4,4-tetrafluorobutila, 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluorobutila, 2,2,3,3,4,4-hexafluorobutila, 2,2,3,4,4,4-hexafluorobutila, 2,2,2-trifluor-1-metil-1-trifluorometiletila, 3,3,3-trifluor-2-trifluorometilpropila, 2,2,3,3,4,4,4-heptafluorobutila, 2,3,3,3-tetrafluor-2-trifluorometilpropila, 1,1,2,2,3,3,4,4-octafluorobutila, nonafluorobutila, 4-cloro-1,1,2,2,3,3,4,4-octafluorobutila, 5-fluoropentila, 5-cloropentila, 5,5-difluoropentila, 5,5-dicloropentila, 5,5,5-trifluoropentila, 6,6,6-trifluorohexila e 5,5,6,6,6-pentafluorohexila.

O grupo C2-6 alquenila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo alquenila de cadeia linear ou ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono. Exemplos destes podem incluir grupos tais como vinila, 1-propenila, isopropenila, 2-propenila, 1-butenila, 1-metil-1-pro-

penila, 2-butenila, 1-metil-2-propenila, 3-butenila, 2-metil-1-propenila, 2-metil-2-propenila, 1,3-butadienila, 1-pentenila, 1-etil-2-propenila, 2-pentenila, 1-metil-1-butenila, 3-pentenila, 1-metil-2-butenila, 4-pentenila, 1-metil-3-butenila, 3-metil-1-butenila, 1,2-dimetil-2-propenila, 1,1-dimetil-2-propenila, 2-metil-2-butenila, 3-etil-2-butenila, 1,2-dimetil-1-propenila, 2-metil-3-butenila, 3-metil-3-butenila, 1,3-pentadienila, 1-vinil-2-propenila, 1-hexenila, 1-propil-2-propenila, 2-hexenila, 1-metil-1-pentenila, 1-etil-2-butenila, 3-hexenila, 4-hexenila, 5-hexenila, 1-metil-4-pentenila, 1-etil-3-butenila, 1-(isobutil)vinila, 1-etil-1-metil-2-propenila, 1-etil-2-metil-2-propenila, 1-(isopropil)-2-propenila, 2-metil-2-pentenila, 3-metil-3-pentenila, 4-metil-3-pentenila, 1,3-dimetil-2-butenila, 1,1-dimetil-3-butenila, 3-metil-4-pentenila, 4-metil-4-pentenila, 1,2-dimetil-3-butenila, 1,3-dimetil-3-butenila, 1,1,2-trimetil-2-propenila, 1,5-hexadienila, 1-vinil-3-butenila e 2,4-hexadienila.

O grupo C_{3-8} cicloalquenila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo alquenila cíclico tendo 3 a 8 átomos de carbono. Exemplos destes podem incluir grupos tais como 1-ciclopentenila, 2-ciclopentenila, 3-ciclopentenila, 1-ciloexenila, 2-ciloexenila, 3-ciloexenila, 2-ciloeptenila e 2-ciclooctenila.

O grupo C_{2-6} alquinila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo alquinila de cadeia linear ou ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono. Exemplos destes podem incluir grupos tais como etinila, 1-propinila, 2-propinila, 1-butinila, 1-metil-2-propinila, 2-butinila, 3-butinila, 1-pentinila, 1-etil-2-propinila, 2-pentinila, 3-pentinila, 1-metil-2-butinila, 4-pentinila, 1-metil-3-butinila, 2-metil-3-butinila, 1-hexinila, 1-(n-propil)-2-propinila, 2-hexinila, 1-etil-2-butinila, 3-hexinila, 1-metil-2-pentinila, 1-metil-3-pentinila, 4-metil-1-pentinila, 3-metil-1-pentinila, 5-hexinila, 1-etil-3-butinila, 1-etil-1-metil-2-propinila, 1-(isopropil)-2-propinila, 1,1-dimetil-2-butinila e 2,2-dimetil-3-butinila.

O grupo C_{1-10} alcóxi representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo $(C_{1-10} \text{ alquil})-O-$, onde a porção alquila tem os mesmos significados como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como metóxi, etóxi, propóxi, n-propóxi, isopropóxi, butóxi,

pentilóxi e hexilóxi.

O grupo C_{1-6} alcóxi C1-3 alquila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo $(C_{1-6} \text{ alquil})-O-(C1-3 \text{ alquil})$, onde a porção alquila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos
 5 podem incluir grupos tais como metoximetila, etoximetila, n-propoximetila, iso-propoximetila, n-butoximetila, iso-butoximetila, sec-butoximetila, n-pentiloximetila, 2-pentiloximetila, 3-pentiloximetila, n-hexiloximetila, 1-metoxietila, 1-etoxietila, 1-metoxipropila, 1-etoxipropila, 2-metoxietila, 2-etoxietila, 3-metoxipropila, 3-etoxipropila, 2-metoxipropila, 2-etoxipropila, 2-metóxi-1-
 10 metiletela e 2-etóxi-1-metiletela.

O grupo C_{1-6} haloalcóxi representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo $(C_{1-6} \text{ alquil})-O-$, onde a porção alquila tem o mesmo significado como definido acima. A porção alquila representa um substituinte substituído com 1 a 13 átomos de halogênio que podem ser i-
 15 guais a ou diferentes um do outro.

Exemplos do grupo podem incluir grupos tais como clorometóxi, difluorometóxi, clorodifluorometóxi, trifluorometóxi, 2,2-difluoroetóxi e 2,2-trifluoroetóxi.

O grupo C_{3-8} cicloalquilóxi representa, a menos que de outro
 20 modo particularmente definido, um grupo $(C_{3-8} \text{ cicloalquil})-O-$, onde a porção cicloalquila tem o mesmo significado como definido acima.

Exemplos podem incluir grupos tais como ciclopropilóxi, ciclobutilóxi, ciclopentilóxi e ciloexilóxi.

O grupo C_{3-8} cicloalquil C1-3 alquilóxi representa, a menos que
 25 de outro modo particularmente definido, um grupo $(C_{3-8} \text{ cicloalquil}-C1-3 \text{ alquil})-O-$, onde a porção cicloalquilalquila tem os mesmos significados como definido acima. Exemplos podem incluir grupos tais como ciclopropilmetóxi, 1-ciclopropiletóxi, 2-ciclopropiletóxi, 1-ciclopropilpropóxi, 2-ciclopropilpropóxi, 3-ciclopropilpropóxi, ciclobutilmetóxi, ciclopentilmetóxi e ciloexil-
 30 metóxi.

O grupo C2-6 alquenilóxi e o grupo C2-6 alquinilóxi representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo $(C2-6 \text{ alque-})$

nil)-O- e um grupo (C₂₋₆ alquinil)-O-, respectivamente, onde a porção alquênica e a porção alquinila têm os mesmos significados como definido acima. Exemplos podem incluir grupos tais como 2-propenilóxi e 2-propinilóxi.

O grupo C₁₋₆ hidroxialquila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo C₁₋₆ alquila, enquanto que um grupo hidroxila é substituído. Exemplos podem incluir grupos tais como hidroximetila, 1-hidroxietila, 1-hidroxipropila, 1-hidróxi-1-metiletela e 1-hidróxi-2-metilpropila.

O grupo C₁₋₆ alquiltio, o grupo C₁₋₆ alquilsulfonila e o grupo C₁₋₆ alquilsulfonila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo (C₁₋₆ alquil)-S-, um grupo (C₁₋₆ alquil)-SO- e um grupo (C₁₋₆ alquil)-SO₂-, respectivamente, onde a porção alquila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, metilsulfonila, metilsulfonila, etilsulfonila, n-propilsulfonila e isopropilsulfonila.

O grupo mono(C₁₋₆ alquil)amino representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo (C₁₋₆ alquil)-NH-, onde a porção alquila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como metilamino, etilamino, n-propilamino e isopropilamino.

O grupo di(C₁₋₆ alquil)amino representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo di(C₁₋₆ alquil)N- onde a porção alquila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como dimetilamino, dietilamino, metiletilamino, dipropilamino e dibutilamino.

O grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo (C₁₋₆ alquil)-NHCO onde a porção alquila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como metilaminocarbonila e etilaminocarbonila.

O grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo di(C₁₋₆ alquil)NCO₁₀ onde

a porção alquila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como dimetilaminocarbonila, dietilaminocarbonila, metiletilaminocarbonila, dipropilaminocarbonila e dibutilaminocarbonila.

5 O grupo mono(C_{1-6} alquil)aminossulfonila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo (C_{1-6} alquil)-NHSO₂- onde a porção alquila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como metilaminossulfonila e etilaminossulfonila.

10 O grupo di(C_{1-6} alquil)aminossulfonila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo di(C_{1-6} alquil)NSO₂- onde a porção alquila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como dimetilaminossulfonila, dietilaminossulfonila, metiletilaminossulfonila, dipropilaminossulfonila e dibutilaminossulfonila.

15 O grupo C_{1-6} alcóxicarbonila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo (C_{1-6} alquil)-O(C=O)-, onde a porção alquila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como metóxicarbonila, etóxicarbonila, n-propóxicarbonila, isopropóxicarbonila e t-butoxicarbonila.

O grupo C_{1-6} acila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo acila alifático de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono. Exemplos destes podem incluir grupos tais como formil, acetila, propionila, isopropionila, butirila e pivaloíla.

25 O grupo C_{1-6} haloalquiltio, o grupo C_{1-6} haloalquilsulfonila e o grupo C_{1-6} haloalquilsulfonila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo (C_{1-6} haloalquil)-S-, um grupo (C_{1-6} haloalquil)-SO- e um grupo (C_{1-6} haloalquil)-SO₂-, respectivamente, onde a porção haloalquila tem o mesmo significado como definido acima, respectivamente.

30 Exemplos destes podem incluir grupos tais como difluorometiltio, trifluorometiltio, clorometilsulfonila, difluorometilsulfonila, trifluorometilsulfonila, clorometilsulfonila, difluorometilsulfonila e trifluorometilsulfonila.

O grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo (C₁₋₆ haloalquil)-CO-, onde a porção haloalquila tem os mesmos significados como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como cloroacetila, trifluoroacetila e pentafluoropropionila.

O grupo tri(C₁₋₆ alquil)silila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo tri(C₁₋₆ alquil)silila, onde a porção alquila tem os mesmos significados como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como trimetilsilila, trietilsilila, tri(n-propil)silila, tri(n-butil)silila e tri(n-hexil)silila.

O grupo C₁₋₆ alcoxiiminometila representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo (C₁₋₆ alquil)-O-N=CH-, onde a porção alcóxi tem os mesmos significados como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como metóxiiminometila e etoxiiminometila.

O grupo fenila opcionalmente substituído representa, a menos que de outro modo particularmente definido, grupos tais como fenila, 2-clorofenila, 3-clorofenila, 4-clorofenila, 2-fluorofenila, 3-fluorofenila, 4-fluorofenila, 2-metilfenila, 3-metilfenila, 4-metilfenila, 2-metoxifenila, 3-metoxifenila, 4-metoxifenila, 2-nitrofenila, 3-nitrofenila e 4-nitrofenila.

O grupo benzilóxi opcionalmene substituído representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo (fenil)-CH₂-O, onde a porção fenila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como benzilóxi, 2-clorobenzilóxi, 3-clorobenzilóxi, 4-clorobenzilóxi, 2-fluorobenzilóxi, 3-fluorobenzilóxi, 4-fluorobenzilóxi, 2-metilbenzilóxi, 3-metilbenzilóxi, 4-metilbenzilóxi, 2-metoxibenzilóxi, 3-metoxibenzilóxi, 4-metoxibenzilóxi, 2-nitrobenzilóxi, 3-nitrobenzilóxi e 4-nitrobenzilóxi.

O grupo feniltio opcionalmente substituído representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo (fenil)-S-, onde a porção fenila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como feniltio, 2-clorofeniltio, 3-clorofeniltio, 4-clorofeniltio, 2-fluorofeniltio, 3-fluorofeniltio, 4-fluorofeniltio, 2-metilfeniltio, 3-metil-

feniltio, 4-metilfeniltio, 2-metoxifeniltio, 3-metoxifeniltio, 4-metoxifeniltio, 2-nitrofeniltio, 3-nitrofeniltio e 4-nitrofeniltio.

O grupo benziltio opcionalmente substituído representa, a menos que de outro modo particularmente definido, um grupo (fenil)-CH₂-S, onde a porção fenila tem o mesmo significado como definido acima. Exemplos destes podem incluir grupos tais como benziltio, 2-clorobenziltio, 3-clorobenziltio, 4-clorobenziltio, 2-fluorobenziltio, 3-fluorobenziltio, 4-fluorobenziltio, 2-metilbenziltio, 3-metilbenziltio, 4-metilbenziltio, 2-metoxibenziltio, 3-metoxibenziltio, 4-metoxibenzilóxi, 2-nitrobenziltio, 3-nitrobenziltio e 4-nitrobenziltio.

O termo 'R¹ e R² podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R¹ e R² são ligados pode incluir, a menos que de outro modo particularmente definido, um caso de formação de um anel tal como pirrolidina, pirazolidina, oxazolidina, tiazolidina, imidazolidina, isoxazolidina, isotiazolidina, piperidina, piperazina, hexahidropiridazina, morfolina, ou tiomorfolina.

Quanto ao termo 'R¹ e R² podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros é independentemente substituído com 1 a 4 átomos de halogênio e/ou um grupo C₁₋₆ haloalquila) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R¹ e R² são ligados', a menos que de outro modo particularmente definido, por exemplo, 2-trifluorometilpirrolidin-1-ila, 3,3-difluoropirrolidin-1-ila, 4-trifluorometilpiperidin-1-ila, ou 3,3,4,4-tetrafluoropirrolidin-1-ila, podem ser mencionados.

Quando para o composto de Fórmula [I] um grupo hidroxila, um grupo carboxila, um grupo amino, ou similar está presente em sua estrutura, ou alternativamente Quando o átomo de nitrogênio do composto de fórmula [I] onde o átomo de nitrogênio forma um anel de pirazol ou um anel de pirimidina mostra uma propriedade básica, o sal agricolamente aceitável refere-se a um sal do composto com metal ou base orgânica ou um sal do compos-

to com ácido mineral ou ácido orgânico. Como o metal, existem metais de álcali tal como sódio e potássio; e metais alcalino terrosos tais como magnésio e cálcio. Como a base orgânica, existem trietilamina, diisopropilamina e similares. Como o ácido mineral, existem o ácido clorídrico, ácido sulfúrico e similares. Como o ácido orgânico, existem o ácido acético, ácido metanosulfônico, ácido p-toluenossulfônico e similares.

Com referência ao composto que pode ser incluído na invenção, aí pode ser um caso onde um isômero geométrico de forma-E e forma-Z existe de acordo com o tipo de um substituinte.

A invenção inclui todos de forma-E, forma-Z e uma mistura incluindo forma-E e forma-Z em uma proporção arbitrária. Além disso, com referência ao composto que pode ser incluído na invenção, aí existe uma substância opticamente ativa causada pela presença de um ou mais átomos de carbono assimétricos. A invenção inclui todas as substâncias opticamente ativas, bem como racemato. Além disso, quando o composto que pode ser incluído na invenção, tem um grupo hidroxila como um substituinte, aí pode ser um composto com um isômero de ceto-enol e a invenção também inclui a conformação deste.

A seguir, Exemplos representativos do composto do presente pedido representado pela Fórmula [1] será mostrado nas Tabelas 1 a 40. Entretanto, o composto do presente pedido não está limitado àqueles compostos. Para o composto N^os, refere-se às descrições abaixo.

As seguintes abreviações nas Tabelas no presente relatório descritivo representam grupos como mostrado abaixo, respectivamente.

25	Me:	grupo metila
10	Et:	grupo etila
	n-Pr:	grupo n-propila
	iso-Pr:	grupo isopropila
	c-Pr:	grupo ciclopropila
30	n-Bu:	grupo n-butila
	15 sec-Bu:	grupo sec-butila
	iso-Bu:	grupo iso-butila

tert-Bu:	grupo terc-butila
n-Pen:	grupo n-pentila
2-Pen:	grupo 2-pentila
3-Pen:	grupo 3-pentila
c-Pen:	grupo ciclopentila
c-Hex:	grupo ciclohexila

5

Além disso, as seguintes abreviações referem-se aos correspondentes significados, respectivamente.

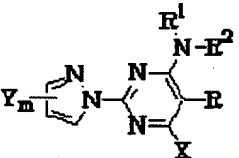
3-Cl: um átomo de cloro é substituído na 3ª posição

10

3-CF₃-4-COOMe: um grupo trifluorometila é substituído na 3ª posição e um grupo metoxycarbonila é substituído na 4ª posição

3,5-(Me)₂: grupos metila são substituídos na 3ª e 5ª posições, respectivamente

[Tabela 1]

					
Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0001	Me	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
0002	Me	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
0003	Me	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
0004	Me	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
0005	Me	CH ₂ CF ₃	H	H	—
0006	Me	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
0007	Me	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
0008	Me	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
0009	Me	Et	Et	H	—
0010	Me	Et	Et	Cl	—
0011	Me	Et	Et	CN	—
0012	Me	Et	Et	Me	—
0013	Me	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₂ -		H	—
0014	Me	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₂ -		Cl	—
0015	Me	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₂ -		CN	—
0016	Me	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₂ -		Me	—
0017	Et	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
0018	Et	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
0019	Et	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
0020	Et	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
0021	Et	CH ₂ CF ₃	H	H	—
0022	Et	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
0023	Et	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
0024	Et	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
0025	Et	Et	Et	H	—
0026	Et	Et	Et	Cl	—
0027	Et	Et	Et	CN	—
0028	Et	Et	Et	Me	—
0029	Et	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₂ -		H	—
0030	Et	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₂ -		Cl	—
0031	Et	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₂ -		CN	—
0032	Et	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₂ -		Me	—
0033	<i>iso</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
0034	<i>iso</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	F	—
0035	<i>iso</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
0036	<i>iso</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	Br	—
0037	<i>iso</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
0038	<i>iso</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
0039	<i>iso</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	CF ₃	—
0040	<i>iso</i> -Pr	<i>tert</i> -Bu	H	H	—
0041	<i>iso</i> -Pr	<i>tert</i> -Bu	H	F	—
0042	<i>iso</i> -Pr	<i>tert</i> -Bu	H	Cl	—
0043	<i>iso</i> -Pr	<i>tert</i> -Bu	H	Br	—
0044	<i>iso</i> -Pr	<i>tert</i> -Bu	H	CN	—
0045	<i>iso</i> -Pr	<i>tert</i> -Bu	H	Me	—

[Tabela 2]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0046	<i>iso</i> -Pr	<i>tert</i> -Bu	H	CF ₃	—
0047	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	H	—
0048	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	F	—
0049	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	Cl	—
0050	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	Br	—
0051	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	I	—
0052	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	OH	—
0053	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	OMe	—
0054	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	OEt	—
0055	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	OCH ₂ -Pr	—
0056	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	OCHF ₃	—
0057	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	OCF ₃	—
0058	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	OCH ₂ CHF ₃	—
0059	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	—
0060	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	SH	—
0061	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	SOMe	—
0062	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	SO ₂ Me	—
0063	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	SCF ₃	—
0064	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
0065	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	SO ₂ CF ₂	—
0066	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	NH ₂	—
0067	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	NHMe	—
0068	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	NH ₂ -Pr	—
0069	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	NOMe	—
0070	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	NO ₂	—
0071	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CN	—
0072	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CHO	—
0073	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	COMe	—
0074	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	OCEt	—
0075	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CO ₂ H	—
0076	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CO ₂ Me	—
0077	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CO ₂ Et	—
0078	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CONH ₂	—
0079	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CONHMe	—
0080	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CON(Me) ₂	—
0081	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	Me	—
0082	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	Et	—
0083	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	<i>iso</i> -Pr	—
0084	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	<i>n</i> -Pr	—
0085	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CH ₃ F	—
0086	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CH ₃ Cl	—
0087	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CH ₃ Br	—
0088	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CHF ₃	—
0089	<i>iso</i> -Pr	CH ₃ CF ₃	H	CF ₃	—
0090	<i>iso</i> -Pr	CHOMeCF ₃	H	H	—
0091	<i>iso</i> -Pr	CHOMeCF ₃	H	F	—
0092	<i>iso</i> -Pr	CHOMeCF ₃	H	Cl	—
0093	<i>iso</i> -Pr	CHOMeCF ₃	H	Br	—
0094	<i>iso</i> -Pr	CHOMeCF ₃	H	I	—
0095	<i>iso</i> -Pr	CHOMeCF ₃	H	OH	—
0096	<i>iso</i> -Pr	CHOMeCF ₃	H	OMe	—

[Tabela 3]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0087	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	OEt	—
0088	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	OCH ₂ - <i>i</i> -Pr	—
0089	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	OCHF ₃	—
0100	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	OOF ₃	—
0101	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	OCH ₂ CHF ₃	—
0102	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	—
0103	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	SiMe ₃	—
0104	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	SiOMe	—
0105	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	SiOMe	—
0106	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	SCF ₃	—
0107	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
0108	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
0109	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	NH ₂	—
0110	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	NHMe	—
0111	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	NH <i>iso</i> -Pr	—
0112	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	NOMe	—
0113	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	NOD ₃	—
0114	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CN	—
0115	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CHO	—
0116	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	COMe	—
0117	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	OOCt	—
0118	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CO ₂ H	—
0119	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CO ₂ Me	—
0120	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CO ₂ Et	—
0121	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CONH ₂	—
0122	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CONHMe	—
0123	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CONOMe	—
0124	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	Me	—
0125	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	Et	—
0126	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	<i>iso</i> -Pr	—
0127	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	<i>i</i> -Pr	—
0128	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CH ₂ F	—
0129	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CH ₂ Cl	—
0130	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CH ₂ Br	—
0131	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CHF ₃	—
0132	<i>iso</i> -Pr	CH(OAc)CF ₃	H	CF ₃	—
0133	<i>iso</i> -Pr	Et	Et	H	—
0134	<i>iso</i> -Pr	Et	Et	F	—
0135	<i>iso</i> -Pr	Et	Et	Cl	—
0136	<i>iso</i> -Pr	Et	Et	Br	—
0137	<i>iso</i> -Pr	Et	Et	CN	—
0138	<i>iso</i> -Pr	Et	Et	Me	—
0139	<i>iso</i> -Pr	Et	Et	CF ₃	—
0140	<i>iso</i> -Pr	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		H	—
0141	<i>iso</i> -Pr			F	—
0142	<i>iso</i> -Pr			Cl	—
0143	<i>iso</i> -Pr			Br	—
0144	<i>iso</i> -Pr			CN	—
0145	<i>iso</i> -Pr			Me	—
0146	<i>iso</i> -Pr			CF ₃	—

Tabela 4]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0147	<i>iso</i> -Pr	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		H	—
0148	<i>iso</i> -Pr	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		F	—
0149	<i>iso</i> -Pr	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		Cl	—
0150	<i>iso</i> -Pr	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		Br	—
0151	<i>iso</i> -Pr	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		CN	—
0152	<i>iso</i> -Pr	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		Me	—
0153	<i>iso</i> -Pr	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		CF ₃	—
0154	<i>n</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
0155	<i>n</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
0156	<i>n</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
0157	<i>n</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
0158	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	H	H	—
0159	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
0160	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
0161	<i>n</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
0162	<i>n</i> -Pr	Et	Et	H	—
0163	<i>n</i> -Pr	Et	Et	Cl	—
0164	<i>n</i> -Pr	Et	Et	CN	—
0165	<i>n</i> -Pr	Et	Et	Me	—
0166	<i>n</i> -Pr	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		H	—
0167	<i>n</i> -Pr	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		Cl	—
0168	<i>n</i> -Pr	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		CN	—
0169	<i>n</i> -Pr	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		Me	—
0170	<i>n</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
0171	<i>n</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
0172	<i>n</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
0173	<i>n</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
0174	<i>n</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	H	—
0175	<i>n</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
0176	<i>n</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
0177	<i>n</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
0178	<i>n</i> -Bu	Et	Et	H	—
0179	<i>n</i> -Bu	Et	Et	Cl	—
0180	<i>n</i> -Bu	Et	Et	CN	—
0181	<i>n</i> -Bu	Et	Et	Me	—
0182	<i>n</i> -Bu	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		H	—
0183	<i>n</i> -Bu	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		Cl	—
0184	<i>n</i> -Bu	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		CN	—
0185	<i>n</i> -Bu	$\langle \text{CH}_2 \rangle_n \text{CHOMe} \langle \text{CH}_2 \rangle_m$		Me	—
0186	<i>sec</i> -Bu	H	H	H	—
0187	<i>sec</i> -Bu	H	H	Cl	—
0188	<i>sec</i> -Bu	H	H	CN	—
0189	<i>sec</i> -Bu	H	H	Me	—
0190	<i>sec</i> -Bu	Me	H	H	—
0191	<i>sec</i> -Bu	Me	H	Cl	—
0192	<i>sec</i> -Bu	Me	H	CN	—
0193	<i>sec</i> -Bu	Me	H	Me	—
0194	<i>sec</i> -Bu	Et	H	H	—
0195	<i>sec</i> -Bu	Et	H	Cl	—
0196	<i>sec</i> -Bu	Et	H	CN	—
0197	<i>sec</i> -Bu	Et	H	Me	—

[Tabela 5]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0198	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
0199	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	F	—
0200	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
0201	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	Br	—
0202	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	I	—
0203	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	OH	—
0204	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	OMe	—
0205	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	OEt	—
0206	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	OCH ₂ - <i>i</i> -Pr	—
0207	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	OCF ₃	—
0208	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	OCF ₂	—
0209	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	OCH ₂ CH ₂ F	—
0210	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	OCH ₂ CF ₃	—
0211	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	SiMe ₃	—
0212	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	SiOMe	—
0213	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	SiOMe	—
0214	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	SiCF ₃	—
0215	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	SiOCF ₃	—
0216	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	SiO ₂ CF ₃	—
0217	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	NH ₂	—
0218	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	NHMe	—
0219	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	NH <i>iso</i> -Pr	—
0220	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	NOMe ₂	—
0221	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	NiEt ₂	—
0222	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
0223	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CHO	—
0224	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	COMe	—
0225	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	COEt	—
0226	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CO ₂ H	—
0227	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CO ₂ Me	—
0228	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CO ₂ Et	—
0229	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CONH ₂	—
0230	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CONHMe	—
0231	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CONOMe ₂	—
0232	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
0233	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	Et	—
0234	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	<i>iso</i> -Pr	—
0235	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	<i>i</i> -Pr	—
0236	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CH ₂ F	—
0237	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CH ₂ Cl	—
0238	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CH ₂ Br	—
0239	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CHF ₂	—
0240	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	H	CF ₃	—
0241	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	H	H	—
0242	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	H	Cl	—
0243	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	H	CN	—
0244	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	H	Me	—
0245	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	H	H	—
0246	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	H	Cl	—
0247	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	H	CN	—
0248	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	H	Me	—

[Tabela 6]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Ym
0249	sec-Bu	iso-Bu	H	H	—
0250	sec-Bu	iso-Bu	H	Cl	—
0251	sec-Bu	iso-Bu	H	CN	—
0252	sec-Bu	iso-Bu	H	Me	—
0253	sec-Bu	sec-Bu	H	H	—
0254	sec-Bu	sec-Bu	H	Cl	—
0255	sec-Bu	sec-Bu	H	CN	—
0256	sec-Bu	sec-Bu	H	Me	—
0257	sec-Bu	tert-Bu	H	H	—
0258	sec-Bu	tert-Bu	H	F	—
0259	sec-Bu	tert-Bu	H	Cl	—
0260	sec-Bu	tert-Bu	H	Br	—
0261	sec-Bu	tert-Bu	H	I	—
0262	sec-Bu	tert-Bu	H	OH	—
0263	sec-Bu	tert-Bu	H	OMe	—
0264	sec-Bu	tert-Bu	H	OEt	—
0265	sec-Bu	tert-Bu	H	OCH ₂ -Pr	—
0266	sec-Bu	tert-Bu	H	OCHF ₂	—
0267	sec-Bu	tert-Bu	H	OCF ₃	—
0268	sec-Bu	tert-Bu	H	OCH ₂ CHF ₂	—
0269	sec-Bu	tert-Bu	H	OCH ₂ CF ₃	—
0270	sec-Bu	tert-Bu	H	SiMe ₃	—
0271	sec-Bu	tert-Bu	H	SiOMe	—
0272	sec-Bu	tert-Bu	H	SiOMe	—
0273	sec-Bu	tert-Bu	H	SiCF ₃	—
0274	sec-Bu	tert-Bu	H	SiOCF ₃	—
0275	sec-Bu	tert-Bu	H	SiOCF ₃	—
0276	sec-Bu	tert-Bu	H	NH ₂	—
0277	sec-Bu	tert-Bu	H	NHMe	—
0278	sec-Bu	tert-Bu	H	NHiso-Pr	—
0279	sec-Bu	tert-Bu	H	NOMe ₂	—
0280	sec-Bu	tert-Bu	H	N(Et) ₂	—
0281	sec-Bu	tert-Bu	H	CN	—
0282	sec-Bu	tert-Bu	H	CHO	—
0283	sec-Bu	tert-Bu	H	COMe	—
0284	sec-Bu	tert-Bu	H	COEt	—
0285	sec-Bu	tert-Bu	H	CO ₂ H	—
0286	sec-Bu	tert-Bu	H	CO ₂ Me	—
0287	sec-Bu	tert-Bu	H	CO ₂ Et	—
0288	sec-Bu	tert-Bu	H	CONH ₂	—
0289	sec-Bu	tert-Bu	H	CONHMe	—
0290	sec-Bu	tert-Bu	H	CONHMe ₂	—
0291	sec-Bu	tert-Bu	H	Me	—
0292	sec-Bu	tert-Bu	H	Et	—
0293	sec-Bu	tert-Bu	H	iso-Pr	—
0294	sec-Bu	tert-Bu	H	n-Pr	—
0295	sec-Bu	tert-Bu	H	CH ₂ F	—
0296	sec-Bu	tert-Bu	H	CH ₂ Cl	—
0297	sec-Bu	tert-Bu	H	CH ₂ Br	—
0298	sec-Bu	tert-Bu	H	CHF ₂	—
0299	sec-Bu	tert-Bu	H	CF ₃	—

Tabela 7

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Yn
0300	ac-Bu	n-Pen	H	H	—
0301	ac-Bu	n-Pen	H	Cl	—
0302	ac-Bu	n-Pen	H	CN	—
0303	ac-Bu	n-Pen	H	Me	—
0304	ac-Bu	CH(Me)n-Pr	H	H	—
0305	ac-Bu	CH(Me)n-Pr	H	Cl	—
0306	ac-Bu	CH(Me)n-Pr	H	CN	—
0307	ac-Bu	CH(Me)n-Pr	H	Me	—
0308	ac-Bu	CH(Et) ₂	H	H	—
0309	ac-Bu	CH(Et) ₂	H	Cl	—
0310	ac-Bu	CH(Et) ₂	H	CN	—
0311	ac-Bu	CH(Et) ₂	H	Me	—
0312	ac-Bu	CH(Me)CH(Me) ₂	H	H	—
0313	ac-Bu	CH(Me)CH(Me) ₂	H	Cl	—
0314	ac-Bu	CH(Me)CH(Me) ₂	H	CN	—
0315	ac-Bu	CH(Me)CH(Me) ₂	H	Me	—
0316	ac-Bu	CH ₂ COMe ₂	H	H	—
0317	ac-Bu	CH ₂ COMe ₂	H	Cl	—
0318	ac-Bu	CH ₂ COMe ₂	H	CN	—
0319	ac-Bu	CH ₂ COMe ₂	H	Me	—
0320	ac-Bu	CH(Me)COMe ₂	H	H	—
0321	ac-Bu	CH(Me)COMe ₂	H	Cl	—
0322	ac-Bu	CH(Me)COMe ₂	H	CN	—
0323	ac-Bu	CH(Me)COMe ₂	H	Me	—
0324	ac-Bu	n-Hex	H	H	—
0325	ac-Bu	n-Hex	H	Cl	—
0326	ac-Bu	n-Hex	H	CN	—
0327	ac-Bu	n-Hex	H	Me	—
0328	ac-Bu	i-Pr	H	H	—
0329	ac-Bu	i-Pr	H	Cl	—
0330	ac-Bu	i-Pr	H	CN	—
0331	ac-Bu	i-Pr	H	Me	—
0332	ac-Bu	i-Pen	H	H	—
0333	ac-Bu	i-Pen	H	Cl	—
0334	ac-Bu	i-Pen	H	CN	—
0335	ac-Bu	i-Pen	H	Me	—
0336	ac-Bu	i-Hex	H	H	—
0337	ac-Bu	i-Hex	H	Cl	—
0338	ac-Bu	i-Hex	H	CN	—
0339	ac-Bu	i-Hex	H	Me	—
0340	ac-Bu	CH ₂ CHF ₂	H	H	—
0341	ac-Bu	CH ₂ CHF ₂	H	Cl	—
0342	ac-Bu	CH ₂ CHF ₂	H	CN	—
0343	ac-Bu	CH ₂ CHF ₂	H	Me	—
0344	ac-Bu	CH ₂ CClF ₂	H	H	—
0345	ac-Bu	CH ₂ CClF ₂	H	Cl	—
0346	ac-Bu	CH ₂ CClF ₂	H	CN	—
0347	ac-Bu	CH ₂ CClF ₂	H	Me	—
0348	ac-Bu	CH ₂ CF ₃	H	H	—
0349	ac-Bu	CH ₂ CF ₃	H	F	—
0350	ac-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—

[Tabela 8]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y ₂
0351	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Br	—
0352	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	I	—
0353	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	OH	—
0354	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	OMe	—
0355	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	OEt	—
0356	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ - <i>n</i> -Pr	—
0357	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ Ph	—
0358	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	OCHF ₃	—
0359	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ CHF ₃	—
0360	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	—
0361	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	SO ₂ Me	—
0362	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	SO ₂ Me	—
0363	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	SO ₂ Me	—
0364	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	—
0365	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
0366	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
0367	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	NH ₂	—
0368	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	NHMe	—
0369	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	NHMe- <i>n</i> -Pr	—
0370	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	NOMe ₂	—
0371	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	NOMe ₂	—
0372	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	ON	—
0373	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CHO	—
0374	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	COMe	—
0375	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	COEt	—
0376	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CO ₂ H	—
0377	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CO ₂ Me	—
0378	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CO ₂ Et	—
0379	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CONH ₂	—
0380	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CONHMe	—
0381	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CONOMe ₂	—
0382	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CH=NCH	—
0383	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CH=NOMe	—
0384	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
0385	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Et	—
0386	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	<i>iso</i> -Pr	—
0387	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	<i>n</i> -Pr	—
0388	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ F	—
0389	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ Cl	—
0390	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ Br	—
0391	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CHF ₃	—
0392	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	—
0393	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ OH	—
0394	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CH(OH)Me	—
0395	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ OMe	—
0396	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	CH(OMe)Me	—
0397	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-F
0398	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Cl
0399	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Br
0400	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-I
0401	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me

[Tabela 9]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0402	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-Et
0403	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-is-Pr
0404	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-n-Pr
0405	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-C≡CH
0406	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CH ₂ OH
0407	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CH ₂ OMe
0408	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CH ₂ Cl
0409	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CHF ₃
0410	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CF ₃
0411	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-OH
0412	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-OMe
0413	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-OCHF ₃
0414	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-SH
0415	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-SMe
0416	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-SOMe
0417	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-SO ₂ Me
0418	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-SCF ₃
0419	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-SO ₂ CF ₃
0420	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-SO ₂ CF ₃
0421	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-NO ₂
0422	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-NH ₂
0423	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-NHMe
0424	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-NOMe
0425	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CN
0426	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CHO
0427	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-COMe
0428	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CO ₂ H
0429	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CO ₂ Et
0430	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CONH ₂
0431	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CONHMe
0432	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	3-CONOMe
0433	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-F
0434	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-Cl
0435	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-Br
0436	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-I
0437	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-Me
0438	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-CH ₂ OH
0439	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-CH ₂ OMe
0440	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-CH ₂ Cl
0441	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-CHF ₃
0442	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-CF ₃
0443	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-OH
0444	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-OMe
0445	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-OCHF ₃
0446	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-SH
0447	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-SMe
0448	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-SOMe
0449	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-SO ₂ Me
0450	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-SCF ₃
0451	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-SO ₂ CF ₃
0452	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Q	4-SO ₂ CF ₃

[Tabela 10]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Ym
0453	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-SCN
0454	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-NO ₂
0455	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-NH ₂
0456	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-NHMe
0457	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-NOMe ₂
0458	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CN
0459	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CHO
0460	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-COMe
0461	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CO ₂ H
0462	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CO ₂ Et
0463	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CONH ₂
0464	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CONHMe
0465	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CONMe ₂
0466	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	5-Cl
0467	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	5-Me
0468	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	5-CF ₃
0469	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	5-OH
0470	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	5-OMe
0471	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	5-OCH ₂ F
0472	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	5-NH ₂
0473	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-F
0474	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-Cl
0475	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3,4(OMe) ₂
0476	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-OH
0477	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-OMe
0478	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-OCH ₂ F
0479	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Et-4-Cl
0480	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Et-4-OH
0481	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-is-Pr-4-Cl
0482	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-is-Pr-4-OH
0483	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3- <i>n</i> -Pr-4-Cl
0484	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3- <i>n</i> -Pr-4-OH
0485	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-CN
0486	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Et-4-CN
0487	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3- <i>n</i> -Pr-4-CN
0488	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-Cl
0489	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CO ₂ Et
0490	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CO ₂ H
0491	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-NH ₂
0492	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONH ₂
0493	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONHMe
0494	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONMe ₂
0495	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-Me
0496	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-Cl
0497	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CN
0498	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CO ₂ Me
0499	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CO ₂ H
0500	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONH ₂
0501	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONHMe
0502	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONMe ₂
0503	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-NH ₂

[Tabela 11]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Ym
0604	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-NH ₂ -4-Br
0605	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-NH ₂ -4-Cl
0606	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-NH ₂ -4-F
0607	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Cl-4-Br
0608	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3,4-Br ₂
0609	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3,4-Cl ₂
0610	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-NH ₂ -4-CO ₂ Et
0611	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Cl-4-CO ₂ Et
0612	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-NH ₂ -4-CO ₂ H
0613	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Cl-4-CO ₂ H
0614	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3,4-(NH ₂) ₂
0615	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Cl-4-NH ₂
0616	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-NH ₂ -4-CONH ₂
0617	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Cl-4-CONH ₂
0618	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-NH ₂ -4-CONHMe
0619	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Cl-4-CONHMe
0620	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-NH ₂ -4-CONOMe
0621	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Cl-4-CONOMe
0622	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ Et-4-Cl
0623	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ H-4-Cl
0624	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CONH ₂ -4-Cl
0625	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CONHMe-4-Cl
0626	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CONOMe-4-Cl
0627	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CN-4-Cl
0628	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-NH ₂ -4-CN
0629	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Cl-4-CN
0630	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CN-4-CN
0631	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-OMe-4-CN
0632	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-EDMe-4-CN
0633	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-ED ₂ Me-4-CN
0634	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Et-4-CN
0635	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-SCF ₃ -4-CN
0636	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3,5-OMe ₂
0637	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-5-OH
0638	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-5-OMe
0639	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-5-OCHF ₃
0640	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-OH-5-Me
0641	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-OMe-5-Me
0642	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-OCHF ₃ -5-Me
0643	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Et-5-OH
0644	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-r-Pr-5-OH
0645	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-OH-5-Et
0646	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-OH-5-r-Pr
0647	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-5-NH ₂
0648	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-5-CO ₂ Et
0649	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Et-5-CO ₂ Et
0650	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-5-Cl
0651	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Et-5-NH ₂
0652	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Et-5-Cl
0653	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-r-Pr-5-NH ₂
0654	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-r-Pr-5-Cl

[Tabela 12]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Ym
0555	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -5-OH
0556	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -5-OMe
0557	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -5-OCHF ₃
0558	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -5-NH ₂
0559	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ Et-5-OH
0560	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ Et-5-OMe
0561	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ Et-5-NH ₂
0562	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ Et-5-Cl
0563	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ H-5-NH ₂
0564	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ H-5-Cl
0565	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CONH ₂ -5-NH ₂
0566	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CONH ₂ -5-Cl
0567	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CONHMe-5-NH ₂
0568	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CONHMe-5-Cl
0569	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CONMe ₂ -5-NH ₂
0570	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CONMe ₂ -5-Cl
0571	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CN-5-NH ₂
0572	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CN-5-Cl
0573	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3,5(OH) ₂
0574	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -5-H
0575	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -5-Me
0576	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-5-NH ₂
0577	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-5-NH ₂
0578	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-ED, Me-5-NH ₂
0579	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-Me-5-Cl
0580	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-EDMe-5-Cl
0581	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	3-ED, Me-5-Cl
0582	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-Me-5-OH
0583	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-Me-5-OMe
0584	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-Me-5-OCHF ₃
0585	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-Et-5-OH
0586	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4- <i>i</i> -Pr-5-OH
0587	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CO ₂ Et-5-Me
0588	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CO ₂ H-5-Me
0589	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-NH ₂ -5-Me
0590	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-Cl-5-Me
0591	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CONH ₂ -5-Me
0592	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CONHMe-5-Me
0593	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CONMe ₂ -5-Me
0594	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CO ₂ Et-5-CF ₃
0595	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CO ₂ H-5-CF ₃
0596	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-Cl-5-CF ₃
0597	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-NH ₂ -5-CF ₃
0598	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CONH ₂ -5-CF ₃
0599	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CONHMe-5-CF ₃
0600	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CONMe ₂ -5-CF ₃
0601	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CO ₂ Et-5-NH ₂
0602	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CO ₂ Et-5-Cl
0603	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CO ₂ H-5-NH ₂
0604	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CO ₂ H-5-Cl
0605	sec-Bu	CH ₃ CF ₃	H	Cl	4-CONH ₂ -5-NH ₂

[Tabela 13]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0606	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CONH ₂ -5-Cl
0607	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CONHMe-5-NH ₂
0608	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CONHMe-5-Cl
0609	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CONOMe ₂ -5-NH ₂
0610	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CONOMe ₂ -5-Cl
0611	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-F-5-NH ₂
0612	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-Cl-5-NH ₂
0613	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4,5-Cl ₂
0614	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CN-5-NH ₂
0615	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CN-5-Cl
0616	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CHO-5-NH ₂
0617	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CHO-5-Cl
0618	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CH ₂ F-5-NH ₂
0619	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CH ₂ F-5-Cl
0620	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CH ₂ OH-5-NH ₂
0621	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CH ₂ OH-5-Cl
0622	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CH ₂ Cl-5-NH ₂
0623	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CH ₂ Cl-5-Cl
0624	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CH ₂ OMe-5-NH ₂
0625	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-CH ₂ OMe-5-Cl
0626	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-NO ₂ -5-NH ₂
0627	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-NO ₂ -5-Cl
0628	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-SCN-5-NH ₂
0629	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-SCN-5-Cl
0630	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-SH-5-NH ₂
0631	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-SH-5-Cl
0632	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-SMe-5-NH ₂
0633	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-SMe-5-Cl
0634	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-SCF ₃ -5-NH ₂
0635	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	4-SCF ₃ -5-Cl
0636	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-Cl-5-NH ₂
0637	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-F-5-NH ₂
0638	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-Cl-5-Cl
0639	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Et-4-Cl-5-NH ₂
0640	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Et-4-Cl-5-Cl
0641	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-i-Pr-4-Cl-5-NH ₂
0642	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-i-Pr-4-Cl-5-Cl
0643	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-CHO-5-OH
0644	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-CHO-5-Cl
0645	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-CHO-5-F
0646	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-CH=NOH-5-Cl
0647	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-CH=NOH-5-F
0648	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-CH=NOH-5-Cl
0649	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-CH=NOH-5-F
0650	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-CN-5-NH ₂
0651	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-CN-5-Cl
0652	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Et-4-CN-5-NH ₂
0653	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Et-4-CN-5-Cl
0654	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Me-4-Cl-5-CO ₂ Et
0655	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Et-4-Cl-5-CO ₂ Et
0656	sec-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-i-Pr-4-CN-5-NH ₂

[Tabela 14]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0657	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3- <i>Pr</i> -4-CN-5-Cl
0658	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-Me-5-NH ₂
0659	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-Me-5-Cl
0660	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-Cl-5-NH ₂
0661	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4,5-Cl ₂
0662	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CHO-5-OH
0663	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CHO-5-Cl
0664	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CHO-5-F
0665	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CH=NOH-5-Cl
0666	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CH=NOH-5-F
0667	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CH=NOMe-5-Cl
0668	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CH=NOMe-5-F
0669	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CN-5-NH ₂
0670	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CN-5-Cl
0671	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CO ₂ Me-5-NH ₂
0672	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CN-5-F
0673	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CO ₂ Me-5-Cl
0674	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CO ₂ H-5-NH ₂
0675	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CO ₂ H-5-Cl
0676	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONH ₂ -5-NH ₂
0677	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONH ₂ -5-Cl
0678	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONHMe-5-NH ₂
0679	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONHMe-5-Cl
0680	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONOMe ₂ -5-NH ₂
0681	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-CONOMe ₂ -5-Cl
0682	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4,5-OH ₂
0683	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CF ₃ -4-NH ₂ -5-Cl
0684	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ Et-4-Cl-5-NH ₂
0685	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ Et-4,5-Cl ₂
0686	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ H-4-Cl-5-NH ₂
0687	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CO ₂ H-4,5-Cl ₂
0688	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CONH ₂ -4-Cl-5-NH ₂
0689	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CONH ₂ -4,5-Cl ₂
0690	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CONHMe-4-Cl-5-NH ₂
0691	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CONHMe-4,5-Cl ₂
0692	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CONOMe ₂ -4-Cl-5-NH ₂
0693	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CONOMe ₂ -4,5-Cl ₂
0694	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CN-4-Cl-5-NH ₂
0695	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-CN-4,5-Cl ₂
0696	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3,5-OH ₂ -4-Cl
0697	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3,4,5-Cl ₃
0698	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-BrMe-4-CN-5-NH ₂
0699	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-BrMe-4-CN-5-Cl
0700	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-SOMe-4-CN-5-NH ₂
0701	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-SOMe-4-CN-5-Cl
0702	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-SOMe-4-CN-5-NH ₂
0703	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-SOMe-4-CN-5-Cl
0704	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Et-4-CN-5-NH ₂
0705	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-Et-4-CN-5-Cl
0706	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-SCF ₃ -4-CN-5-NH ₂
0707	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	3-SCF ₃ -4-CN-5-Cl

[Tabela 15]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	T _m
0708	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	H	—
0709	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	F	—
0710	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	Cl	—
0711	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	Br	—
0712	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	I	—
0713	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	OH	—
0714	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	OMe	—
0715	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	OEt	—
0716	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	OCH ₂ -i-Pr	—
0717	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	OCHF ₃	—
0718	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	OCF ₃	—
0719	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	OCH ₂ CH ₂ F	—
0720	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	—
0721	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	SiMe ₃	—
0722	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	SiOMe	—
0723	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	SiOMe	—
0724	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	SCF ₃	—
0725	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
0726	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
0727	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	NH ₂	—
0728	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	NHMe	—
0729	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	NH <i>i</i> -Pr	—
0730	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	NOMe ₂	—
0731	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	N(Et) ₂	—
0732	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CN	—
0733	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CHO	—
0734	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	COMe	—
0735	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	COEt	—
0736	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CO ₂ H	—
0737	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CO ₂ Me	—
0738	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CO ₂ Et	—
0739	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CONH ₂	—
0740	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CONHMe	—
0741	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CONOMe	—
0742	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	Me	—
0743	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	Et	—
0744	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	<i>iso</i> -Pr	—
0745	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	<i>n</i> -Pr	—
0746	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CH ₂ F	—
0747	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CH ₂ Cl	—
0748	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CH ₂ Br	—
0749	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CHF ₃	—
0750	sec-Bu	CH(OAc)CF ₃	H	CF ₃	—
0751	sec-Bu	CH(Et)CF ₃	H	H	—
0752	sec-Bu	CH(Et)CF ₃	H	F	—
0753	sec-Bu	CH(Et)CF ₃	H	Cl	—
0754	sec-Bu	CH(Et)CF ₃	H	Br	—
0755	sec-Bu	CH(Et)CF ₃	H	OMe	—
0756	sec-Bu	CH(Et)CF ₃	H	CN	—
0757	sec-Bu	CH(Et)CF ₃	H	Me	—
0758	sec-Bu	CH(Et)CF ₃	H	CF ₃	—

Tabela 16]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0759	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	H	—
0760	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
0761	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	CN	—
0762	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CF ₃	H	Me	—
0763	sec-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H	H	—
0764	sec-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H	Cl	—
0765	sec-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H	CN	—
0766	sec-Bu	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H	Me	—
0767	sec-Bu	CH ₂ CH(OMe)CF ₃	H	H	—
0768	sec-Bu	CH ₂ CH(OMe)CF ₃	H	Cl	—
0769	sec-Bu	CH ₂ CH(OMe)CF ₃	H	CN	—
0770	sec-Bu	CH ₂ CH(OMe)CF ₃	H	Me	—
0771	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	H	—
0772	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	Cl	—
0773	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	CN	—
0774	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	Me	—
0775	sec-Bu	CH ₂ -c-Pr	H	H	—
0776	sec-Bu	CH ₂ -c-Pr	H	Cl	—
0777	sec-Bu	CH ₂ -c-Pr	H	CN	—
0778	sec-Bu	CH ₂ -c-Pr	H	Me	—
0779	sec-Bu	CH ₂ -c-Pen	H	H	—
0780	sec-Bu	CH ₂ -c-Pen	H	Cl	—
0781	sec-Bu	CH ₂ -c-Pen	H	CN	—
0782	sec-Bu	CH ₂ -c-Pen	H	Me	—
0783	sec-Bu	CH ₂ -c-Hex	H	H	—
0784	sec-Bu	CH ₂ -c-Hex	H	Cl	—
0785	sec-Bu	CH ₂ -c-Hex	H	CN	—
0786	sec-Bu	CH ₂ -c-Hex	H	Me	—
0787	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OH	H	H	—
0788	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OH	H	Cl	—
0789	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OH	H	CN	—
0790	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OH	H	Me	—
0791	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OMe	H	H	—
0792	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl	—
0793	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OMe	H	CN	—
0794	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me	—
0796	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OR	H	H	—
0796	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OR	H	Cl	—
0797	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OR	H	CN	—
0798	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OR	H	Me	—
0799	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	H	H	—
0800	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	H	Cl	—
0801	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	H	CN	—
0802	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	H	Me	—
0803	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ NHMe	H	H	—
0804	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ NHMe	H	Cl	—
0806	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ NHMe	H	CN	—
0806	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ NHMe	H	Me	—
0807	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ NOMe	H	H	—
0808	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ NOMe	H	Cl	—
0809	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ NOMe	H	CN	—

[Tabela 17]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0810	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ NOMe ₂	H	Me	—
0811	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SM ₂	H	H	—
0812	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SM ₂	H	Cl	—
0813	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SM ₂	H	CN	—
0814	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SM ₂	H	Me	—
0815	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SOMe	H	H	—
0816	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SOMe	H	Cl	—
0817	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SOMe	H	CN	—
0818	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SOMe	H	Me	—
0819	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	H	—
0820	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	Cl	—
0821	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	CN	—
0822	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	H	Me	—
0823	sec-Bu	CH ₂ CN	H	H	—
0824	sec-Bu	CH ₂ CN	H	Cl	—
0825	sec-Bu	CH ₂ CN	H	CN	—
0826	sec-Bu	CH ₂ CN	H	Me	—
0827	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CN	H	H	—
0828	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CN	H	Cl	—
0829	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CN	H	CN	—
0830	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CN	H	Me	—
0831	sec-Bu	CH ₂ COMe	H	H	—
0832	sec-Bu	CH ₂ COMe	H	Cl	—
0833	sec-Bu	CH ₂ COMe	H	CN	—
0834	sec-Bu	CH ₂ COMe	H	Me	—
0835	sec-Bu	CH ₂ CO ₂ Et	H	H	—
0836	sec-Bu	CH ₂ CO ₂ Et	H	Cl	—
0837	sec-Bu	CH ₂ CO ₂ Et	H	CN	—
0838	sec-Bu	CH ₂ CO ₂ Et	H	Me	—
0839	sec-Bu	CH(OMe)CO ₂ Et	H	H	—
0840	sec-Bu	CH(OMe)CO ₂ Et	H	Cl	—
0841	sec-Bu	CH(OMe)CO ₂ Et	H	CN	—
0842	sec-Bu	CH(OMe)CO ₂ Et	H	Me	—
0843	sec-Bu	CH(<i>iso</i> -Pr)CO ₂ Et	H	H	—
0844	sec-Bu	CH(<i>iso</i> -Pr)CO ₂ Et	H	Cl	—
0845	sec-Bu	CH(<i>iso</i> -Pr)CO ₂ Et	H	CN	—
0846	sec-Bu	CH(<i>iso</i> -Pr)CO ₂ Et	H	Me	—
0847	sec-Bu	CH ₂ CONH ₂	H	H	—
0848	sec-Bu	CH ₂ CONH ₂	H	Cl	—
0849	sec-Bu	CH ₂ CONH ₂	H	CN	—
0850	sec-Bu	CH ₂ CONH ₂	H	Me	—
0851	sec-Bu	CH ₂ CONHMe	H	H	—
0852	sec-Bu	CH ₂ CONHMe	H	Cl	—
0853	sec-Bu	CH ₂ CONHMe	H	CN	—
0854	sec-Bu	CH ₂ CONHMe	H	Me	—
0855	sec-Bu	CH ₂ CON(Me) ₂	H	H	—
0856	sec-Bu	CH ₂ CON(Me) ₂	H	Cl	—
0857	sec-Bu	CH ₂ CON(Me) ₂	H	CN	—
0858	sec-Bu	CH ₂ CON(Me) ₂	H	Me	—
0859	sec-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	—
0860	sec-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	—

[Tabela 18]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0861	sec-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	H	CN	—
0862	sec-Bu	CH ₂ CH=CH ₂	H	Me	—
0863	sec-Bu	CH ₂ COMe=CH ₂	H	H	—
0864	sec-Bu	CH ₂ COMe=CH ₂	H	Cl	—
0865	sec-Bu	CH ₂ COMe=CH ₂	H	CN	—
0866	sec-Bu	CH ₂ COMe=CH ₂	H	Me	—
0867	sec-Bu	CH ₂ C≡CH	H	H	—
0868	sec-Bu	CH ₂ C≡CH	H	Cl	—
0869	sec-Bu	CH ₂ C≡CH	H	CN	—
0870	sec-Bu	CH ₂ C≡CH	H	Me	—
0871	sec-Bu	COMe	H	H	—
0872	sec-Bu	COMe	H	Cl	—
0873	sec-Bu	COMe	H	CN	—
0874	sec-Bu	COMe	H	Me	—
0875	sec-Bu	COMe	H	H	—
0876	sec-Bu	COMe	H	Cl	—
0877	sec-Bu	COMe	H	CN	—
0878	sec-Bu	COMe	H	Me	—
0879	sec-Bu	SO ₂ Me	H	H	—
0880	sec-Bu	SO ₂ Me	H	Cl	—
0881	sec-Bu	SO ₂ Me	H	CN	—
0882	sec-Bu	SO ₂ Me	H	Me	—
0883	sec-Bu	SO ₂ CH ₂ F	H	H	—
0884	sec-Bu	SO ₂ CH ₂ F	H	Cl	—
0885	sec-Bu	SO ₂ CH ₂ F	H	CN	—
0886	sec-Bu	SO ₂ CH ₂ F	H	Me	—
0887	sec-Bu	SO ₂ CF ₃	H	H	—
0888	sec-Bu	SO ₂ CF ₃	H	Cl	—
0889	sec-Bu	SO ₂ CF ₃	H	CN	—
0890	sec-Bu	SO ₂ CF ₃	H	Me	—
0891	sec-Bu	SO ₂ NHMe	H	H	—
0892	sec-Bu	SO ₂ NHMe	H	Cl	—
0893	sec-Bu	SO ₂ NHMe	H	CN	—
0894	sec-Bu	SO ₂ NHMe	H	Me	—
0895	sec-Bu	SO ₂ NOMe	H	H	—
0896	sec-Bu	SO ₂ NOMe	H	Cl	—
0897	sec-Bu	SO ₂ NOMe	H	CN	—
0898	sec-Bu	SO ₂ NOMe	H	Me	—
0899	sec-Bu	OH	H	Cl	—
0900	sec-Bu	OMe	H	Cl	—
0901	sec-Bu	OEt	H	Cl	—
0902	sec-Bu	OCH ₂ CH=CH ₂	H	Cl	—
0903	sec-Bu	CH ₂ Ph	H	H	—
0904	sec-Bu	CH ₂ Ph	H	Cl	—
0905	sec-Bu	CH ₂ (SO ₂ Me)	H	H	—
0906	sec-Bu	CH ₂ (SO ₂ Me)	H	Cl	—
0907	sec-Bu	Me	Me	H	—
0908	sec-Bu	Me	Me	Cl	—
0909	sec-Bu	Me	Me	CN	—
0910	sec-Bu	Me	Me	Me	—
0911	sec-Bu	Me	COMe	Cl	—

[Tabela 19]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0912	<i>sec</i> -Bu	Me	COOMe	G	—
0913	<i>sec</i> -Bu	Me	SO ₂ Me	G	—
0914	<i>sec</i> -Bu	Me	SO ₂ CF ₃	G	—
0915	<i>sec</i> -Bu	Et	Me	H	—
0916	<i>sec</i> -Bu	Et	Me	G	—
0917	<i>sec</i> -Bu	Et	Me	CN	—
0918	<i>sec</i> -Bu	Et	Me	Me	—
0919	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	H	—
0920	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	F	—
0921	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	Cl	—
0922	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	Br	—
0923	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	I	—
0924	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	OH	—
0925	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	OMe	—
0926	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	OEt	—
0927	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	OCH ₂ - <i>c</i> -Pr	—
0928	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	OCF ₃	—
0929	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	OCF ₂	—
0930	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	OCH ₂ CH ₂ F	—
0931	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	OCH ₂ CF ₃	—
0932	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	SiMe ₃	—
0933	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	SiOMe	—
0934	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	SO ₂ Me	—
0935	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	SCF ₃	—
0936	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	SO ₂ CF ₃	—
0937	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	SO ₂ CF ₂	—
0938	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	NH ₂	—
0939	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	NHMe	—
0940	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	NH <i>iso</i> -Pr	—
0941	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	NOMe ₂	—
0942	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	N(Et) ₂	—
0943	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CN	—
0944	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CHO	—
0945	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	COMe	—
0946	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	COEt	—
0947	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CO ₂ H	—
0948	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CO ₂ Me	—
0949	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CO ₂ Et	—
0950	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CONH ₂	—
0951	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CONHMe	—
0952	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CON(OMe) ₂	—
0953	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	Me	—
0954	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	Et	—
0955	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	<i>iso</i> -Pr	—
0956	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	<i>c</i> -Pr	—
0957	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CH ₂ F	—
0958	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CH ₂ Cl	—
0959	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CH ₂ Br	—
0960	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CHF ₃	—
0961	<i>sec</i> -Bu	Et	Et	CF ₃	—
0962	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	Me	H	—

[Tabela 20]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
0963	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	Me	Cl	—
0964	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	Me	CN	—
0965	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	Me	Me	—
0966	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	Et	H	—
0967	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	Et	Cl	—
0968	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	Et	CN	—
0969	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	Et	Me	—
0970	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	H	—
0971	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	Cl	—
0972	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	CN	—
0973	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	Me	—
0974	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	Me	H	—
0975	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	Me	Cl	—
0976	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	Me	CN	—
0977	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	Me	Me	—
0978	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	Et	H	—
0979	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	Et	Cl	—
0980	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	Et	CN	—
0981	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	Et	Me	—
0982	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	—
0983	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	Cl	—
0984	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	CN	—
0985	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Pr	<i>iso</i> -Pr	Me	—
0986	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	Me	H	—
0987	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	Me	Cl	—
0988	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	Me	CN	—
0989	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	Me	Me	—
0990	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	Et	H	—
0991	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	Et	Cl	—
0992	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	Et	CN	—
0993	<i>sec</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	Et	Me	—
0994	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	Me	H	—
0995	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	Me	Cl	—
0996	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	Me	CN	—
0997	<i>sec</i> -Bu	<i>iso</i> -Bu	Me	Me	—
0998	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Me	H	—
0999	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Me	F	—
1000	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Me	Cl	—
1001	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Me	Br	—
1002	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Me	OMe	—
1003	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Me	CN	—
1004	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Me	Me	—
1005	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Me	CF ₃	—
1006	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Et	H	—
1007	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Et	F	—
1008	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Et	Cl	—
1009	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Et	Br	—
1010	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Et	OMe	—
1011	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Et	CN	—
1012	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Et	Me	—
1013	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	Et	CF ₃	—

[Tabela 21]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1014	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CH ₂ OMe	H	—
1015	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CH ₂ OMe	Cl	—
1016	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CH ₂ OMe	CN	—
1017	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CH ₂ OMe	Me	—
1018	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CH ₂ COMe=CH ₂	H	—
1019	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CH ₂ COMe=CH ₂	Cl	—
1020	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CH ₂ COMe=CH ₂	CN	—
1021	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CH ₂ COMe=CH ₂	Me	—
1022	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	COMe	H	—
1023	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	COMe	Cl	—
1024	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	COMe	CN	—
1025	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	COMe	Me	—
1026	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CO ₂ <i>tert</i> -Bu	H	—
1027	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CO ₂ <i>tert</i> -Bu	Cl	—
1028	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CO ₂ <i>tert</i> -Bu	CN	—
1029	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	CO ₂ <i>tert</i> -Bu	Me	—
1030	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	H	—
1031	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	Cl	—
1032	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	CN	—
1033	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	Me	—
1034	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	H	—
1035	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	Cl	—
1036	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	CN	—
1037	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	Me	—
1038	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	Me	H	—
1039	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	Me	Cl	—
1040	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	Me	CN	—
1041	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	Me	Me	—
1042	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	Et	H	—
1043	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	Et	Cl	—
1044	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	Et	CN	—
1045	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	Et	Me	—
1046	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	CH ₂ COMe=CH ₂	H	—
1047	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	CH ₂ COMe=CH ₂	Cl	—
1048	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	CH ₂ COMe=CH ₂	CN	—
1049	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	CH ₂ COMe=CH ₂	Me	—
1050	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	COMe	H	—
1051	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	COMe	Cl	—
1052	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	COMe	CN	—
1053	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	COMe	Me	—
1054	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	COO <i>tert</i> -Bu	H	—
1055	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	COO <i>tert</i> -Bu	Cl	—
1056	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	COO <i>tert</i> -Bu	CN	—
1057	<i>sec</i> -Bu	CH(OMe)CF ₃	COO <i>tert</i> -Bu	Me	—
1058	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CH=CH ₂	Me	Cl	—
1059	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Cl	—
1060	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ COMe=CH ₂	Me	Cl	—
1061	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ COMe=CH ₂	Et	Cl	—
1062	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ C≡CH	Me	Cl	—
1063	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ C≡CH	Et	Cl	—
1064	<i>sec</i> -Bu	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	H	—

[Tabela 22]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1065	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	Cl	—
1066	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OH	Et	H	—
1067	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ OH	Et	Cl	—
1068	sec-Bu	CH ₂ CN	Me	Cl	—
1069	sec-Bu	CH ₂ CN	Et	Cl	—
1070	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CN	Me	H	—
1071	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CN	Me	Cl	—
1072	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CN	Et	H	—
1073	sec-Bu	CH ₂ CH ₂ CN	Et	Cl	—
1074	sec-Bu	CH ₂ CO ₂ Et	Me	H	—
1075	sec-Bu	CH ₂ CO ₂ Et	Me	Cl	—
1076	sec-Bu	CH ₂ CO ₂ Et	Et	H	—
1077	sec-Bu	CH ₂ CO ₂ Et	Et	Cl	—
1078	sec-Bu	OH	Me	Cl	—
1079	sec-Bu	OMe	Me	Cl	—
1080	sec-Bu	OEt	Me	Cl	—
1081	sec-Bu	(CH ₂) ₃ -		H	—
1082	sec-Bu	(CH ₂) ₃ -		Cl	—
1083	sec-Bu	(CH ₂) ₃ -		CN	—
1084	sec-Bu	(CH ₂) ₃ -		Me	—
1085	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ -		H	—
1086	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ -		F	—
1087	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ -		Cl	—
1088	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ -		Br	—
1089	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ -		OMe	—
1090	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ -		CN	—
1091	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ -		Me	—
1092	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ -		CF ₃	—
1093	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ CHOMe-		H	—
1094	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ CHOMe-		Cl	—
1095	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ CHOMe-		CN	—
1096	sec-Bu	-CHOM(CH ₂) ₃ CHOMe-		Me	—
1097	sec-Bu	-CH ₂ CHOM(CH ₂) ₃ -		H	—
1098	sec-Bu	-CH ₂ CHOM(CH ₂) ₃ -		Cl	—
1099	sec-Bu	-CH ₂ CHOM(CH ₂) ₃ -		CN	—
1100	sec-Bu	-CH ₂ CHOM(CH ₂) ₃ -		Me	—
1101	sec-Bu	-CH ₂ COMe(CH ₂) ₃ -		H	—
1102	sec-Bu	-CH ₂ COMe(CH ₂) ₃ -		Cl	—
1103	sec-Bu	-CH ₂ COMe(CH ₂) ₃ -		CN	—
1104	sec-Bu	-CH ₂ COMe(CH ₂) ₃ -		Me	—
1105	sec-Bu	-CH ₂ CH(OH)(CH ₂) ₃ -		H	—
1106	sec-Bu	-CH ₂ CH(OH)(CH ₂) ₃ -		Cl	—
1107	sec-Bu	-CH ₂ CH(OH)(CH ₂) ₃ -		CN	—
1108	sec-Bu	-CH ₂ CH(OH)(CH ₂) ₃ -		Me	—
1109	sec-Bu	-CH ₂ CH(F)(CH ₂) ₃ -		H	—
1110	sec-Bu	-CH ₂ CH(F)(CH ₂) ₃ -		Cl	—
1111	sec-Bu	-CH ₂ CH(F)(CH ₂) ₃ -		CN	—
1112	sec-Bu	-CH ₂ CH(F)(CH ₂) ₃ -		Me	—
1113	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₂) ₃ -		H	—
1114	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₂) ₃ -		F	—
1115	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₂) ₃ -		Cl	—

[Tabela 23]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1116	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		Br	—
1117	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		I	—
1118	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		OH	—
1119	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		OMe	—
1120	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		OEt	—
1121	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		OCF ₃	—
1122	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		OCF ₂	—
1123	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		OCH ₂ CH ₃	—
1124	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		OCH ₂ CF ₃	—
1125	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		SiMe ₃	—
1126	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		SiOMe	—
1127	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		SiOMe	—
1128	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		SCF ₃	—
1129	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		SOCF ₃	—
1130	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		SO ₂ CF ₃	—
1131	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		NH ₂	—
1132	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		NHMe	—
1133	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		NH(iso-Pr)	—
1134	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		NOMe ₂	—
1135	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		N(Et) ₂	—
1136	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CN	—
1137	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CHO	—
1138	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		COMe	—
1139	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		COEt	—
1140	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CO ₂ H	—
1141	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CO ₂ Me	—
1142	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CO ₂ Et	—
1143	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CONH ₂	—
1144	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CONHMe	—
1145	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CONOMe ₂	—
1146	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		Me	—
1147	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		Et	—
1148	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		iso-Pr	—
1149	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		n-Pr	—
1150	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CH ₂ F	—
1151	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CH ₂ Cl	—
1152	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CH ₂ Br	—
1153	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CHF ₃	—
1154	sec-Bu	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CF ₃	—
1155	sec-Bu	-CH ₂ CF ₃ (CH ₃) ₂		H	—
1156	sec-Bu	-CH ₂ CF ₂ (CH ₃) ₂		Cl	—
1157	sec-Bu	-CH ₂ CF ₂ (CH ₃) ₂		CN	—
1158	sec-Bu	-CH ₂ CF ₂ (CH ₃) ₂		Me	—
1159	sec-Bu	-CH ₂ (CF ₃) ₂ CH ₃		H	—
1160	sec-Bu	-CH ₂ (CF ₃) ₂ CH ₃		Cl	—
1161	sec-Bu	-CH ₂ (CF ₃) ₂ CH ₃		SiMe ₃	—
1162	sec-Bu	-CH ₂ (CF ₃) ₂ CH ₃		SiOMe	—
1163	sec-Bu	-CH ₂ (CF ₃) ₂ CH ₃		SiOMe	—
1164	sec-Bu	-CH ₂ (CF ₃) ₂ CH ₃		CN	—
1165	sec-Bu	-CH ₂ (CF ₃) ₂ CH ₃		Me	—
1166	sec-Bu	-CH ₂ CH(CO ₂ Me)(CH ₃) ₂		H	—

[Tabela 24]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Ym
1167	sec-Bu	-CH ₂ CH(CO ₂ Me)(CH ₃)-		Cl	—
1168	sec-Bu	-CH ₂ CH(CO ₂ Me)(CH ₃)-		CN	—
1169	sec-Bu	-CH ₂ CH(CO ₂ Me)(CH ₃)-		Me	—
1170	sec-Bu	-CH ₂ OCH ₂ CH ₃ -		H	—
1171	sec-Bu	-CH ₂ OCH ₂ CH ₃ -		Cl	—
1172	sec-Bu	-CH ₂ OCH ₂ CH ₃ -		CN	—
1173	sec-Bu	-CH ₂ OCH ₂ CH ₃ -		Me	—
1174	sec-Bu	-CH ₂ SOCH ₂ CH ₃ -		H	—
1175	sec-Bu	-CH ₂ SOCH ₂ CH ₃ -		Cl	—
1176	sec-Bu	-CH ₂ SOCH ₂ CH ₃ -		CN	—
1177	sec-Bu	-CH ₂ SOCH ₂ CH ₃ -		Me	—
1178	sec-Bu	(CH ₂) ₆		H	—
1179	sec-Bu	(CH ₂) ₆		Cl	—
1180	sec-Bu	(CH ₂) ₆		CN	—
1181	sec-Bu	(CH ₂) ₆		Me	—
1182	sec-Bu	-CHOMe(CH ₂) ₆ -		H	—
1183	sec-Bu	-CHOMe(CH ₂) ₆ -		Cl	—
1184	sec-Bu	-CHOMe(CH ₂) ₆ -		CN	—
1185	sec-Bu	-CHOMe(CH ₂) ₆ -		Me	—
1186	sec-Bu	-CH ₂ CHOMe(CH ₂) ₆ -		H	—
1187	sec-Bu	-CH ₂ CHOMe(CH ₂) ₆ -		Cl	—
1188	sec-Bu	-CH ₂ CHOMe(CH ₂) ₆ -		CN	—
1189	sec-Bu	-CH ₂ CHOMe(CH ₂) ₆ -		Me	—
1190	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		H	—
1191	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		F	—
1192	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		Cl	—
1193	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		Br	—
1194	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		I	—
1195	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		OH	—
1196	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		OMe	—
1197	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		OEt	—
1198	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		OCH ₂ -Pr	—
1199	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		OCH ₂ Ph	—
1200	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		OCF ₃	—
1201	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		OCF ₃	—
1202	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		OCH ₂ CHF ₃	—
1203	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		OCH ₂ CF ₃	—
1204	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		SO ₂ Me	—
1205	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		SO ₂ Me	—
1206	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		SO ₂ Me	—
1207	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		SO ₂ F ₂	—
1208	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		SO ₂ CF ₃	—
1209	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		SO ₂ CF ₃	—
1210	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		NH ₂	—
1211	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		NHMe	—
1212	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		NH ₂ -Pr	—
1213	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		NOMe	—
1214	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		NED ₂	—
1215	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		CN	—
1216	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		CHO	—
1217	sec-Bu	(CH ₂) ₆ CHOMe(CH ₂) ₆ -		COMe	—

[Tabela 25]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1218	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		COEt	—
1219	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CO ₂ H	—
1220	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CO ₂ Me	—
1221	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CO ₂ Et	—
1222	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CONH ₂	—
1223	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CONHMe	—
1224	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CON(OMe) ₂	—
1225	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Me	—
1226	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Et	—
1227	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		iso-Pr	—
1228	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		n-Pr	—
1229	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CH ₃ F	—
1230	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CH ₃ Cl	—
1231	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CH ₃ Br	—
1232	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CHF ₃	—
1233	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CF ₃	—
1234	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		H	3-Cl
1235	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Cl	3-Cl
1236	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CN	3-Cl
1237	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Me	3-Cl
1238	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		H	3-Me
1239	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Cl	3-Me
1240	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CN	3-Me
1241	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Me	3-Me
1242	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		H	3-Pr-i
1243	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Cl	3-Pr-i
1244	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CN	3-Pr-i
1245	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Me	3-Pr-i
1246	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		H	3-CF ₃ +CO ₂ Et
1247	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Cl	3-CF ₃ +CO ₂ Et
1248	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CN	3-CF ₃ +CO ₂ Et
1249	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Me	3-CF ₃ +CO ₂ Et
1250	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		H	3,5-(Me) ₂
1251	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Cl	3,5-(Me) ₂
1252	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		CN	3,5-(Me) ₂
1253	sec-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMeX(CH ₃) ₂		Me	3,5-(Me) ₂
1254	sec-Bu	(CH ₃) ₂ O(CH ₃) ₂		H	—
1255	sec-Bu	(CH ₃) ₂ O(CH ₃) ₂		Cl	—
1256	sec-Bu	(CH ₃) ₂ O(CH ₃) ₂		CN	—
1257	sec-Bu	(CH ₃) ₂ O(CH ₃) ₂		Me	—
1258	sec-Bu	CH ₃ CHOMeOCHOMeCH ₃		H	—
1259	sec-Bu	CH ₃ CHOMeOCHOMeCH ₃		Cl	—
1260	sec-Bu	CH ₃ CHOMeOCHOMeCH ₃		CN	—
1261	sec-Bu	CH ₃ CHOMeOCHOMeCH ₃		Me	—
1262	sec-Bu	(CH ₃) ₂ Si(CH ₃) ₂		H	—
1263	sec-Bu	(CH ₃) ₂ Si(CH ₃) ₂		Cl	—
1264	sec-Bu	(CH ₃) ₂ Si(CH ₃) ₂		CN	—
1265	sec-Bu	(CH ₃) ₂ Si(CH ₃) ₂		Me	—
1266	sec-Bu	(CH ₃) ₂ SiOX(CH ₃) ₂		H	—
1267	sec-Bu	(CH ₃) ₂ SiOX(CH ₃) ₂		Cl	—
1268	sec-Bu	(CH ₃) ₂ SiOX(CH ₃) ₂		CN	—

[Tabela 26]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1269	sec-Bu	(CH ₂) ₂ SO(CH ₂) ₂ -		Me	—
1270	sec-Bu	(CH ₂) ₂ SO(CH ₂) ₂ -		H	—
1271	sec-Bu	(CH ₂) ₂ SO(CH ₂) ₂ -		Cl	—
1272	sec-Bu	(CH ₂) ₂ SO(CH ₂) ₂ -		CN	—
1273	sec-Bu	(CH ₂) ₂ SO(CH ₂) ₂ -		Me	—
1274	sec-Bu	(CH ₂) ₂ NMe(CH ₂) ₂ -		H	—
1275	sec-Bu	(CH ₂) ₂ NMe(CH ₂) ₂ -		Cl	—
1276	sec-Bu	(CH ₂) ₂ NMe(CH ₂) ₂ -		CN	—
1277	sec-Bu	(CH ₂) ₂ NMe(CH ₂) ₂ -		Me	—
1278	iso-Bu	iso-Pr	H	H	—
1279	iso-Bu	iso-Pr	H	Cl	—
1280	iso-Bu	iso-Pr	H	CN	—
1281	iso-Bu	iso-Pr	H	Me	—
1282	iso-Bu	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1283	iso-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1284	iso-Bu	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1285	iso-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1286	iso-Bu	Et	Et	H	—
1287	iso-Bu	Et	Et	Cl	—
1288	iso-Bu	Et	Et	CN	—
1289	iso-Bu	Et	Et	Me	—
1290	iso-Bu	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂ -		H	—
1291	iso-Bu	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂ -		Cl	—
1292	iso-Bu	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂ -		CN	—
1293	iso-Bu	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂ -		Me	—
1294	n-Pen	iso-Pr	H	H	—
1295	n-Pen	iso-Pr	H	Cl	—
1296	n-Pen	iso-Pr	H	CN	—
1297	n-Pen	iso-Pr	H	Me	—
1298	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1299	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1300	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1301	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1302	n-Pen	Et	Et	H	—
1303	n-Pen	Et	Et	Cl	—
1304	n-Pen	Et	Et	CN	—
1305	n-Pen	Et	Et	Me	—
1306	n-Pen	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂ -		H	—
1307	n-Pen	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂ -		Cl	—
1308	n-Pen	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂ -		CN	—
1309	n-Pen	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂ -		Me	—
1310	2-Pen	iso-Pr	H	H	—
1311	2-Pen	iso-Pr	H	Cl	—
1312	2-Pen	iso-Pr	H	CN	—
1313	2-Pen	iso-Pr	H	Me	—
1314	2-Pen	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1315	2-Pen	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1316	2-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1317	2-Pen	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1318	2-Pen	Et	Et	H	—
1319	2-Pen	Et	Et	Cl	—

Tabela 27

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1920	2-Pen	Et	Et	CN	—
1921	2-Pen	Et	Et	Me	—
1922	2-Pen	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂ -		H	—
1923	2-Pen	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂ -		Cl	—
1924	2-Pen	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂ -		CN	—
1925	2-Pen	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂ -		Me	—
1926	3-Pen	iso-Pr	H	H	—
1927	3-Pen	iso-Pr	H	F	—
1928	3-Pen	iso-Pr	H	Cl	—
1929	3-Pen	iso-Pr	H	Br	—
1930	3-Pen	iso-Pr	H	CN	—
1931	3-Pen	iso-Pr	H	Me	—
1932	3-Pen	iso-Pr	H	CF ₃	—
1933	3-Pen	tert-Bu	H	H	—
1934	3-Pen	tert-Bu	H	F	—
1935	3-Pen	tert-Bu	H	Cl	—
1936	3-Pen	tert-Bu	H	Br	—
1937	3-Pen	tert-Bu	H	CN	—
1938	3-Pen	tert-Bu	H	Me	—
1939	3-Pen	tert-Bu	H	CF ₃	—
1940	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1941	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	F	—
1942	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1943	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	Br	—
1944	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	I	—
1945	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OH	—
1946	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OMe	—
1947	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OEt	—
1948	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ -Pr	—
1949	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OCF ₃	—
1950	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OCF ₃	—
1951	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ CH ₂ F	—
1952	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	—
1953	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	SiMe ₃	—
1954	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	SiOMe	—
1955	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	SiOMe	—
1956	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	—
1957	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
1958	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
1959	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	NH ₂	—
1960	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	NHMe	—
1961	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	NHiso-Pr	—
1962	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	NOMe	—
1963	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	NOEt	—
1964	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1965	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CHO	—
1966	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	COMe	—
1967	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	COEt	—
1968	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CO ₂ H	—
1969	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CO ₂ Me	—
1970	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CO ₂ Et	—

[Tabela 28]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1371	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CONH ₂	—
1372	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CONHMe	—
1373	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CONOMe ₂	—
1374	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1375	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	Et	—
1376	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	<i>iso</i> -Pr	—
1377	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	<i>n</i> -Pr	—
1378	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ F	—
1379	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ Cl	—
1380	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ Br	—
1381	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CHF ₃	—
1382	3-Pen	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	—
1383	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	H	—
1384	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	F	—
1385	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	Cl	—
1386	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	Br	—
1387	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	I	—
1388	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	OH	—
1389	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	OMe	—
1390	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	OR	—
1391	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	OCH ₂ <i>n</i> -Pr	—
1392	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	OCHF ₃	—
1393	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	OCF ₃	—
1394	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	OCH ₂ CHF ₃	—
1395	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	—
1396	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	SHMe	—
1397	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	SO ₂ Me	—
1398	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	SO ₂ Me	—
1399	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	SCF ₃	—
1400	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
1401	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
1402	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	NH ₂	—
1403	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	NHMe	—
1404	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	NH <i>iso</i> -Pr	—
1405	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	N(Me) ₂	—
1406	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	N(Et) ₂	—
1407	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CN	—
1408	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CHO	—
1409	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	COMe	—
1410	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	COEt	—
1411	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CO ₂ H	—
1412	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CO ₂ Me	—
1413	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CO ₂ Et	—
1414	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CONH ₂	—
1415	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CONHMe	—
1416	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CONOMe ₂	—
1417	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	Me	—
1418	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	Et	—
1419	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	<i>iso</i> -Pr	—
1420	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	<i>n</i> -Pr	—
1421	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CH ₂ F	—

[Tabela 29]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1422	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CH ₂ Cl	—
1423	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CH ₂ Br	—
1424	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CHF ₃	—
1425	3-Pen	CHOMeCF ₃	H	CF ₃	—
1426	3-Pen	Et	Et	H	—
1427	3-Pen	Et	Et	F	—
1428	3-Pen	Et	Et	Cl	—
1429	3-Pen	Et	Et	Br	—
1430	3-Pen	Et	Et	CN	—
1431	3-Pen	Et	Et	Me	—
1432	3-Pen	Et	Et	CF ₃	—
1433	3-Pen	-CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		H	—
1434	3-Pen			F	—
1435	3-Pen			Cl	—
1436	3-Pen			Br	—
1437	3-Pen			CN	—
1438	3-Pen			Me	—
1439	3-Pen			CF ₃	—
1440	3-Pen	(CH ₃) ₂ CHOMe(CH ₃) ₂		H	—
1441	3-Pen			F	—
1442	3-Pen			Cl	—
1443	3-Pen			Br	—
1444	3-Pen			CN	—
1445	3-Pen			Me	—
1446	3-Pen			CF ₃	—
1447	tert-Bu	iso-Pr	H	H	—
1448	tert-Bu	iso-Pr	H	Cl	—
1449	tert-Bu	iso-Pr	H	CN	—
1450	tert-Bu	iso-Pr	H	Me	—
1451	tert-Bu	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1452	tert-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1453	tert-Bu	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1454	tert-Bu	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1455	tert-Bu	Et	Et	H	—
1456	tert-Bu	Et	Et	Cl	—
1457	tert-Bu	Et	Et	CN	—
1458	tert-Bu	Et	Et	Me	—
1459	tert-Bu	(CH ₃) ₂ CHOMe(CH ₃) ₂		H	—
1460	tert-Bu			Cl	—
1461	tert-Bu			CN	—
1462	tert-Bu			Me	—
1463	OMe ₂ Et	iso-Pr	H	H	—
1464	OMe ₂ Et	iso-Pr	H	Cl	—
1465	OMe ₂ Et	iso-Pr	H	CN	—
1466	OMe ₂ Et	iso-Pr	H	Me	—
1467	OMe ₂ Et	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1468	OMe ₂ Et	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1469	OMe ₂ Et	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1470	OMe ₂ Et	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1471	OMe ₂ Et	Et	Et	H	—
1472	OMe ₂ Et	Et	Et	Cl	—

[Tabela 30]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1413	OMe, Et	Et	Et	ON	—
1414	OMe, Et	Et	Et	Me	—
1415	OMe, Et	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		H	—
1416	OMe, Et	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		Cl	—
1417	OMe, Et	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		ON	—
1418	OMe, Et	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		Me	—
1419	n-Pr	iso-Pr	H	H	—
1480	n-Pr	iso-Pr	H	Cl	—
1481	n-Pr	iso-Pr	H	ON	—
1482	n-Pr	iso-Pr	H	Me	—
1483	n-Pr	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1484	n-Pr	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1485	n-Pr	CH ₂ CF ₃	H	ON	—
1486	n-Pr	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1487	n-Pr	Et	Et	H	—
1488	n-Pr	Et	Et	Cl	—
1489	n-Pr	Et	Et	ON	—
1490	n-Pr	Et	Et	Me	—
1491	n-Pr	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		H	—
1492	n-Pr	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		Cl	—
1493	n-Pr	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		ON	—
1494	n-Pr	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		Me	—
1496	n-Pen	iso-Pr	H	H	—
1496	n-Pen	iso-Pr	H	F	—
1497	n-Pen	iso-Pr	H	Cl	—
1498	n-Pen	iso-Pr	H	Br	—
1499	n-Pen	iso-Pr	H	ON	—
1500	n-Pen	iso-Pr	H	Me	—
1501	n-Pen	iso-Pr	H	CF ₃	—
1502	n-Pen	tert-Bu	H	H	—
1503	n-Pen	tert-Bu	H	F	—
1504	n-Pen	tert-Bu	H	Cl	—
1505	n-Pen	tert-Bu	H	Br	—
1506	n-Pen	tert-Bu	H	ON	—
1507	n-Pen	tert-Bu	H	Me	—
1508	n-Pen	tert-Bu	H	CF ₃	—
1509	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1510	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	F	—
1511	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1512	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	Br	—
1513	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	I	—
1514	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OH	—
1515	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OMe	—
1516	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OEt	—
1517	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ n-Pr	—
1518	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OCF ₃	—
1519	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OCF ₃	—
1520	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ CHF ₃	—
1521	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	—
1522	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OMe	—
1523	n-Pen	CH ₂ CF ₃	H	OMe	—

[Tabela 31]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1524	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	SO ₂ Me	—
1525	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	SCF ₃	—
1526	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
1527	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	SO ₂ CF ₂	—
1528	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	NH ₂	—
1529	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	NHMe	—
1530	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	NH <i>iso</i> -Pr	—
1531	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	NOMe ₂	—
1532	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	NOD ₂	—
1533	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1534	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CHO	—
1535	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	COMe	—
1536	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	OOEt	—
1537	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CO ₂ H	—
1538	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CO ₂ Me	—
1539	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CO ₂ Et	—
1540	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CONH ₂	—
1541	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CONHMe	—
1542	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CONOMe ₂	—
1543	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1544	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	Et	—
1545	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	<i>iso</i> -Pr	—
1546	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	<i>c</i> -Pr	—
1547	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ F	—
1548	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ Cl	—
1549	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CH ₂ Br	—
1550	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CHF ₃	—
1551	<i>c</i> -Pen	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	—
1552	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	H	—
1553	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	F	—
1554	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	Cl	—
1555	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	Br	—
1556	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	I	—
1557	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	OH	—
1558	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	OMe	—
1559	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	OEt	—
1560	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	OCH ₂ <i>c</i> -Pr	—
1561	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	OCHE ₃	—
1562	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	OCF ₃	—
1563	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	OCH ₂ CHF ₃	—
1564	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	—
1565	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	SiMe ₃	—
1566	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	SO ₂ Me	—
1567	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	SO ₂ CF ₃	—
1568	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	SCF ₃	—
1569	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	SO ₂ CF ₂	—
1570	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	SO ₂ CF ₂	—
1571	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	NH ₂	—
1572	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	NHMe	—
1573	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	NH <i>iso</i> -Pr	—
1574	<i>c</i> -Pen	CHOMeCF ₃	H	NOMe ₂	—

[Tabela 32]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1575	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	N(Et) ₂	—
1576	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CN	—
1577	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CHO	—
1578	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	COMe	—
1579	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	COEt	—
1580	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CO ₂ H	—
1581	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CO ₂ Me	—
1582	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CO ₂ Et	—
1583	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CONH ₂	—
1584	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CONHMe	—
1585	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CON(OMe) ₂	—
1586	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	Me	—
1587	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	Et	—
1588	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	iso-Pr	—
1589	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	n-Pr	—
1590	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CH ₃ F	—
1591	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CH ₃ Cl	—
1592	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CH ₃ Br	—
1593	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CH ₃ I	—
1594	c-Pen	CH(OAc)CF ₃	H	CF ₃	—
1595	c-Pen	Et	Et	H	—
1596	c-Pen	Et	Et	F	—
1597	c-Pen	Et	Et	Cl	—
1598	c-Pen	Et	Et	Br	—
1599	c-Pen	Et	Et	CN	—
1600	c-Pen	Et	Et	Me	—
1601	c-Pen	Et	Et	CF ₃	—
1602	c-Pen	CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		H	—
1603	c-Pen	CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		F	—
1604	c-Pen	CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		Cl	—
1605	c-Pen	CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		Br	—
1606	c-Pen	CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CN	—
1607	c-Pen	CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		Me	—
1608	c-Pen	CH(CF ₃)(CH ₃) ₂		CF ₃	—
1609	c-Pen	(CH ₃) ₂ CHOMe(CH ₃) ₂		H	—
1610	c-Pen	(CH ₃) ₂ CHOMe(CH ₃) ₂		F	—
1611	c-Pen	(CH ₃) ₂ CHOMe(CH ₃) ₂		Cl	—
1612	c-Pen	(CH ₃) ₂ CHOMe(CH ₃) ₂		Br	—
1613	c-Pen	(CH ₃) ₂ CHOMe(CH ₃) ₂		CN	—
1614	c-Pen	(CH ₃) ₂ CHOMe(CH ₃) ₂		Me	—
1615	c-Pen	(CH ₃) ₂ CHOMe(CH ₃) ₂		CF ₃	—
1616	c-Hex	iso-Pr	H	H	—
1617	c-Hex	iso-Pr	H	Cl	—
1618	c-Hex	iso-Pr	H	CN	—
1619	c-Hex	iso-Pr	H	Me	—
1620	c-Hex	CH ₃ CF ₃	H	H	—
1621	c-Hex	CH ₃ CF ₃	H	Cl	—
1622	c-Hex	CH ₃ CF ₃	H	CN	—
1623	c-Hex	CH ₃ CF ₃	H	Me	—
1624	c-Hex	Et	Et	H	—
1625	c-Hex	Et	Et	Cl	—

[Tabela 33]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _n
1626	<i>n</i> -Hex	Et	Et	CN	—
1627	<i>n</i> -Hex	Et	Et	Me	—
1628	<i>n</i> -Hex	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		H	—
1629	<i>n</i> -Hex	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		Cl	—
1630	<i>n</i> -Hex	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		CN	—
1631	<i>n</i> -Hex	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		Me	—
1632	CH ₃ -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
1633	CH ₃ -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
1634	CH ₃ -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
1635	CH ₃ -Pr	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
1636	CH ₃ -Pr	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1637	CH ₃ -Pr	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1638	CH ₃ -Pr	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1639	CH ₃ -Pr	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1640	CH ₃ -Pr	Et	Et	H	—
1641	CH ₃ -Pr	Et	Et	Cl	—
1642	CH ₃ -Pr	Et	Et	CN	—
1643	CH ₃ -Pr	Et	Et	Me	—
1644	CH ₃ -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		H	—
1645	CH ₃ -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		Cl	—
1646	CH ₃ -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		CN	—
1647	CH ₃ -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		Me	—
1648	CH ₂ CF ₃	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
1649	CH ₂ CF ₃	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
1650	CH ₂ CF ₃	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
1651	CH ₂ CF ₃	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
1652	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1653	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1654	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1655	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1656	CH ₂ CF ₃	Et	Et	H	—
1657	CH ₂ CF ₃	Et	Et	Cl	—
1658	CH ₂ CF ₃	Et	Et	CN	—
1659	CH ₂ CF ₃	Et	Et	Me	—
1660	CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		H	—
1661	CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		Cl	—
1662	CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		CN	—
1663	CH ₂ CF ₃	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		Me	—
1664	CF ₃ OMe ₂	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
1665	CF ₃ OMe ₂	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
1666	CF ₃ OMe ₂	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
1667	CF ₃ OMe ₂	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
1668	CF ₃ OMe ₂	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1669	CF ₃ OMe ₂	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1670	CF ₃ OMe ₂	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1671	CF ₃ OMe ₂	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1672	CF ₃ OMe ₂	Et	Et	H	—
1673	CF ₃ OMe ₂	Et	Et	Cl	—
1674	CF ₃ OMe ₂	Et	Et	CN	—
1675	CF ₃ OMe ₂	Et	Et	Me	—
1676	CF ₃ OMe ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂		H	—

[Tabela 34]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1677	CF(Me) ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		Cl	—
1678	CF(Me) ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		CN	—
1679	CF(Me) ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		Me	—
1680	CFOMeEt	iso-Pr	H	H	—
1681	CFOMeEt	iso-Pr	H	Cl	—
1682	CFOMeEt	iso-Pr	H	CN	—
1683	CFOMeEt	iso-Pr	H	Me	—
1684	CFOMeEt	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1685	CFOMeEt	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1686	CFOMeEt	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1687	CFOMeEt	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1688	CFOMeEt	Et	Et	H	—
1689	CFOMeEt	Et	Et	Cl	—
1690	CFOMeEt	Et	Et	CN	—
1691	CFOMeEt	Et	Et	Me	—
1692	CFOMeEt	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		H	—
1693	CFOMeEt	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		Cl	—
1694	CFOMeEt	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		CN	—
1695	CFOMeEt	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		Me	—
1696	CF(CF ₃) ₂	iso-Pr	H	H	—
1697	CF(CF ₃) ₂	iso-Pr	H	Cl	—
1698	CF(CF ₃) ₂	iso-Pr	H	CN	—
1699	CF(CF ₃) ₂	iso-Pr	H	Me	—
1700	CF(CF ₃) ₂	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1701	CF(CF ₃) ₂	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1702	CF(CF ₃) ₂	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1703	CF(CF ₃) ₂	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1704	CF(CF ₃) ₂	Et	Et	H	—
1705	CF(CF ₃) ₂	Et	Et	Cl	—
1706	CF(CF ₃) ₂	Et	Et	CN	—
1707	CF(CF ₃) ₂	Et	Et	Me	—
1708	CF(CF ₃) ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		H	—
1709	CF(CF ₃) ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		Cl	—
1710	CF(CF ₃) ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		CN	—
1711	CF(CF ₃) ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		Me	—
1712	CH ₂ OH	iso-Pr	H	H	—
1713	CH ₂ OH	iso-Pr	H	Cl	—
1714	CH ₂ OH	iso-Pr	H	CN	—
1715	CH ₂ OH	iso-Pr	H	Me	—
1716	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1717	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1718	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1719	CH ₂ OH	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1720	CH ₂ OH	Et	Et	H	—
1721	CH ₂ OH	Et	Et	Cl	—
1722	CH ₂ OH	Et	Et	CN	—
1723	CH ₂ OH	Et	Et	Me	—
1724	CH ₂ OH	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		H	—
1725	CH ₂ OH	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		Cl	—
1726	CH ₂ OH	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		CN	—
1727	CH ₂ OH	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₃ -		Me	—

[Tabela 35]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1728	CHOHMe	iso-Pr	H	H	—
1729	CHOHMe	iso-Pr	H	Cl	—
1730	CHOHMe	iso-Pr	H	ON	—
1731	CHOHMe	iso-Pr	H	Me	—
1732	CHOHMe	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1733	CHOHMe	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1734	CHOHMe	CH ₂ CF ₃	H	ON	—
1735	CHOHMe	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1736	CHOHMe	Et	Et	H	—
1737	CHOHMe	Et	Et	Cl	—
1738	CHOHMe	Et	Et	ON	—
1739	CHOHMe	Et	Et	Me	—
1740	CHOHMe	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		H	—
1741	CHOHMe	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		Cl	—
1742	CHOHMe	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		ON	—
1743	CHOHMe	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		Me	—
1744	CHOHMe	iso-Pr	H	H	—
1745	CHOHMe	iso-Pr	H	Cl	—
1746	CHOHMe	iso-Pr	H	ON	—
1747	CHOHMe	iso-Pr	H	Me	—
1748	CHOHMe	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1749	CHOHMe	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1750	CHOHMe	CH ₂ CF ₃	H	ON	—
1751	CHOHMe	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1752	CHOHMe	Et	Et	H	—
1753	CHOHMe	Et	Et	Cl	—
1754	CHOHMe	Et	Et	ON	—
1755	CHOHMe	Et	Et	Me	—
1756	CHOHMe	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		H	—
1757	CHOHMe	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		Cl	—
1758	CHOHMe	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		ON	—
1759	CHOHMe	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		Me	—
1760	CHOH <i>iso</i> -Pr	iso-Pr	H	H	—
1761	CHOH <i>iso</i> -Pr	iso-Pr	H	Cl	—
1762	CHOH <i>iso</i> -Pr	iso-Pr	H	ON	—
1763	CHOH <i>iso</i> -Pr	iso-Pr	H	Me	—
1764	CHOH <i>iso</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1765	CHOH <i>iso</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1766	CHOH <i>iso</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	H	ON	—
1767	CHOH <i>iso</i> -Pr	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1768	CHOH <i>iso</i> -Pr	Et	Et	H	—
1769	CHOH <i>iso</i> -Pr	Et	Et	Cl	—
1770	CHOH <i>iso</i> -Pr	Et	Et	ON	—
1771	CHOH <i>iso</i> -Pr	Et	Et	Me	—
1772	CHOH <i>iso</i> -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		H	—
1773	CHOH <i>iso</i> -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		Cl	—
1774	CHOH <i>iso</i> -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		ON	—
1775	CHOH <i>iso</i> -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMeX(CH ₂) ₃		Me	—
1776	CHOHMe	iso-Pr	H	H	—
1777	CHOHMe	iso-Pr	H	Cl	—
1778	CHOHMe	iso-Pr	H	ON	—

[Tabela 36]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1779	CH(OAc)Me	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
1780	CH(OAc)Me	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1781	CH(OAc)Me	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1782	CH(OAc)Me	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1783	CH(OAc)Me	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1784	CH(OAc)Me	Et	Et	H	—
1785	CH(OAc)Me	Et	Et	Cl	—
1786	CH(OAc)Me	Et	Et	CN	—
1787	CH(OAc)Me	Et	Et	Me	—
1788	CH(OAc)Me	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		H	—
1789	CH(OAc)Me	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		Cl	—
1790	CH(OAc)Me	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		CN	—
1791	CH(OAc)Me	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		Me	—
1792	CH(OEt)Me	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
1793	CH(OEt)Me	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
1794	CH(OEt)Me	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
1795	CH(OEt)Me	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
1796	CH(OEt)Me	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1797	CH(OEt)Me	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1798	CH(OEt)Me	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1799	CH(OEt)Me	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1800	CH(OEt)Me	Et	Et	H	—
1801	CH(OEt)Me	Et	Et	Cl	—
1802	CH(OEt)Me	Et	Et	CN	—
1803	CH(OEt)Me	Et	Et	Me	—
1804	CH(OEt)Me	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		H	—
1805	CH(OEt)Me	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		Cl	—
1806	CH(OEt)Me	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		CN	—
1807	CH(OEt)Me	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		Me	—
1808	CH(OMe)Et	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
1809	CH(OMe)Et	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
1810	CH(OMe)Et	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
1811	CH(OMe)Et	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
1812	CH(OMe)Et	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1813	CH(OMe)Et	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1814	CH(OMe)Et	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1815	CH(OMe)Et	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1816	CH(OMe)Et	Et	Et	H	—
1817	CH(OMe)Et	Et	Et	Cl	—
1818	CH(OMe)Et	Et	Et	CN	—
1819	CH(OMe)Et	Et	Et	Me	—
1820	CH(OMe)Et	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		H	—
1821	CH(OMe)Et	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		Cl	—
1822	CH(OMe)Et	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		CN	—
1823	CH(OMe)Et	(CH ₂) ₂ CHOMe(CH ₂) ₂		Me	—
1824	Cl=OH	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
1825	Cl=OH	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
1826	Cl=OH	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
1827	Cl=OH	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
1828	Cl=OH	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1829	Cl=OH	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—

[Tabela 37]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1890	Cl-OH	CH ₂ CF ₃	H	ON	—
1891	Cl-OH	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1892	Cl-OH	Et	Et	H	—
1893	Cl-OH	Et	Et	Cl	—
1894	Cl-OH	Et	Et	ON	—
1895	Cl-OH	Et	Et	Me	—
1896	Cl-OH	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		H	—
1897	Cl-OH	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Cl	—
1898	Cl-OH	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		ON	—
1899	Cl-OH	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Me	—
1900	Cl-OMe	iso-Pr	H	H	—
1901	Cl-OMe	iso-Pr	H	Cl	—
1902	Cl-OMe	iso-Pr	H	ON	—
1903	Cl-OMe	iso-Pr	H	Me	—
1904	Cl-OMe	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1905	Cl-OMe	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1906	Cl-OMe	CH ₂ CF ₃	H	ON	—
1907	Cl-OMe	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1908	Cl-OMe	Et	Et	H	—
1909	Cl-OMe	Et	Et	Cl	—
1910	Cl-OMe	Et	Et	SO ₂ Me	—
1911	Cl-OMe	Et	Et	ON	—
1912	Cl-OMe	Et	Et	Me	—
1913	Cl-OMe	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		H	—
1914	Cl-OMe	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Cl	—
1915	Cl-OMe	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		ON	—
1916	Cl-OMe	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Me	—
1917	Cl-OEt	iso-Pr	H	H	—
1918	Cl-OEt	iso-Pr	H	Cl	—
1919	Cl-OEt	iso-Pr	H	ON	—
1920	Cl-OEt	iso-Pr	H	Me	—
1921	Cl-OEt	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1922	Cl-OEt	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1923	Cl-OEt	CH ₂ CF ₃	H	ON	—
1924	Cl-OEt	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1925	Cl-OEt	Et	Et	H	—
1926	Cl-OEt	Et	Et	Cl	—
1927	Cl-OEt	Et	Et	ON	—
1928	Cl-OEt	Et	Et	Me	—
1929	Cl-OEt	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		H	—
1930	Cl-OEt	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Cl	—
1931	Cl-OEt	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		ON	—
1932	Cl-OEt	(CH ₂) ₂ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Me	—
1933	Cl(O)iso-Pr	iso-Pr	H	H	—
1934	Cl(O)iso-Pr	iso-Pr	H	Cl	—
1935	Cl(O)iso-Pr	iso-Pr	H	ON	—
1936	Cl(O)iso-Pr	iso-Pr	H	Me	—
1937	Cl(O)iso-Pr	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1938	Cl(O)iso-Pr	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1939	Cl(O)iso-Pr	CH ₂ CF ₃	H	ON	—
1940	Cl(O)iso-Pr	CH ₂ CF ₃	H	Me	—

[Tabela 38]

Compound No	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1881	C(=O) <i>iso</i> -Pr	Et	Et	H	—
1882	C(=O) <i>iso</i> -Pr	Et	Et	Cl	—
1883	C(=O) <i>iso</i> -Pr	Et	Et	CN	—
1884	C(=O) <i>iso</i> -Pr	Et	Et	Me	—
1885	C(=O) <i>iso</i> -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		H	—
1886	C(=O) <i>iso</i> -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Cl	—
1887	C(=O) <i>iso</i> -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		CN	—
1888	C(=O) <i>iso</i> -Pr	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Me	—
1889	CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
1890	CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
1891	CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
1892	CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
1893	CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1894	CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1895	CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1896	CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1897	CH=CH ₂	Et	Et	H	—
1898	CH=CH ₂	Et	Et	Cl	—
1899	CH=CH ₂	Et	Et	CN	—
1900	CH=CH ₂	Et	Et	Me	—
1901	CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		H	—
1902	CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Cl	—
1903	CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		CN	—
1904	CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Me	—
1905	CH ₂ CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
1906	CH ₂ CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
1907	CH ₂ CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
1908	CH ₂ CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
1909	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1910	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1911	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1912	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1913	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Et	H	—
1914	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Et	Cl	—
1915	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Et	CN	—
1916	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Et	Me	—
1917	CH ₂ CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		H	—
1918	CH ₂ CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Cl	—
1919	CH ₂ CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		CN	—
1920	CH ₂ CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(XCH ₂) ₂ -		Me	—
1921	CHOMe)CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
1922	CHOMe)CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
1923	CHOMe)CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
1924	CHOMe)CH=CH ₂	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
1925	CHOMe)CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1926	CHOMe)CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1927	CHOMe)CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1928	CHOMe)CH=CH ₂	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1929	CHOMe)CH=CH ₂	Et	Et	H	—
1930	CHOMe)CH=CH ₂	Et	Et	Cl	—
1931	CHOMe)CH=CH ₂	Et	Et	CN	—

[Tabela 39]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1932	CHOMe)CH=CH ₂	Et	Et	Me	—
1933	CHOMe)CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		H	—
1934	CHOMe)CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		Cl	—
1935	CHOMe)CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		CN	—
1936	CHOMe)CH=CH ₂	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		Me	—
1937	COMe)CHMe	iso-Pr	H	H	—
1938	COMe)CHMe	iso-Pr	H	Cl	—
1939	COMe)CHMe	iso-Pr	H	CN	—
1940	COMe)CHMe	iso-Pr	H	Me	—
1941	COMe)CHMe	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1942	COMe)CHMe	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1943	COMe)CHMe	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1944	COMe)CHMe	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1945	COMe)CHMe	Et	Et	H	—
1946	COMe)CHMe	Et	Et	Cl	—
1947	COMe)CHMe	Et	Et	CN	—
1948	COMe)CHMe	Et	Et	Me	—
1949	COMe)CHMe	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		H	—
1950	COMe)CHMe	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		Cl	—
1951	COMe)CHMe	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		CN	—
1952	COMe)CHMe	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		Me	—
1953	2-cyclopenten-1-yl	iso-Pr	H	H	—
1954	2-cyclopenten-1-yl	iso-Pr	H	Cl	—
1955	2-cyclopenten-1-yl	iso-Pr	H	CN	—
1956	2-cyclopenten-1-yl	iso-Pr	H	Me	—
1957	2-cyclopenten-1-yl	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1958	2-cyclopenten-1-yl	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1959	2-cyclopenten-1-yl	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1960	2-cyclopenten-1-yl	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1961	2-cyclopenten-1-yl	Et	Et	H	—
1962	2-cyclopenten-1-yl	Et	Et	Cl	—
1963	2-cyclopenten-1-yl	Et	Et	CN	—
1964	2-cyclopenten-1-yl	Et	Et	Me	—
1965	2-cyclopenten-1-yl	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		H	—
1966	2-cyclopenten-1-yl	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		Cl	—
1967	2-cyclopenten-1-yl	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		CN	—
1968	2-cyclopenten-1-yl	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		Me	—
1969	2-cyclopenten-1-yl	iso-Pr	H	H	—
1970	2-cyclopenten-1-yl	iso-Pr	H	Cl	—
1971	2-cyclopenten-1-yl	iso-Pr	H	CN	—
1972	2-cyclopenten-1-yl	iso-Pr	H	Me	—
1973	2-cyclopenten-1-yl	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1974	2-cyclopenten-1-yl	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1975	2-cyclopenten-1-yl	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1976	2-cyclopenten-1-yl	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1977	2-cyclopenten-1-yl	Et	Et	H	—
1978	2-cyclopenten-1-yl	Et	Et	Cl	—
1979	2-cyclopenten-1-yl	Et	Et	CN	—
1980	2-cyclopenten-1-yl	Et	Et	Me	—
1981	2-cyclopenten-1-yl	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		H	—
1982	2-cyclopenten-1-yl	(CH ₂) ₃ CHOMe(CH ₂) ₂		Cl	—

[Tabela 40]

Compound No.	R	R ¹	R ²	X	Y _m
1983	2-cyclopenten-1-yl	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₁ -		CN	—
1984	2-cyclopenten-1-yl	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₁ -		Me	—
1985	1,3-dioxolan-2-yl	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
1986	1,3-dioxolan-2-yl	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
1987	1,3-dioxolan-2-yl	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
1988	1,3-dioxolan-2-yl	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
1989	1,3-dioxolan-2-yl	CH ₂ CF ₃	H	H	—
1990	1,3-dioxolan-2-yl	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
1991	1,3-dioxolan-2-yl	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
1992	1,3-dioxolan-2-yl	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
1993	1,3-dioxolan-2-yl	Et	Et	H	—
1994	1,3-dioxolan-2-yl	Et	Et	Cl	—
1995	1,3-dioxolan-2-yl	Et	Et	SO ₂ Me	—
1996	1,3-dioxolan-2-yl	Et	Et	CN	—
1997	1,3-dioxolan-2-yl	Et	Et	Me	—
1998	1,3-dioxolan-2-yl	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₁ -		H	—
1999	1,3-dioxolan-2-yl	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₁ -		Cl	—
2000	1,3-dioxolan-2-yl	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₁ -		CN	—
2001	1,3-dioxolan-2-yl	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₁ -		Me	—
2002	1,3-dioxan-2-yl	<i>iso</i> -Pr	H	H	—
2003	1,3-dioxan-2-yl	<i>iso</i> -Pr	H	Cl	—
2004	1,3-dioxan-2-yl	<i>iso</i> -Pr	H	CN	—
2005	1,3-dioxan-2-yl	<i>iso</i> -Pr	H	Me	—
2006	1,3-dioxan-2-yl	CH ₂ CF ₃	H	H	—
2007	1,3-dioxan-2-yl	CH ₂ CF ₃	H	Cl	—
2008	1,3-dioxan-2-yl	CH ₂ CF ₃	H	CN	—
2009	1,3-dioxan-2-yl	CH ₂ CF ₃	H	Me	—
2010	1,3-dioxan-2-yl	Et	Et	H	—
2011	1,3-dioxan-2-yl	Et	Et	Cl	—
2012	1,3-dioxan-2-yl	Et	Et	CN	—
2013	1,3-dioxan-2-yl	Et	Et	Me	—
2014	1,3-dioxan-2-yl	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₁ -		H	—
2015	1,3-dioxan-2-yl	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₁ -		Cl	—
2016	1,3-dioxan-2-yl	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₁ -		CN	—
2017	1,3-dioxan-2-yl	(CH ₂) ₃ CH(Me)(CH ₂) ₁ -		Me	—

Legenda das Tabelas:

5 Compound No. = Composto N^o

sec-Bu

terc-Bu

2-ciclopenten-1-ila

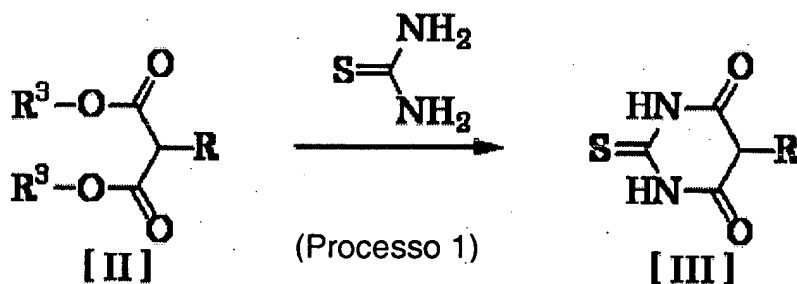
1,3-dioxolan-2-ila.

10 O composto do presente pedido representado pela Fórmula [I] pode ser produzido de acordo com Métodos de Produção mostrados abaixo, porém não-limitados por estes métodos. Os Métodos de Produção são descritos em detalhes para todo o processo.

<Método de Produção 1>

(Processo 1)

[Fórmula Química 3]



- 5 (em que R tem o mesmo significado como definido acima e R³s são cada qual um grupo de saída tal como um grupo C₁₋₆ alquila, um grupo fenila opcionalmente substituído ou um grupo benzila opcionalmente substituído).

O composto representado pela Fórmula [III] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [II] reagir com tiouréia em
 10 um solvente adequado na presença de uma base adequada.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C à temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 10 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com
 15 uma temperatura reacional, um reagente, uma quantidade de reação, ou similares, porém é entre 0,5 e 120 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 2 equivalentes da tiouréia e 1 a 5 equivalentes da base são usados com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [II].
 20 Além disso, a quantidade de solvente a ser usado é de 0 a 50 L (litro), preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [II].

O solvente para uso no presente processo pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da
 25 presente reação. Exemplos destes podem incluir éteres tais como 1,2-dimetoxietano e tetraidrofurano; amidas tais como N,N-dimetilacetoamida, N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona e N-metil-2-pirrolidinona;

compostos de enxofre tais como dimetilsulfóxido e sulfolano; hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno e xileno; álcoois tais como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, 2-metoxietanol e terc-butanol; água; e uma mistura destes.

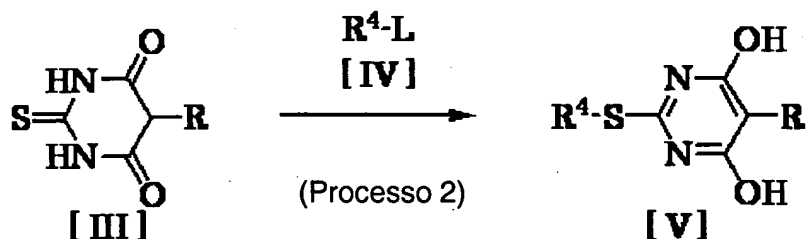
- 5 Exemplos da base que pode ser utilizada no presente processo podem incluir bases orgânicas tais como piridina, trietilamina, tributilamina e 1,8-iazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno; bases inorgânicas tais como hidróxido de metal de álcali, por exemplo, hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio, hidróxido de metal alcalino terroso, por exemplo, hidróxido de cálcio ou hi-
- 10 dróxido de magnésio, carbonatos de metal de álcali, por exemplo, carbonato de sódio ou carbonato de potássio, acetatos de metal de álcali, por exemplo, acetato de sódio ou acetato de potássio e bicarbonatos de metal de álcali, por exemplo, bicarbonato de sódio ou bicarbonato de potássio; e sais de me-
- 15 tal de álcool tais como metóxido de sódio, etóxido de sódio e terc-butóxido de potássio.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [III] que é um produto desejado da presente reação pode ser utilizado no processo subsequente sem ser isolado e purificado, porém pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização, como o caso

20 requer.

(Processo 2)

[Fórmula Química 4]



- (em que R tem o mesmo significado como definido acima, R⁴ é um grupo C₁₋₆ alquila, um grupo fenila opcionalmente substituído, ou um grupo benzila opcionalmente substituído e L é um átomo de halogênio, um grupo alquilsul-
- 25 fonilóxi opcionalmente substituído, um grupo fenilsulfonilóxi opcionalmente

substituído, ou um grupo benzilsulfonilóxi opcionalmente substituído).

O composto representado pela Fórmula [V] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [III] reagir com o composto representado pela Fórmula [IV] em um solvente adequado, na presença de uma base adequada.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 10 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 72 horas.

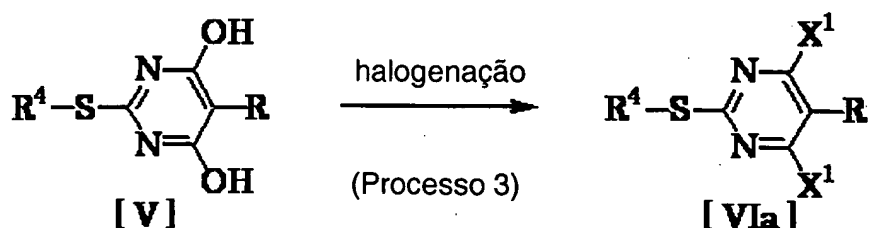
Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 3 equivalentes do composto representado pela Fórmula [IV] e 1 a 3 equivalentes da base são usados com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [III]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [III].

Como o solvente e a base que podem ser utilizados no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 1 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [V] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

(Processo 3)

[Fórmula Química 5]



(em que R e R4 têm os mesmos significados como definido acima e X1 é um átomo de cloro ou um átomo de bromo).

O composto representado pela Fórmula [VIa] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [V] reagir com um agente de halogenação em um solvente adequado ou na ausência de um solvente. Além disso, um catalisador adequado pode ser adicionado para a produção.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 72 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 5 equivalentes do agente de halogenação e 0,01 a 1,0 equivalente do catalisador é utilizado com respeito a 5 a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [V].

Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [V].

O solvente para uso no presente processo pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da presente reação. Exemplos deste podem incluir nitrilas tais como acetonitrila; hidrocarbonetos aromáticos tais como tolueno e xileno; hidrocarbonetos halogenados tais como monoclorobenzeno e 1,2-dicloroetano; e similares.

Como o agente de halogenação que pode ser utilizado no presente processo, oxiclreto de fósforo, oxibrometo de fósforo, cloreto de tionila, brometo de tionila, ou similar podem ser exemplificados.

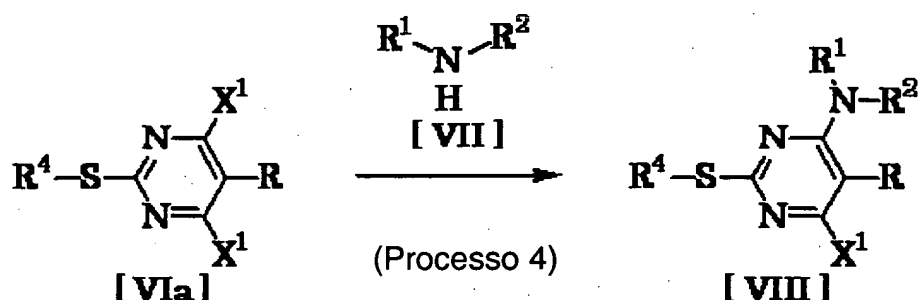
Como o catalisador que pode ser utilizado no presente processo, trietilamina, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, ou similar podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [VIa] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado

do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

(Processo 4)

5 [Fórmula Química 6]



(em que R, R¹, R², R⁴ e X¹ têm os mesmos significados como definido acima).

10 O composto representado pela Fórmula [VIII] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [VIa] reagir com o composto representado pela Fórmula [VII] em um solvente adequado ou na ausência de um solvente, na presença de uma base adequada. Além disso, um catalisador adequado pode ser adicionado para a produção.

15 A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

20 Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 3, preferivelmente 1 a 1,5 equivalentes do composto representado pela Fórmula [VII], 1 a 3, preferivelmente 1 a 1,5 equivalentes da base e 0,001 a 0,5 equivalente do catalisador são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [VIa]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L,
25 com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [VIa].

O solvente para uso no presente processo pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da presente reação. Exemplos destes podem incluir éteres tais como 1,2-dimetoxietano e tetraidrofurano; hidrocarbonetos halogenados tais como dicloroetano, tetracloreto de carbono, clorobenzeno e diclorobenzeno; amidas tais como N,N-dimetilacetoamida, N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona e N-metil-2-pirrolidinona; compostos de enxofre tais como dimetilsulfóxido e sulfolano; hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno e xileno; álcoois tais como metanol, etanol, n-propanol, 2-propanol, n-butanol e 2-metil-2-propanol; nitrilas tais como acetonitrila; ácidos carboxílicos tais como ácido fórmico e ácido acético; água; e uma mistura destes.

Exemplos da base que pode ser utilizada no presente processo podem incluir bases orgânicas tais como piridina, trietil-amina, tributilamina e 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno; bases inorgânicas tais como hidróxido de metal de álcali, por exemplo, hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio, hidróxido de metal alcalino terroso, por exemplo, hidróxido de cálcio ou hidróxido de magnésio, carbonatos de metal de álcali, por exemplo, carbonato de sódio ou carbonato de potássio e bicarbonatos de metal de álcali, por exemplo, bicarbonato de sódio ou bicarbonato de potássio; sais de metal de álcool tais como metóxido de sódio, etóxido de sódio e terc-butóxido de potássio; e hidretos de metal de álcali tais como hidreto de sódio.

Como o catalisador que pode ser utilizado no presente processo, por exemplo, p-toluenossulfonato de sódio, metanossulfonato de sódio, ou benzenossulfonato de sódio, podem ser exemplificados.

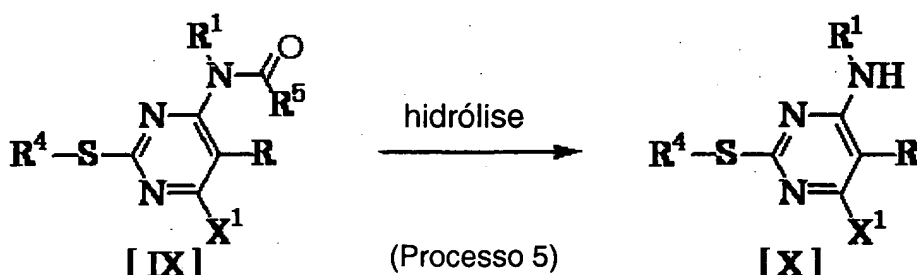
Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [VIII] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

Além disso, em lugar dos compostos representados pelas Fórmulas [VIa] e [VIII], um composto em que qualquer um de X1 é X (X tem o mesmo significado como definido acima, porém é um átomo diferente de um

átomo de cloro e a átomo de bromo) pode também ser usado como um material em estado natural como no presente processo e pode ser produzido.

(Processo 5)

[Fórmula Química 7]



- 5 (em que R, R¹, R⁴ e X¹ têm os mesmos significados como definido acima e R⁵ é um grupo C₁₋₆ alquila, um grupo C₁₋₆ haloalquila, ou um grupo C₁₋₆ alquilóxi).

- O composto representado pela Fórmula [X] pode ser produzido por hidrólise do composto representado pela Fórmula [IX] em um solvente adequado ou na ausência de um solvente com o uso de ácido ou base.
- 10

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

- O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.
- 15

- Para a quantidade de agente a ser fornecido na presente reação, 1 a 10, preferivelmente 1 a 3 equivalentes de ácido ou base podem ser utilizados com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [IX]. Uma quantidade do solvente a ser utilizado é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [IX].
- 20

- O solvente para uso no presente processo pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da presente reação. Exemplos destes podem incluir éteres tais como 1,2-dimetoxietano e tetraidrofurano; hidrocarbonetos halogenados tais como dicloroetano, tetracloreto de carbono, clorobenzeno e diclorobenzeno; amidas
- 25

tais como N,N-dimetilacetoamida, N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona e N-metil-2-pirrolidinona; compostos de enxofre tais como dimetilsulfóxido e sulfolano; hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno e xileno; álcoois tais como metanol, etanol, n-propanol, 2-propanol, n-butanol e 2-metil-2-propanol; nitrilas tais como acetonitrila; ácidos carboxílicos tais como ácido fórmico e ácido acético; água; e uma mistura destes.

Como o ácido que pode ser utilizado no presente processo, ácidos inorgânicos tais como ácido clorídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ou ácido nítrico; ácidos orgânicos tais como ácido fórmico, ácido acético, trifluoroácido acético, ácido metanossulfônico, ácido tartárico, ácido cítrico, ou ácido sucínico; ou uma mistura destes podem ser exemplificados.

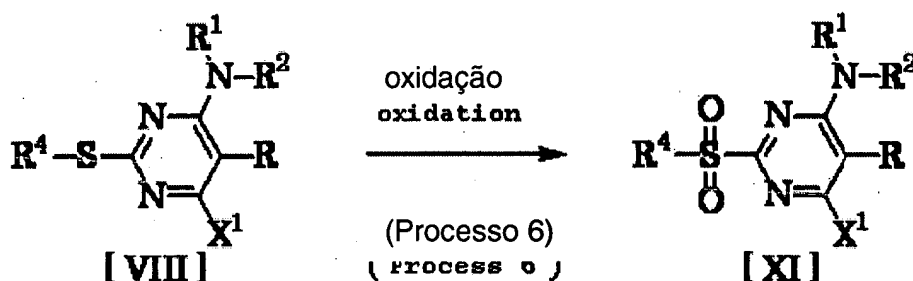
Exemplos da base que pode ser utilizada no presente processo podem incluir bases orgânicas tais como piridina, trietilamina, tributilamina e 1,8-iazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno; bases inorgânicas tais como hidróxido de metal de álcali, por exemplo, hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio, hidróxido de metal alcalino terroso, por exemplo, hidróxido de cálcio ou hidróxido de magnésio, carbonatos de metal de álcali, por exemplo, carbonato de sódio ou carbonato de potássio e bicarbonatos de metal de álcali, por exemplo, bicarbonato de sódio ou bicarbonato de potássio; sais de metal de álcool tais como metóxido de sódio, etóxido de sódio e terc-butóxido de potássio; e hidretos de metal de álcali tais como hidreto de sódio.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [X] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

Além disso, em lugar dos compostos representados pelas Fórmulas [IX] e [X], um composto em que X1 é X (X tem o mesmo significado como definido acima, porém é um átomo diferente de um átomo de cloro e a 30 átomo de bromo) pode também ser usado como um material em estado natural como no presente processo e pode ser produzido.

(Processo 6)

[Fórmula Química 8]



5 (em que R, R¹, R², R⁴ e X¹ têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [XI] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [VIII] reagir com um agente de oxidação em um solvente adequado. Além disso, um catalisador adequado pode ser adicionado para a produção.

10 A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de -30°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 100°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 0,5 e 48 horas.

15 ou a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 0,5 a 5 equivalentes de um agente de oxidação e 0,01 a 0,5 equivalente do catalisador são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [VIII]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [VIII].

20 O solvente para uso no presente processo pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da presente reação. Exemplos deste podem incluir hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, 1,2-dicloroetano, tetracloreto de carbono, clorobenzeno e diclorobenzeno; álcoois tais como metanol, etanol,

propanol, isopropanol, butanol e terc-butanol; cetonas tais como acetona e 2-butanona; nitrilas tais como acetonitrila; ácido acético; água; e uma mistura destes.

Exemplos do agente de oxidação que pode ser utilizado no presente processo podem incluir peróxidos orgânicos tais como m-cloroperbenzoato, ácido peroxifórmico e ácido peracético; e peróxidos inorgânicos tais como OXONE (nome comercial, produzido por Du Pont, $2\text{KHSO}_5 \cdot \text{KHSO}_4 \cdot \text{K}_2\text{SO}_4$), peróxido de hidrogênio, permanganato de potássio e periodato de sódio.

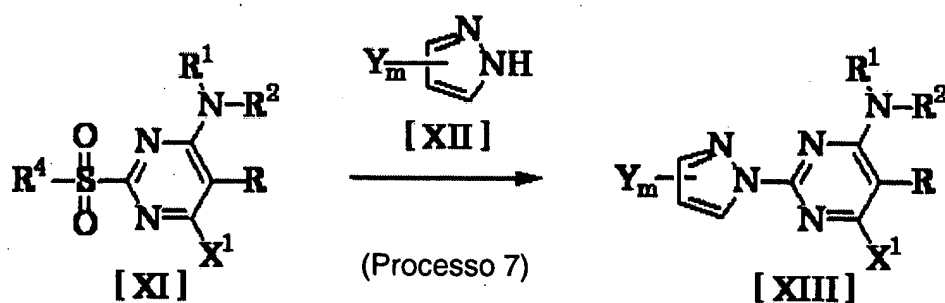
Como o catalisador que pode ser utilizado no presente processo, por exemplo, tungstato de sódio pode ser exemplificado.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XI] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

Além disso, em lugar dos compostos representados pelas Fórmulas [VIII] e [XI], um composto em que X^1 é X (X tem o mesmo significado como definido acima, porém é um átomo diferente de um átomo de cloro e a átomo de bromo) pode também ser usado como um material em estado natural como no presente processo e pode ser produzido.

(Processo 7)

[Fórmula Química 9]



(em que R , R^1 , R^2 , R^4 , X^1 , Y e m têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [XIII] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XI] reagir com o composto representado pela Fórmula [XII] em um solvente adequado na presença de uma base adequada.

5 A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de -30°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou
10 similares, porém é entre 0,5 e 48 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 3 equivalentes do composto representado pela Fórmula [XII] e 1 a 3 equivalentes da base são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XI]. Além disso, a quantidade de solvente
15 a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XI].

Como o solvente e a base que podem ser utilizados no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 4 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

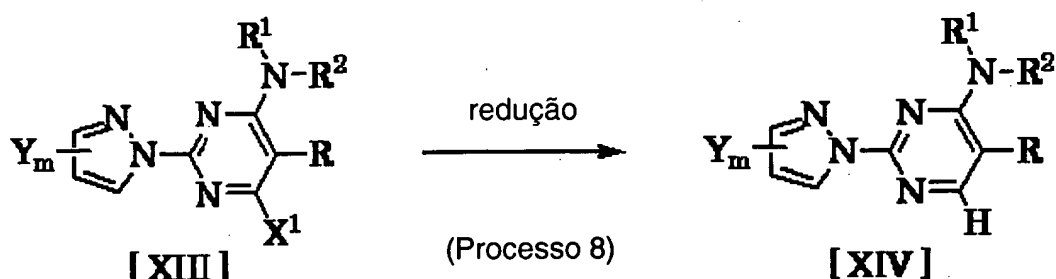
20 Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XIII] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

25 Além disso, em lugar dos compostos representados pelas Fórmulas [XI] e [XIII], um composto em que X1 é X (X tem o mesmo significado como definido acima, porém é um átomo diferente de um átomo de cloro e a átomo de bromo) pode também ser usado como um material em estado natural como no presente processo ou pode ser produzido.

30 <Método de Produção 2>

(Processo 8)

[Fórmula Química 10]



(em que R, R₁, R₂, X₁, Y e m têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [XIV] pode ser produzido reduzindo o composto representado pela Fórmula [XIII] em um solvente adequado na presença de uma base adequada.

Como a reação de redução, por exemplo, um método de redução catalítica que emprega o uso de gás de hidrogênio e um catalisador adequado pode ser mencionado. Este método de redução catalítica pode ser realizado em uma atmosfera de hidrogênio sob quaisquer condições de pressão normal e aplicando pressão.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 0,001 a 0,5 equivalente do catalisador e 0,1 a 5,0 equivalente da base são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XIII]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XIII].

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 100°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 0,5 e 72 horas.

O solvente para uso no presente processo pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da presente reação. Exemplos deste podem incluir hidrocarbonetos aromáticos tais como tolueno e xileno; hidrocarbonetos alifáticos halogenados tais como diclorometano e clorofórmio; ésteres de ácido acético tais como acetato de

metila, acetato de etila e acetato de butila; solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, N-metilpirrolidona, tetrametil uréia e triamida hexametilfosfórica; solventes tipo éter tais como dietiléter, tetraidrofurano e dioxano; hidrocarbonetos alifáticos tais como pentano e n-hexano; álcoois graxos tais como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, 1-butanol, sec-butanol e terc-butanol; água; e similares. São preferidos os álcoois graxos tais como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol, sec-butanol e terc-butanol e água.

Como o catalisador que pode ser utilizado no presente processo, platina, níquel Raney, preto platina, paládio-carbono, complexo de rutênio, ou similar podem ser exemplificados.

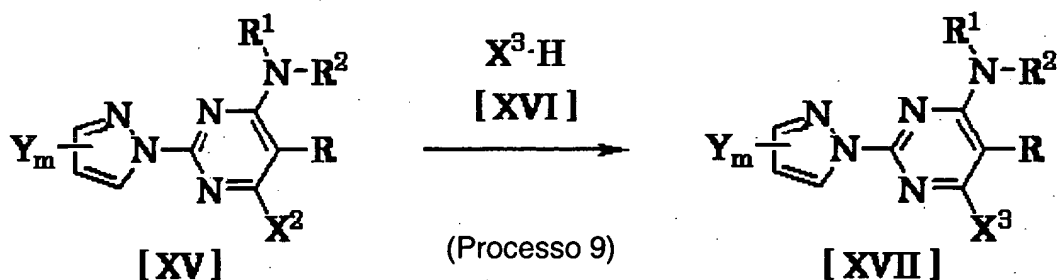
Exemplos da base que pode ser utilizada no presente processo podem incluir bases orgânicas tais como piridina, trietilamina, tributilamina e 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno; bases inorgânicas tais como hidróxido de metal de álcali, por exemplo, hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio, hidróxido de metal alcalino terroso, por exemplo, hidróxido de cálcio ou hidróxido de magnésio, carbonatos de metal de álcali, por exemplo, carbonato de sódio ou carbonato de potássio, acetatos de metal de álcali, por exemplo, acetato de sódio ou acetato de potássio e bicarbonatos de metal de álcali, por exemplo, bicarbonato de sódio ou bicarbonato de potássio; e sais de metal de álcool tais como metóxido de sódio, etóxido de sódio e terc-butoxido de potássio.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XIV] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

<Método de Produção 3>

(Processo 9)

[Fórmula Química 11]



(em que R, R₁, R₂, Y e m têm os mesmos significados como definido acima; X₂ é um átomo de halogênio, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo benzenossulfonila opcionalmente substituído, ou um grupo benzilsulfonila opcionalmente substituído; e X₃ é um grupo C₁₋₆ alcóxi, um grupo C₁₋₃ haloalcóxi, um grupo C₂₋₆ alquíníloxi, um grupo C₂₋₆ alquéníloxi, um grupo C₃₋₈ cicloalquilóxi, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C₁₋₃ alquilóxi, um grupo C₁₋₆ alquiltio, um grupo feniltio opcionalmente substituído, um grupo benziltio opcionalmente substituído, um grupo amino, um grupo hidroxila, um grupo benzilóxi opcionalmente substituído, um grupo mono C₁₋₆ alquilamino, ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)amino).

O composto representado pela Fórmula [XVII] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XV] reagir com o composto representado pela Fórmula [XVI] em um solvente adequado na presença de uma base adequada. Além disso, um catalisador adequado pode ser adicionado para a produção. Entre os compostos representados pela Fórmula [XV], compostos em que X₂ é diferente de halogênio podem ser produzidos de acordo com Processos 13, 14 e 15 de Método de Produção 6 mostrados abaixo.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de -30°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 3 equivalentes do composto representado pela Fórmula [XVI] e 1 a 3 equivalentes da base são utilizados, com respeito a 1 equivalente do com-

posto representado pela Formula [XV]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XV].

O solvente para uso no presente processo pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da presente reação. Exemplos destes podem incluir éteres tais como 1,2-dimetoxietano e tetraidrofurano; hidrocarbonetos halogenados tais como dicloroetano, tetracloreto de carbono, clorobenzeno e diclorobenzeno; amidas tais como N,N-dimetilacetoamida, N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona e N-metil-2-pirrolidinona; compostos de enxofre tais como dimetilsulfóxido e sulfolano; hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno e xileno; álcoois tais como metanol, etanol, n-propanol, 2-propanol, n-butanol e 2-metil-2-propanol; nitrilas tais como acetonitrila; ácidos carboxílicos tais como ácido fórmico e ácido acético; água; e uma mistura destes.

Exemplos da base que pode ser utilizada no presente processo podem incluir bases orgânicas tais como piridina, trietilamina, tributilamina e 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno; bases inorgânicas tais como hidróxido de metal de álcali, por exemplo, hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio, hidróxido de metal alcalino terroso, por exemplo, hidróxido de cálcio ou hidróxido de magnésio, carbonatos de metal de álcali, por exemplo, carbonato de sódio ou carbonato de potássio e bicarbonatos de metal de álcali, por exemplo, bicarbonato de sódio ou bicarbonato de potássio; sais de metal de álcool tais como metóxido de sódio, etóxido de sódio e terc-butoxido de potássio; e hidretos de metal de álcali tais como hidreto de sódio.

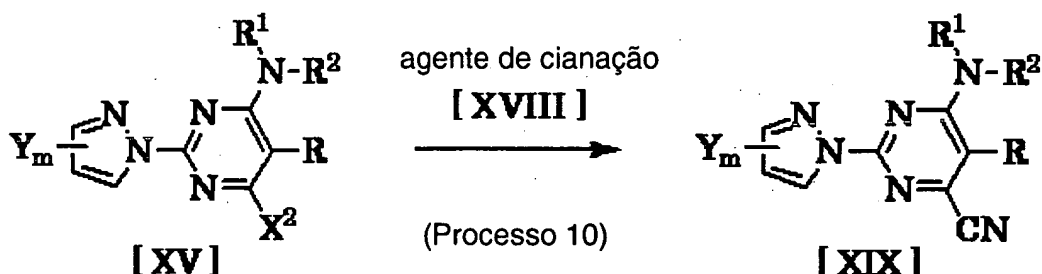
Como o catalisador que pode ser utilizado no presente processo, por exemplo, p-toluenossulfonato de sódio, metanossulfonato sódio, ou benzenossulfonato de sódio podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XVII] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

<Método de Produção 4>

(Processo 10)

[Fórmula Química 12]



(em que R, R¹, R², X², Y e m têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [XIX] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XV] reagir com agente de cianação [XVIII] em um solvente adequado.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de -30°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

Para a quantidade de agente a ser fornecido na presente reação, 1 a 3 equivalentes do composto representado pela Fórmula [XVIII] é usado com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XV]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XV].

O solvente para uso no presente processo pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da presente reação. Exemplos destes podem incluir éteres tais como 1,2-dimetoxietano e tetraidrofurano; hidrocarbonetos halogenados tais como dicloroetano, tetracloreto de carbono, clorobenzeno e diclorobenzeno; amidas tais como N,N-dimetilacetoamida, N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona e N-metil-2-pirrolidinona; compostos de enxofre tais como dimetil-

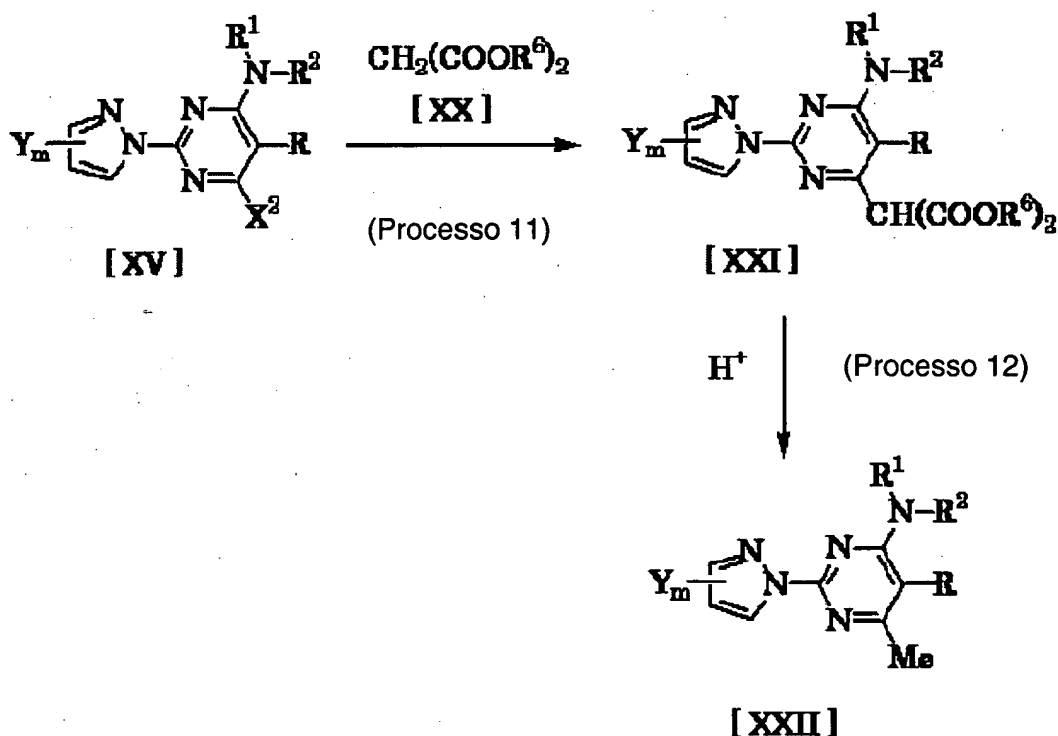
sulfóxido e sulfolano; hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno e xileno; álcoois tais como metanol, etanol, n-propanol, 2-propanol, n-butanol e 2-metil-2-propanol; nitrilas tais como acetonitrila; ácidos carboxílicos tais como ácido fórmico e ácido acético; água; e uma mistura destes.

- 5 Exemplos do agente de cianação [XVIII] que podem ser utilizados no presente processo podem incluir cianeto de sódio, cianeto de potássio, cianeto de zinco e cianeto de cobre.

- 10 Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XIX] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

<Método de Produção 5>

[Fórmula Química 13]



- 15 (em que R, R₁, R₂, X₂, Y e m têm os mesmos significados como definido acima e R⁶ é um grupo C₁₋₆ alquila).

(Processo 11)

O composto representado pela Fórmula [XXI] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XV] reagir com o

composto representado pela Fórmula [XX] em um solvente adequado na presença de uma base adequada.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de -30°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferi-
5 velmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente rea-
10 ção, 1 a 3 equivalentes do composto representado pela Fórmula [XX] e 1 a 3 equivalentes da base são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XV]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 25 a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XV].

15 O solvente para uso no presente processo pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da presente reação. Exemplos destes podem incluir éteres tais como 1,2-dimetoxietano e tetraidrofurano; hidrocarbonetos halogenados tais como di-
20 cloroetano, tetracloreto de carbono, clorobenzeno e diclorobenzeno; amidas tais como N,N-dimetilacetoamida, N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona e N-metil-2-pirrolidinona; compostos de enxofre tais como dimetil-sulfóxido e sulfolano; hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno e xileno; álcoois tais como metanol, etanol, n-propanol, 2-propanol, n-butanol e 2-metil-2-propanol; nitrilas tais como acetonitrila; ácidos carboxíli-
25 cos tais como ácido fórmico e ácido acético; água; e uma mistura destes.

Exemplos da base que pode ser utilizada no presente processo podem incluir bases orgânicas tais como piridina, trietilamina, tributilamina e 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno; bases inorgânicas tais como hidróxido de metal de álcali, por exemplo, hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio,
30 hidróxido de metal alcalino terroso, por exemplo, hidróxido de cálcio ou hidróxido de magnésio, carbonatos de metal de álcali, por exemplo, carbonato de sódio ou carbonato de potássio e bicarbonatos de metal de álcali, por e-

xemplo, bicarbonato de sódio ou bicarbonato de potássio; sais de metal de álcool tais como metóxido de sódio, etóxido de sódio e terc-butóxido de potássio; e hidretos de metal de álcali tais como hidreto de sódio.

- 5 Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXI] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

(Processo 12)

- 10 O composto representado pela Fórmula [XXII] pode ser produzido aplicando-se o composto representado pela Fórmula [XXI] a uma reação de descarboxilação em um solvente adequado ou na ausência de um solvente, na presença de um ácido adequado.

- 15 A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

- 20 Para a quantidade de agente a ser fornecido na presente reação, 0,1 a 10 equivalentes de ácido é usado com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XXI]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XXI].

- 25 O solvente para uso no presente processo pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da presente reação. Exemplos deste podem incluir hidrocarbonetos alifáticos tais como pentano, hexano, ciclohexano e éter de petróleo; hidrocarbonetos aromáticos tais como tolueno e xileno; hidrocarbonetos halogenados tais como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno; éteres tais como dietiléter, diisopropiléter, terc-butilmetiléter, dioxano, anisol e tetraidrofurano; nitrilas tais como acetonitrila e propionitrila; cetonas tais como acetona, metile-
- 30

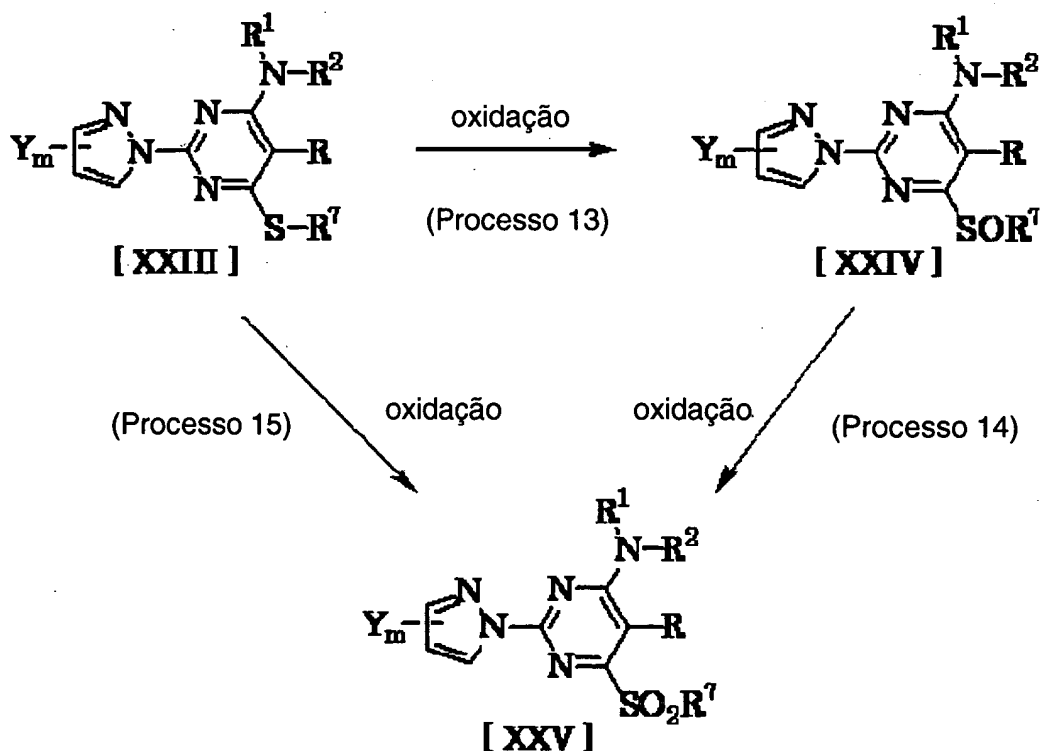
til cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona; álcoois tais como metanol, etanol, 1-propanol, 2-propanol, 1-butanol e terc-butanol; amidas tais como N,N-dimetilacetoamida, N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona e N-metil-2-pirrolidinona; compostos de enxofre tais como dimetilsulfóxido e sulfolano; ácidos carboxílicos tais como ácido fórmico e ácido acético; água; e uma mistura destes.

Exemplos do ácido que pode ser utilizado no presente processo podem incluir ácido clorídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido metanossulfônico, ácido benzenossulfônico e ácido p-toluenessulfônico.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXII] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

<Método de Produção 6>

[Fórmula Química 14]



(em que R, R¹, R², Y e m têm os mesmos significados como definido acima e R⁷ é um grupo C₁₋₆ alquila, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo fenila opcionalmente substituído, ou um grupo benzila opcionalmente substituído).

5 (Processo 13)

 O composto representado pela Fórmula [XXIV] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XXIII] reagir com um agente de oxidação em um solvente adequado. Além disso, um catalisador adequado pode ser adicionado para a produção. Aqui, o composto representado pela Fórmula [XXIII] pode ser produzido permitindo um composto em que X² em Fórmula [XV] é um átomo de halogênio, reagir com um composto de tiol R⁷-SH, de acordo com o Processo 9 de Método de Produção 3.

 A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 10 a 100°C.

 O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 0,5 e 48 horas.

 Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 0,5 a 5 equivalentes do agente de oxidação e 0,01 a 0,5 equivalente do catalisador são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XXIII]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XXIII].

 Como o solvente, o agente de oxidação, a base e o catalisador, para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 6 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

 Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXIV] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

(Processo 14)

O composto representado pela Fórmula [XXV] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XXIV] reagir com um agente de oxidação em um solvente adequado. Além disso, um catalisador adequado pode ser adicionado para a produção.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 10 a 100°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 0,5 e 48 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 0,5 a 5 equivalentes do agente de oxidação e 0,01 a 0,5 equivalente do catalisador são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XXIV]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XXIV].

Como o solvente, o agente de oxidação, a base e o catalisador, para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 6 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXV] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

(Processo 15)

O composto representado pela Fórmula [XXV] pode ser produzido sem obter o composto representado pela Fórmula [XXIV] permitindo o composto representado pela Fórmula [XXIII] reagir com um agente de oxidação em um solvente adequado. Além disso, um catalisador adequado pode ser adicionado para a produção.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na

faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 10 a 100°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou
5 similares, porém é entre 0,5 e 48 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 0,5 a 5 equivalentes do agente de oxidação e 0,01 a 0,5 equivalente do catalisador são utilizados, com respeito ao peso de 1 equivalente do composto representado pela Fórmula 5 [XXIII]. Além disso, a quantidade de sol-
10 vante a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XXIII].

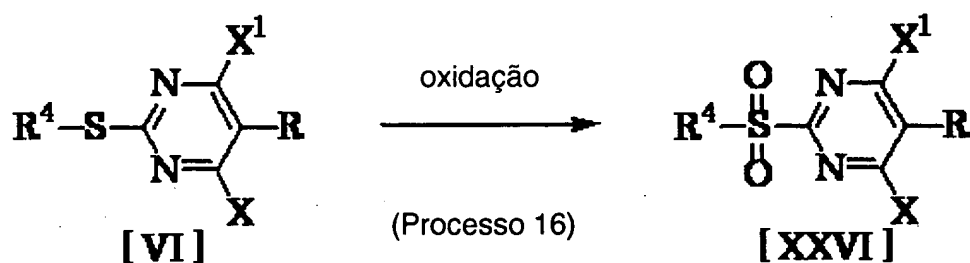
Como o solvente, o agente de oxidação, a base e o catalisador, para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 6 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

15 Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXV] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

20 <Método de Produção 7>

(Processo 16)

[Fórmula Química 15]



(em que R, R₄, X e X₁ têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [XXVI] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [VI] reagir com um
25 agente de oxidação em um solvente adequado. Além disso, um catalisador adequado pode ser adicionado para a produção.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de -100°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de -10 a 100°C .

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 0,5 e 48 horas.

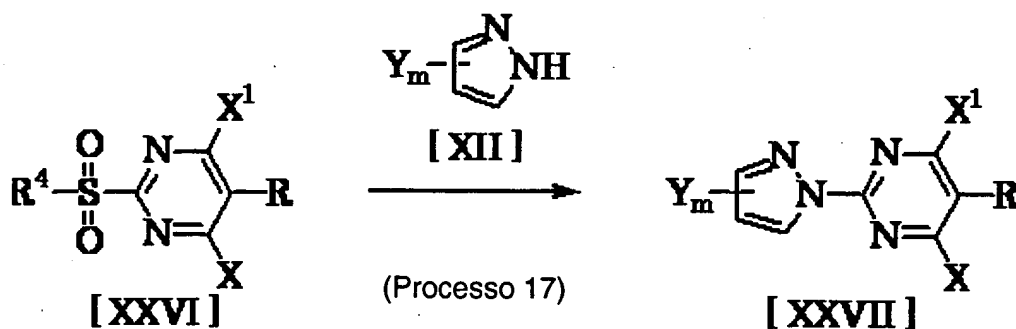
Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 0,5 a 5 equivalentes do agente de oxidação e 0,01 a 0,5 equivalente do catalisador são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [VI]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0,01 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [VI].

Como o solvente, o agente de oxidação, a base e o catalisador, para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 6 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXVI] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

(Processo 17)

[Fórmula Química 16]



(em que R, R_4 , X, X^1 , Y e m têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [XXVII] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XXVI] reagir com o

composto representado pela Fórmula [XII] em um solvente adequado, na presença de uma base adequada.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de -100°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferi-
5 velmente de -78 a 50°C .

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 0,5 e 48 horas.

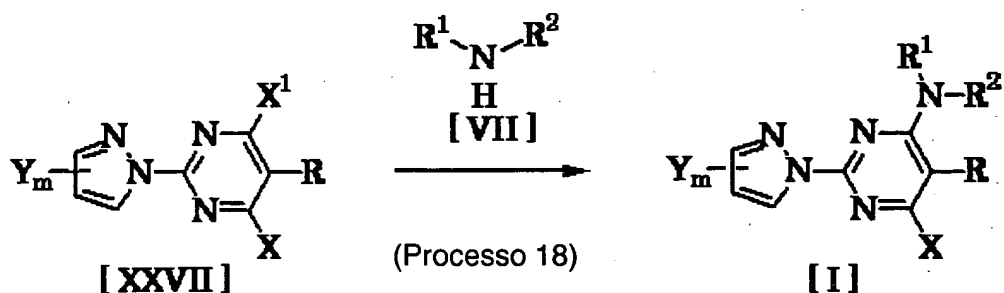
Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente rea-
10 ção, 1 a 3 equivalentes do composto representado pela Fórmula [XII] e 1 a 3 equivalentes da base são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Formula [XXVI]. Além disso, a quantidade de sol-
vente a ser usada é de 0,01 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com res-
peito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XXVI].

15 Como o solvente e a base para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 4 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fór-
mula [XXVII] que é um produto desejado da presente reação pode ser cole-
20 tado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, puri-
ficado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristali-
zação.

(Processo 18)

[Fórmula Química 17]



25 (em que R, R1, R2, X, X1, Y e m têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [I] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XXVII] reagir com o composto representado pela Fórmula [VII] em um solvente adequado ou na ausência de um solvente, na presença de uma base adequada ou ausência de uma base. Além disso, um catalisador adequado pode ser adicionado para a produção.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 3, preferivelmente 1 a 1,5 equivalentes do composto representado pela Fórmula [VII]; 0 a 3, preferivelmente 1 a 1,5 equivalentes da base; e 0,001 a 0,5 equivalente do catalisador são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XXVII]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XXVII].

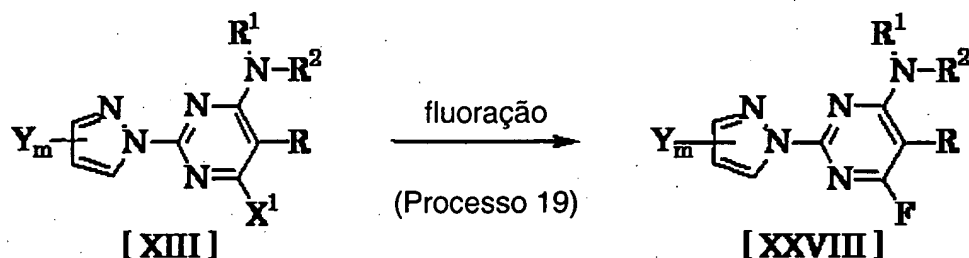
Como o solvente, a base e o catalisador para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 4 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [I] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

<Método de Produção 8>

(Processo 19)

[Fórmula Química 18]



(em que R, R₁, R₂, X₁, Y e m têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [XXVIII] pode ser produzido por fluoracão do composto representado pela Fórmula [XIII] com um agente de fluoracão em um solvente adequado ou na ausência de um solvente.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

Para a quantidade de agente a ser fornecido na presente reação, 1 a 20, preferivelmente 1 a 5 equivalentes do agente de fluoracão são utilizados com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XIII]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XIII].

Como o solvente que pode ser utilizado no presente processo, o mesmo solvente mencionado no Processo 4 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

Como o agente de fluoracão que pode ser utilizado no presente processo, fluoreto de potássio, fluoreto de sódio, fluoreto de cézio, ou uma mistura destes podem ser exemplificados.

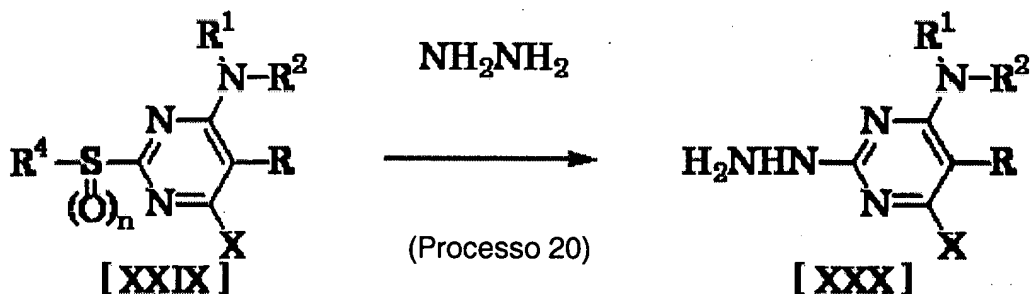
Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXVIII] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, puri-

ficado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

<Método de Produção 9>

(Processo 20)

5 [Fórmula Química 19]



(em que R, R¹, R², R⁴ e X têm os mesmos significados como definido acima e n é um número inteiro de 0 a 2).

O composto representado pela Fórmula [XXX] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XXIX] reagir com hidrazina em um solvente adequado ou na ausência de um solvente, na presença ou ausência de uma base.

10

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

15

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 20, preferivelmente 1 a 5 equivalentes de hidrazina; e 0 a 3, preferivelmente 0 a 1,5 equivalentes da base são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XXIX]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XXIX].

20

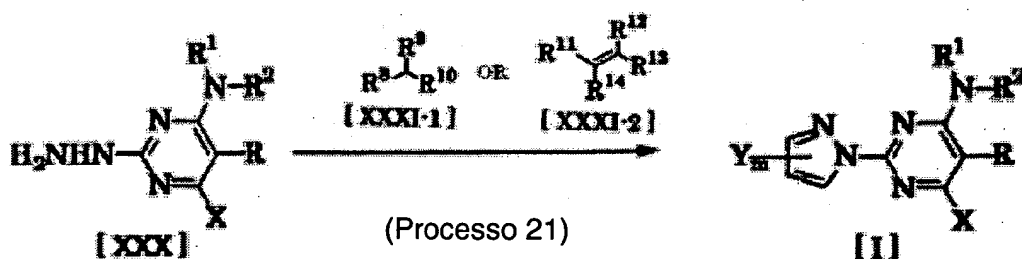
Como o solvente e a base para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 4 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

25

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXX] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

(Processo 21)

[Fórmula Química 20]



(em que R, R¹, R², X, Y e m têm os mesmos significados como definido acima; R⁸, R⁹, R¹² e R¹³ são cada qual independentemente um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo C₁₋₆ alquiltio, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₃₋₈ cicloalquilcarbonila, um grupo carboxila, um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila ou um grupo carbamoila; R¹⁰ é um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo C₁₋₆ alquila, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₁₋₆ alcóxi, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo amino, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo hidroxila ou um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila; e R¹¹ e R¹⁴ são cada qual independentemente um átomo de hidrogênio, um grupo C₁₋₆ alquiltio, um grupo di(C₁₋₆ alquil)amino ou um grupo C₁₋₆ alcóxi).

O composto representado pela Fórmula [I] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XXX] reagir com o composto representado pela Fórmula [XXXI-1] ou [XXXI-2] em um solvente adequado ou na ausência de um solvente, na presença ou ausência de ácido ou base.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com

uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade de reação, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 10, preferivelmente 1 a 3 equivalentes do composto representado pela Fórmula [XXXI-1] ou [XXXI-2]; e 0 a 5, preferivelmente 0 a 3 equivalentes de ácido ou base são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XXX]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XXX].

Como o solvente e a base para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 1 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

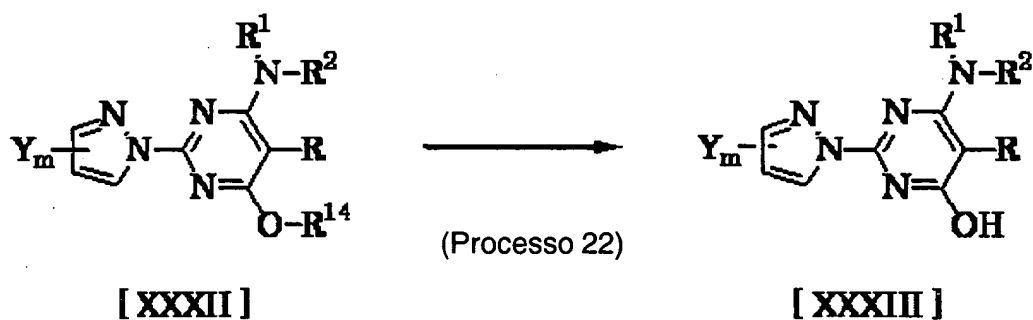
Exemplos do ácido para uso no presente processo podem incluir ácidos minerais tais como ácido clorídrico, ácido hidrobromico e ácido sulfúrico; ácidos orgânicos tais como ácido fórmico, ácido acético, ácido metanossulfônico e ácido p-toluenossulfônico; e similares.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [I] que é um produto desejado da presente reação, pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

<Método de Produção 10>

(Processo 22)

[Fórmula Química 21].



(em que R, R¹, R², Y e m têm os mesmos significados como definido acima e R¹⁴ é um grupo C₁₋₆ alquila, um grupo C₁₋₆ acila ou um grupo benzila opcio-

nalmente substituído).

O composto representado pela Fórmula [XXXIII] pode ser produzido por aplicação do composto representado pela Fórmula [XXXII] a uma hidrólise com ácido ou base, ou uma hidrogenólise por um método de redução catalítica que emprega o uso de gás de hidrogênio e um catalisador adequado, em um solvente adequado ou na ausência de um solvente. O composto representado pela Fórmula [XXXII] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XV] reagir com um composto de álcool R^{14} -OH ou um composto carboxílico R^{14} -C(=O)OH, de acordo com o método descrito no Processo 9 de Método de Produção 3.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

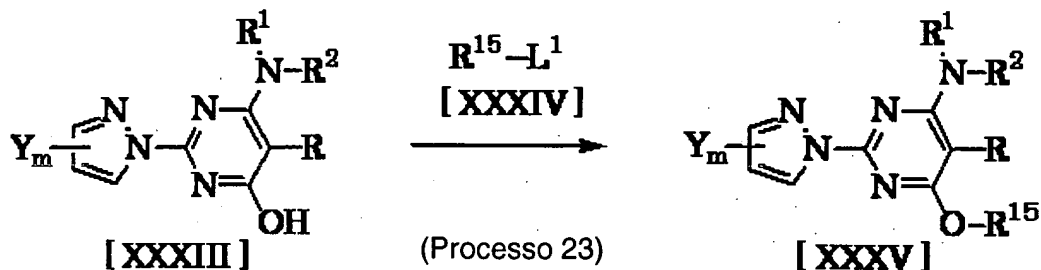
Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 10, preferivelmente 1 a 3 equivalentes de ácido ou base; e 0,001 a 1, preferivelmente 0,01 a 0,5 equivalentes do catalisador são utilizados, com respeito ao peso de 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XXXII]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XXXII].

Como o solvente, o ácido e a base para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 5 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados. Como o catalisador, aquele mesmo mencionado no Processo 8 de Método de Produção 2 pode ser exemplificado.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXXIII] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

(Processo 23)

[Fórmula Química 22]



(em que R, R¹, R², Y e m têm os mesmos significados como definido acima; e R¹⁵ é um grupo C₁₋₁₀ alquila, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C₁₋₃ alquila, um grupo benzila opcionalmente substituído, um grupo C₂₋₆ alquenila ou um grupo C₂₋₆ alquinila, contanto que quando R¹⁵ for um grupo C₁₋₆ haloalquila, L¹ seja um grupo de saída tendo uma reatividade maior do que aquela de um átomo de halogênio remanescente após a haloalquilação.

Por exemplo, quando R¹⁵ é um grupo CHF², L¹ é um átomo de cloro ou um átomo de bromo e quando R¹⁵ é um grupo CH²CF³, L¹ é um átomo de cloro, um átomo de bromo, um átomo de iodo, um grupo p-toluenossulfonilóxi, um grupo metilsulfonilóxi, um grupo trifluorometilsulfonilóxi, ou similares).

O composto representado pela Fórmula [XXXV] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XXXIII] reagir com o composto representado pela Fórmula [XXXIV] em um solvente adequado ou na ausência de um solvente, na presença ou ausência de uma base.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 5, preferivelmente 1 a 2 equivalentes do composto representado

pela Fórmula [XXXIV]; e 0 a 3, preferivelmente 1 a 1,5 equivalentes da base são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XXXIII]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto re-

5 apresentado pela Fórmula [XXXIII].

Como o solvente e a base para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 4 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

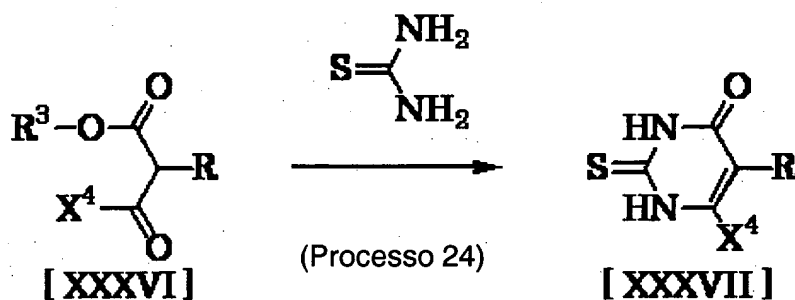
Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXXV] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

10

<Método de Produção Intermediário 1>

15 (Processo 24)

[Fórmula Química 23]



(em que R e R₃ têm os mesmos significados como definido acima e X₄ é um átomo de hidrogênio, um grupo C₁₋₁₀ alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila ou um grupo C₁₋₆ haloalquila).

20 O composto representado pela Fórmula [XXXVII] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XXXVI] com tiourea em um solvente adequado, na presença de uma base adequada.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivel-

25 mente de 10 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com

uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 0,5 e 120 horas.

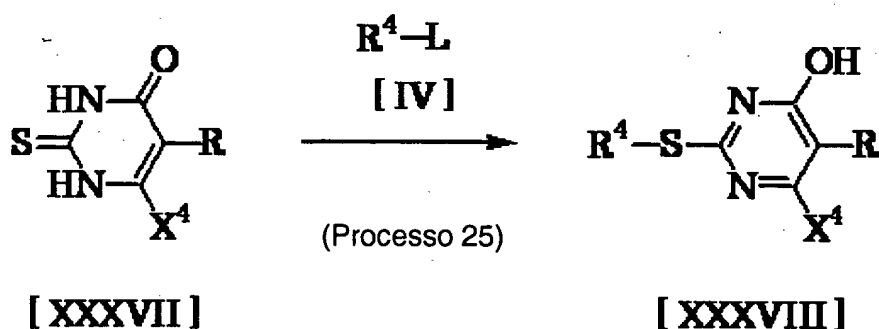
Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 2 equivalentes da tiouréia e 1 a 5 equivalentes da base são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XXXVI]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usado é de 0,1 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XXXVI].

Como o solvente e a base para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 1 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXXVII] que é um produto desejado da presente reação pode ser utilizado no processo subsequente sem ser isolado e purificado, porém pode ser também coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

(Processo 25)

[Fórmula Química 24]



(em que R, R₄, L e X₄ têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [XXXVIII] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XXXVII] reagir com o composto representado pela Fórmula [IV] em um solvente adequado, na presença de uma base adequada.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivel-

mente de 10 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 72 horas.

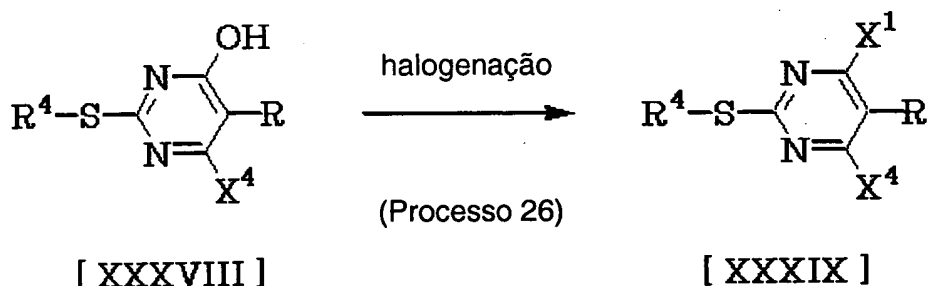
5 Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 3 equivalentes do composto representado pela Fórmula [IV] e 1 a 3 equivalentes da base são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XXXVII]. Além disso, a quantidade de sol-
10 vante a ser usada é de 0,1 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com res-
peito a 1 mol do composto representado pela Fórmula 5 [XXXVII].

Como o solvente e a base para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 1 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

15 Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXXVIII] que é um produto desejado da presente reação pode ser co-
letado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recris-
talização.

(Processo 26)

20 [Fórmula Química 25]



(em que R, R₄, X₁ e X₄ têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [XXXIX] pode ser pro-
duzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XXXVIII] reagir
com um agente de halogenação em um solvente adequado ou na ausência
25 de um solvente. Além disso, um catalisador adequado pode ser adicionado
para a produção.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 72 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 5 equivalentes do agente de halogenação e 0 a 1,0 equivalente do catalisador são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XXXVIII]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XXXVIII].

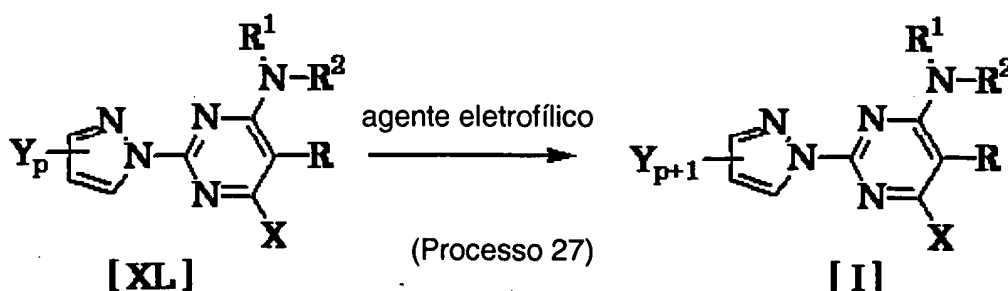
Como o solvente, o agente de halogenação e o catalisador para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 3 de Método de Produção 1 podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XXXIX] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

<Método de Produção 11>

(Processo 27)

[Fórmula Química 26]



(em que R, R¹, R², X e Y têm os mesmos significados como definido acima; e p é 0, 1, ou 2, enquanto que quando p é 1 ou mais, Y_{p+1} pode ser igual a ou diferente um do outro).

O composto representado pela Fórmula [I] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XL] reagir com um agente eletrofílico em um solvente adequado ou na ausência de um solvente.

5 A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

10 Para a quantidade de agente a ser fornecido na presente reação, 1 a 10, preferivelmente 1 a 3 equivalentes do agente eletrofílico são usados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XL]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XL].

15 Como o solvente para uso no presente processo, aquele mesmo mencionado no Processo 4 de Método de Produção 1 pode ser exemplificado.

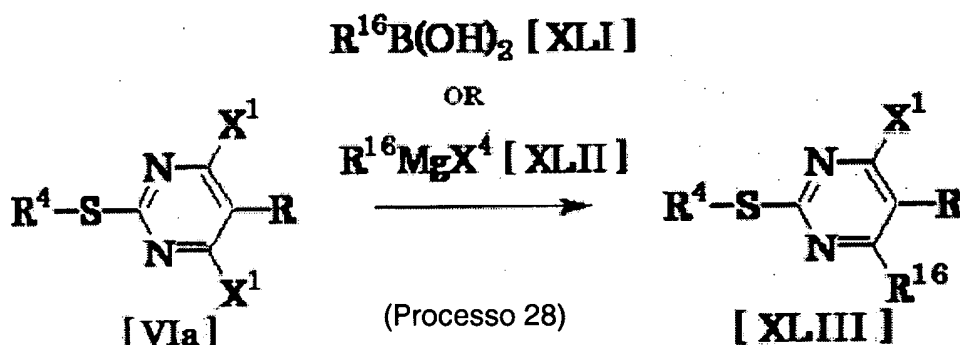
Exemplos do agente eletrofílico que pode ser utilizado no presente processo podem incluir um agente de halogenação tal como cloro, bromo, N-bromossuccinimida, N-clorossuccinimida, MEC-03 ou MEC-31 (nome comercial por Daikin Ltd.), Selectfluor (nome comercial por Air Products Inc.), F-PLUS-B800, B500, ou B300 (nome comercial por Tosoh F-TECH, Inc.) ou cloreto de sulfurila; um agente de nitração tal como ácido nítrico, ácido nítrico fumegante ou nitrato de acetila; um agente de clorossulfonilação tal como ácido clorossulfúrico; um agente de tiocianação empregando tiocianato de sódio ou tiocianato de potássio e cloro, bromo, N-bromossuccinimida, N-clorossuccinimida ou cloreto de sulfurila; e similares.

20 Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [I] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

<Método de Produção Intermediário 2>

(Processo 28)

[Fórmula Química 27]



(em que R, R⁴ e X¹ têm os mesmos significados como definido acima; R¹⁶ é um grupo C₁₋₁₀ alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C₁₋₃ alquila, um grupo C₂₋₆ alquinila ou um grupo C₂₋₆ alquenila; e X⁴ é um átomo de halogênio).

O composto representado pela Fórmula [XLIII] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [VIa] reagir com o composto representado pela Fórmula [XLI] ou Formula [XLII] em um solvente adequado ou na ausência de um solvente, na presença ou ausência de uma base e um catalisador.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 3 equivalentes do composto representado pela Fórmula [XLI] ou Formula [XLII]; 0 a 3 equivalentes da base; e 0 a 0,5 equivalente do catalisador são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [VIa]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [VIa].

O solvente a ser fornecido para a presente reação pode ser qualquer solvente, contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da presente reação. Exemplos deste podem incluir hidrocarbonetos alifáticos tais como pentano, hexano, ciclohexano e éter de petróleo; hidrocarbonetos aromáticos tais como tolueno e xileno; éteres tais como dietiléter, diisopropiléter, terc-butilmetiléter, dioxano, 1,2-dimetoxietano e tetraidrofurano; álcoois tais como metanol, etanol, 1-propanol, 2-propanol, 1-butanol e terc-butanol; água; e uma mistura destes.

Exemplos da base a ser fornecida para a presente reação podem incluir bases orgânicas tais como piridina, trietilamina, tributilamina e 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno; e bases inorgânicas tais como hidróxido de metal de álcali, por exemplo, hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio, hidróxido de metal alcalino terroso, por exemplo, hidróxido de cálcio ou hidróxido de magnésio, carbonatos de metal de álcali, por exemplo, carbonato de sódio ou carbonato de potássio e bicarbonatos de metal de álcali, por exemplo, bicarbonato de sódio ou bicarbonato de potássio.

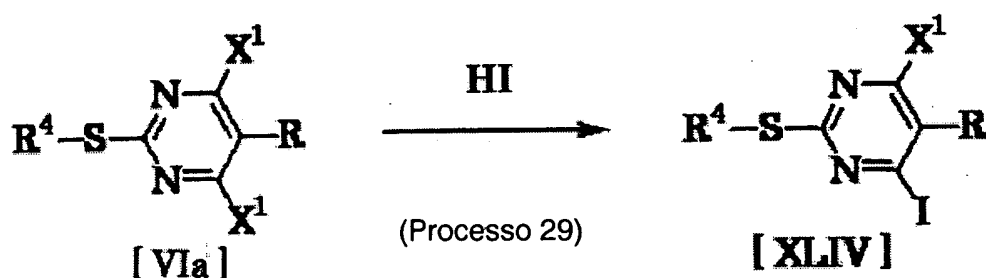
Como o catalisador a ser fornecido na presente reação, um catalisador de paládio tal como acetato de paládio, tetrakis(trifenilfosfina)paládio, ou dicloreto de (difenilfosfinoferrocene)paládio podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XLIII] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

25 < Método de Produção Intermediário 3 >

(Processo 29)

[Fórmula Química 28]



(em que R, R⁴ e X¹ têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [XLIV] pode ser produzido por iodização do composto representado pela Fórmula [VIa] utilizando ácido hidriódico.

- 5 A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

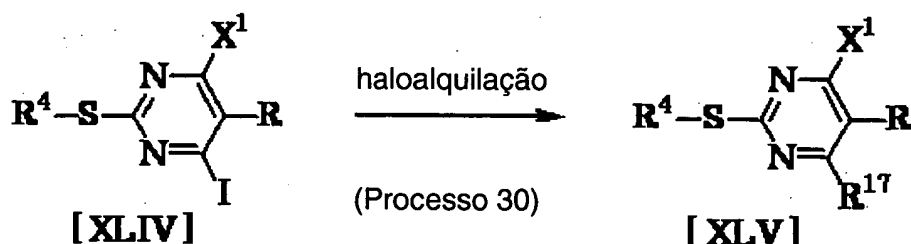
O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou
10 similares, porém é entre 1 e 120 horas.

Para a quantidade de agente a ser fornecido na presente reação, 1 a 20, preferivelmente 1 a 5 equivalentes do ácido hidriódico são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [VIa].

- 15 Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XLIV] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

20 (Processo 30)

[Fórmula Química 29]



(em que R, R⁴ e X¹ têm os mesmos significados como definido acima e R¹⁷ é um grupo C₁₋₆ haloalquila).

- 25 O composto representado pela Fórmula [XLV] pode ser produzido por haloalquilação do composto representado pela Fórmula [XLIV] utilizando um agente de haloalquilação em um solvente adequado ou na ausência de um solvente, na presença ou ausência de uma base e um catalisador,

de acordo com um método descrito em *Synthesis*, Vol. 5, 798-803 (2005).

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 180°C.

- 5 O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

- Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 3 equivalentes do agente de haloalquilação; 0 a 3 equivalentes da base; e 0 a 0,5 equivalente do catalisador são utilizados, com respeito a 10 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XLIV]. Além disso, a quantidade de solvente a ser utilizada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XLIV].

- Exemplos agente de haloalquilação a ser fornecido na presente 15 reação podem incluir clorodifluoroacetato de sódio, trifluoroacetato de sódio, iodeto de trifluorometila, iodeto de 1,1,2,2,2-pentafluoroetila, iodeto de 1,1,2,2,3,3,4,4,4-nonafluorobutia, trifluorometiltrimetilsilano, trifluorometiltrietilsilano e similares.

- Exemplos da base a ser fornecida na presente reação podem 20 incluir fluoreto de potássio, fluoreto de sódio, fluoreto de cézio e similares.

Exemplos do catalisador a ser fornecido na presente reação podem incluir pó de cobre, iodeto de cobre e similares.

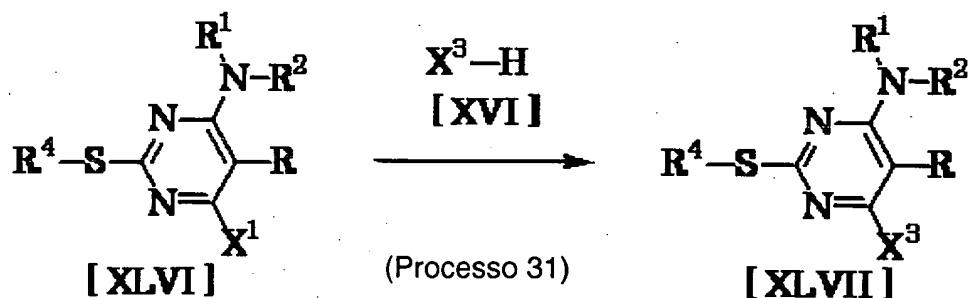
- O solvente a ser fornecido na presente reação pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte não inibindo o processo da 25 presente reação. Exemplos deste podem incluir amidas tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetoamida, N-metilpirrolidinona e 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; dimetilsulfóxido; piridina; e similares.

- Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XLV] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização. 30

<Método de Produção Intermediário 4>

(Processo 31)

[Fórmula Química 30]



(em que R, R¹, R², R⁴, X¹ e X³ têm os mesmos significados como definido acima).

O composto representado pela Fórmula [XLVII] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XLVI] reagir com o composto representado pela Fórmula [XVI] em um solvente adequado, na presença de uma base adequada. Além disso, um catalisador adequado pode ser adicionado para a produção.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de -30°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 3 equivalentes do composto representado pela Fórmula [XVI]; 1 a 3 equivalentes da base; e 0 a 0,5 equivalente do catalisador são utilizados, com respeito a 1 equivalente do composto representado pela Fórmula [XLVI]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0,1 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XLVI].

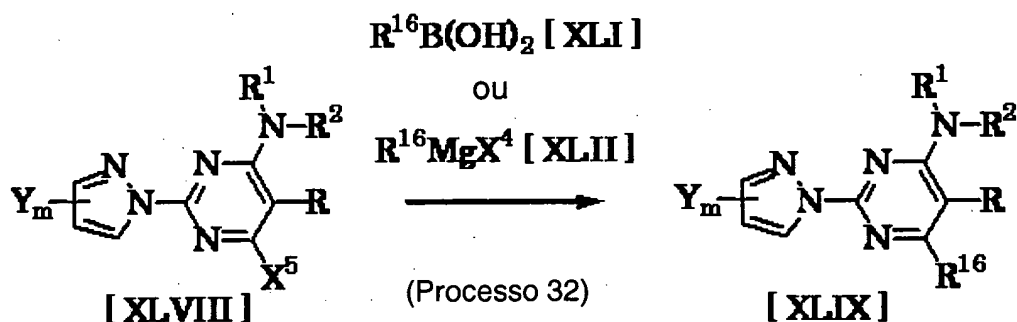
Como o solvente, a base e o catalisador, para uso no presente processo, aqueles mesmos mencionados no Processo 9 de Método de Produção 3 podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XLVII] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

<Método de Produção 12>

(Processo 32)

[Fórmula Química 31]



(em que R, R¹, R², R¹⁶, Y, m e X⁴ têm os mesmos significados como definido acima e X⁵ é um átomo de halogênio, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonilóxi ou um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonilóxi).

O composto representado pela Fórmula [XLIX] pode ser produzido permitindo o composto representado pela Fórmula [XLVIII] reagir com o composto representado pela Fórmula [XLI] ou [XLII] em um solvente adequado ou na ausência de um solvente, na presença ou ausência de uma base e um catalisador.

A temperatura reacional da presente reação é arbitrariamente na faixa de 0°C até a temperatura de refluxo no sistema de reação, preferivelmente de 0 a 150°C.

O tempo de reação da presente reação varia de acordo com uma temperatura de reação, um reagente, uma quantidade reacional, ou similares, porém é entre 1 e 120 horas.

Para a quantidade de agentes a ser fornecidos na presente reação, 1 a 3 equivalentes do composto representado pela Fórmula [XLI] ou [XLII]; 0 a 3 equivalentes da base; e 0 a 0,5 do peso do equivalente do catalisador é utilizado, com respeito a 1 equivalente do composto representado

pela Fórmula [XLVIII]. Além disso, a quantidade de solvente a ser usada é de 0 a 50 L, preferivelmente de 0,1 a 3,0 L, com respeito a 1 mol do composto representado pela Fórmula [XLVIII].

Como o solvente, a base e o catalisador a ser fornecidos na presente reação, aqueles mesmos mencionados no Processo 28 de Método de Produção 13 podem ser exemplificados.

Após conclusão da reação, o composto representado pela Fórmula [XLIX] que é um produto desejado da presente reação pode ser coletado do sistema de reação por um método usual e, como o caso requer, purificado por uma manipulação tal como cromatografia de coluna ou recristalização.

O agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural de acordo com a presente invenção é formado contendo o derivado de aminopirimidina representado pela Fórmula [I] ou um sal agricolamente aceitável deste como o ingrediente ativo.

No caso de utilizar o composto do presente pedido como um agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural, ele pode ser usado individualmente ou alternativamente como o ingrediente ativo de uma forma adequada de acordo com este propósito

Em geral, um ingrediente ativo é diluído com um veículo líquido ou sólido inerte e um tensoativo e quaisquer outros são adicionados também quando necessário, de modo a formar-se em uma formulação de pó, pó umectável, emulsão, grânulos, ou similares para um uso. Uma relação do ingrediente ativo a ser misturado pode ser adequadamente selecionada, dependendo da situação, porém é apropriado que seja na faixa de 0,1 a 50% (por peso) no caso de pó e grânulo, ou de 5 a 80% (por peso) no caso de emulsão e pó umectável.

Exemplos do veículo a ser utilizado na formulação podem incluir veículos sólidos tais como talco, bentonita, zeólito, argila, caulim, diatomito, argila ácida, argila branca, carbono branco, vermiculita, pearlita, púmice, carbonato de cálcio, cal extinta, areia de sílica, sulfato de amônio, uréia e pó de madeira; veículos líquidos tais como n-parafina, isoparafina, naftaleno,

álcool isopropílico, cicloexanol, etileno glicol, dietileno glicol, propileno glicol, polietileno glicol, polipropileno glicol, xileno, alquilbenzeno, cicloexano, alquil-naftaleno, éster metílico de ácido graxo, N-alquilpirrolidona, isoforona, óleo de coco, óleo de soja e água; e similares.

- 5 Exemplos do tensoativo e dispersão podem incluir éster de ácido graxo de sorbitan, alquilbenzenossulfonato de metal, dissulfonato de dinaf-tilmetano de metal, éster de sulfato de álcool, sulfonato de alquil arila, sulfo-nato de lignina, dialquilsulfossuccinato, polioxietilenoglicoléter, éter de polio-xietileno alquilarila, um polímero de polioxietilenoalquilarila, sulfonato de éter
10 de alquilarila de polioxietileno, monoalquilato de sorbitan de polioxietileno, um sal de condensado de β -naftalenossulfonato-formalina, feniletersulfato estirenado de polioxietileno e similares.

- Exemplos do agente auxiliar podem incluir carboximetil celulose, amido alfanizado, dextrina modificada, polietileno glicol, goma xantana, go-
15 ma arábica, silicone e similares.

- Além disso, o agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural de acordo com a invenção pode ser misturado com ou utilizado em combinação com outros compostos ativos conhecidos tais como inseticida, miticida, regulador de crescimento de inseto, nematocida,
20 fungicida, agente de controle de doença de planta, herbicida, regulador de crescimento de planta, fertilizante e condicionador de terra, se necessário, em adição ao composto do presente pedido que é um ingrediente ativo para várias formulações descritas acima.

- Compostos fungicidas conhecidos que podem ser misturados ou
25 usados em combinação, serão exemplificados por: benomila, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato, tiofanato-metila, clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciprocona-zol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenarimol, fenbuconazol, flu-quinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalil, imibenconazol, ipco-
30 nazol, metconazol, miclobutanil, nuarimol, fumarato e oxpoconazol, paclobu-trazol, pefurazoato, penconazol, prochloraz, propiconazol, protioconazol, piri-fenox, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, tri-

flumizol, triforina, triticonazol, benalaxil, furalaxil, mefenoxam, metalaxil, metalaxyl-M, ofurace, oxadixil, aldimorf,

dodemorf, fenpropidina, fenpropimorf, piperalina, espiroxamina, tridemorf, edifenfos, iprobenfos, isoprotiolano, pirazofos, benodanil, boscalid,
 5 carboxina, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronila, oxicarboxina, pentiopi-
 rad, tifulzamida,

bupirimato, dimetirimol, etirimol, ciprodinila, mepanipirim, pirime-
 tanil, dietofencarb, azoxistrobina, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona,
 fenamidona, fluoxastrobina, cresoxim-metila, metominostrobin, orisastrobi-
 10 na, picoxistrobina, piraclostrobina, trifloxistrobina, fenpiclonila, fludioxonila,
 quinoxifeno, bifenila, cloroneb, dicloran, etridiazol, quintozeno, tecnazeno,
 tolclofos-metila, ftalida, piroquilon, triciclazol, carpropamid, diclocimet, feno-
 xanil, fenhexamid, piributicarb, polioxina, pencicurona, ciazofamid, zoxamida,
 blastidina-S, casugamicina, estreptomicina, validamicina, cimoxanil, iodo-
 15 carb, propamocarb, protiocarb, binapacril, dinocap, ferimzona, fluazinam,
 TPTA (acetato de fentina), TPTC (cloreto de fentina), TPTH (hidróxido de
 fentina, ácido oxolínico, himexazol, octilinona, fosetila, ácido fosfônico e um
 sal destes, tecloftalam, triazoxida, flusulfamida, diclomezina, siltiofam, diflu-
 metorim, bentiavalicarb-isopropila, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, mandi-
 20 propamid, oxitetraciclina, metassulfocarb, quinometionat, fluoroimida, milneb,
 hidróxido de cobre, octanoato de cobre, oxicloreto de cobre, sulfato de co-
 bre,

óxido cuproso, mancozeb, cobre de oxina, enxofre, ferbam, man-
 cozeb, maneb, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram, captafol, captan, fol-
 25 pet, clorotalonila, diclofluanid, tolilfluanid, anilazina, dodina, guazatina, imi-
 noctadina, ditianon, acibenzolar-S-metila, probenazol, tiadinila, etaboxam,
 ciflufenamid, proquinazid, metrafenona, fluopicolida, dazomet, difenzoquat,
 amisubrom, mistura Bordeaux, F-991, nabam, óxido de fenazina, policarba-
 mato, ou piribencarb.

30 Compostos fungicidas e nematicidas que podem ser misturados
 ou utilizados em combinação serão exemplificados por: demeton-S-metila,
 bioaletrina, S-ciclopentenilissômero de bioaletrina, famfur, DDT, DNOC, EPN,

- XMC, acrinatrina, azadiractina, azametifos, azinfos-etila, azinfosmetila, acequinocil, acetamiprid, acetoprol, acefato, azociclotina, abamectina, amitraz, alanicarb, aldicarb, alfacipermetrina, aletrin[(1R)-isômeros], d-cis-trans Aletrina, d-trans Aletrina, isocarbofos, isoxation, isofenfos, isoprocarb, imiciafos,
- 5 imidacloprid, imiprotrina, indoxacarb, esfenvalerato, etiofencarb, etiprol, etion, etiprol, etoxazol, etofenprox, etoprofos, emamectina, endosulfan, Empentrina, empentrin[(EZ)-(1R)-isômeros], oxamil, oxidemeton-metila, ometoato, cadusafos, cartap, carbarila, carbosulfan, carbofuran, gama-cihalotrina, gama-BCH(Lindano), xililcarb, quinalfos, cinopreno, quinometionato, quinometionat, cumafos, clotianidina, clofentezina, cromafenozida, cloretoxifos, clordano, clorpirifos, clorpirifos-metila, clorfenapir, clorfenvinfos, clorfluazuron, clormefos, cienopirafen, cianofos, diafentiuron, dietofencarb, dienoclor, dicrotophos, diclofention, cicloprotrina, diclorvos, dicofol, dissulfoton, dinotefuran, cihalotrina, cifenotrin[(1R)-trans-isômeros], ciflutrina, diflubenzuron, ciflume-
- 10 tofen, chexatina, cipermetrina, dimetilvinfos, dimetoato, tartaremetic, silafluofen, ciromazina,
- espinosad, espirodiclofeno, espirotetramat, espiromesifen, sulfo-
tep, zeta-cipermetrina, diazinon, tau-fluvalinato, tiacloprid, tiametoxam, tiodi-
carb, tiociclam, tiossultapsódio, tiofanox, tiometon, tetraclorvinfos, tetradifon,
- 20 tetrametrina, tetrametrin[(1R)-isômeros], depaetrina, tebupirinfos, tebufenozida, tebufenpirad, teflutrina, teflubenzuron, temefos, deltametrina, terbufos, tralometrina, transflutrina, triazamato, triazofos, triclorfon, tribufos, triflumuron, trimetacarb, tolfenpirad, naled, nicotina, nitenpiram, nemadectina, novaluron, noviflumuron, hidropreno,
- 25 vamidotion, paration, paration-metila, halfenprox, halofenozida, bioresmetrina, bistrifluron, piridafention, hidrametilnon, bifenazato, bifentrina, butóxido de piperonil, pimetozina, piraclofos, piridafention, piridaben, piridailil, pirproxifeno, pirimicarb, pirimidifen, pirimifos-metila, Piretrinas (piretrum), fipronila, fenazaquin, fenamifos, fenisobromolato, fenitroton, fenoxicarb, fenotrin[(1R)-transisômero], fenobucarb, fention, fentoato, fentrifanil, fenvalerato, fenpiroximato, óxido de fenbutatin, fenpropatrina, butocarboxim, butoxi-
- 30 carboxim, buprofrzin, furatiocarb, praletrina, fluacripirim, flucicloxuron, fluci-

- trinato, flussulfamida, fluvalinato, flupirazofos, flufenerim, flufenoxuron, Flubendiamida, flumetrina, flurimfen, protiofos, flonicamid, propafos, propargita, profenofos, propetanfos, propoxur, bromopropilato, beta-ciflutrina, betacipermetrina, hexitiazox, hexaflumuron, heptenofos, permetrina, bensultap,
- 5 benzoximato, bendiocarb, benfuracarb, borax, foxim, fosalona, fostiazato, fosfamidon, fosmet, formetanato, forato, malation, milbemectina, mecarbam, mesulfenfos, metomil, metaflumizon, metamidofos, metam-amônio, metam-sódio, metiocarb, metidation, metoxiclor, metoxifenoazida, metotrina, metopreno, metolcarb, mevinfos, monocrotofos, lambda-cialotrina, rinaxipir, fosfe-
- 10 to de alumínio, fosfina, lufenuron, resmetrina, lepmectina, rotenona, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis subsp. Aizawai*, *Bacillus thuringiensis subsp. Israelensis*, *Bacillus thuringiensis subsp. Kurstaki*, *Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*, CL900167, NNI-0101, RU15525, XDE-175, ou ZXI8901.
- 15 Compostos herbicidas conhecidos que podem ser misturados ou utilizados em combinação serão exemplificados por: 2,3,6-TBA, 2,4-D, 2,4-DB, DNOC, EPTC, HC-252, MCPA, MCPA-tioetila, MCPB, S-metolaclor, TCA, ioxinila, aclonifeno, azafenidina, acifluorfen, azinsulfuron, asulam, acetoclor, atrazina, anilofos, amicarbazona, amidossulfuron, amitrol, aminopirialid
- 20 (DE-750), amiprofos-metila, ametrina, alaclor, aloxidim, ancimidol, iodossulfuron-metil-sódio, isouron, isoxaclortol, isoxaflutole, isoxaben, isoproturon, imazaquin, imazapir, imazametabenz-metila, imazapic, imazamox, imazetapir, imazosulfuron, indanofan, esprocarb, etametsulfuron-metila, etalfluralina, etidimuron, etoxisulfuron, etofumesato, etobenzanid, oxadiazon, oxadiargyi,
- 25 oxaziclomefona, oxassulfuron, oxifluorfen, orizalina, orbencarb, cafenstrol, carfentrazona-etila, carbutilato, carbetamida, quizalofop-P, quizalofop-P-etila, quizalofop-P-tefurila, quizalofop-etila, quinclorac, quinmerac, cumiluron, glifosato, glifosato-trimésio(sulfosato), glufosinato-amônio, glufosinato-sódio, cletodim, clodinafop-propargila, clopiralid, clomazona, clometoxifeno, clomeprop,
- 30 cloransulam-metila, cloramben, cloridazon, clorimuron-etila, clorsulfuron, clortal-dimetila, clortiamid, clorprofam, cloreto de clormequat, cloroxuron, clorotoluron, clorobromuron, cianazina, diuron, dicamba, cicloato, cicloxidim,

diclosulam, ciclosulfamuron, diclobenila, diclofop-metila, diclorprop,
 diclorprop-P, dibrometo de diquat, ditiopir, siduron, dinitramina,
 cinidon-etila, cinossulfuron, dinoseb, dinoterb, cihalofop butila, difenamid,
 difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflumentorim, simazina, dimetaclor,
 5 dimetametrina, dimetenamid, simetrina, dimepiperato, dimefuron, cinmetilina,
 sulcotriona, sulfentrazone, sulfosulfuron, sulfometuron metila, setoxidim, ter-
 bacil, daimuron, dalapon, tiazopir, tiocarbazil, tiobencarb, tidiazimin, tidiazu-
 ron, tifensulfuron-metila, desmedifam, desmetrina, tenilclor, tebutam, tebutiu-
 ron, tepraloxidim, tefuriltrion, terbutilazina, terbutrina, terbumeton, tembotrio-
 10 na, topramezona, tralcoxidim, triaziflam, triassulfuron, trialato, trietazina, tri-
 clopir, triflusulfuron-metila, tritossulfuron, trifluralina, trifloxisulfuron-sódio,
 tribenuron-metila, naptalam, naproanilida, napropamida, nicossulfuron, nebu-
 ron, norflurazon, vernolato, dicloreto de paraquat, haloxifop, haloxifop-P, ha-
 loxifop-P metila, halosulfuron-metila, pinoxaden, picloram, picolinafeno, bispi-
 15 ribac-sódio, bifenox, piperofos, piraclonila, pirasulfotol, pirazoxifeno, pirazos-
 sulfuron-etila, pirazolinato, bilanafos, piraflufen-etila, piridafol, piritiobac-
 sódio, piridato, piriftalid, piributicarb, piribenzoxim, pirimisulfan, primissulfu-
 ron-metila, piriminobac-metila, piroxisulam, fenuron, fenoxaprop-P-etila, fe-
 noxaprop-etila, fencloirim, fentrazamida, fenmedifam, foramsulfuron, butaclor,
 20 butafenacil, butamifos, butilato, butralina, butroxidim, flzasulfuron, flamprop-
 M, fluazifop-butila, fluazifop-P-butila, fluazolato, fluometuron, fluometuron,
 fluoroglicofen-etila, sódio de flucarbazona, flucetossulfuron, flutiacet-metila,
 flupirsulfuron-metil-sódio, flufenacet, flufenpir-etila, flupropanato, flupoxamo,
 flumioxazina, flumiclorac-pentila, flumetsulam, fluridona, flurtamona, flurpri-
 25 midol, fluoxipir, fluocloridona, pretilaclor, prodiamina, prosulfuron, prosulfo-
 carb, propaquizafop, propaclor, propazina, propanil, propizamida, propiso-
 clor, profam, profluazol, propoxicarbazona, sódio de propoxicarbazona, pro-
 foxidim, bromacil, prometrina, prometon, bromoxinila, bromofenoxim, bromo-
 butida, florasulam, hexazinona, petoxamid, benazolina, penoxsulam, beflubu-
 30 tamid,
 pebulato, TM435, pendimetalina, benzfendizona, bensulida, ben-
 sulfuron-metila, benzobiciclon, benzofenap, bentazone, pentanoclor, pento-

xazona, benfluralina, benfuresato, fosamina, fomesafen, forclorfenuron, hidrazida maléica, mecoprop, mecoprop-P, mesossulfuron-metila, mesotriona, metazaclor, metabenzthiazuron,

- metamitron, metamifop, metil-dimuron, metoxuron, metosulam,
 5 metsulfuron-metila, metobromuron, metobenzuron, metolaclor, metribuzina, cloreto de mepiquat, mefenacet, monolinuron, molinato, lactofen, linuron, rimsulfuron, lenacil, cálcio de proexadiona, ou trinexapac-etila.

- O agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural da Invenção pode ser utilizado diretamente na forma daquelas
 10 formulações, ou diluindo-se na forma daquelas formulações, ou diluindo as formulações, para aplicação à folhagem, tratamento de semente, aplicação ao solo, aplicação submersa, aplicação de caixa sementeira, ou similares. A quantidade de aplicação varia dependendo de um tipo do composto a ser usado, doença-alvo, padrão de crescimento, grau de dano, condições ambientais, forma de uso e similares.

Por exemplo, no caso de um uso direto de pó ou formulação granular, a quantidade deve ser arbitrariamente selecionada de 0,1 g a 5 kg, preferivelmente de 1 g a 1 kg por 10 ares em termos de um ingrediente ativo.

- Além disso, no caso de utilização em uma forma líquida de emulsão ou pó umectável, a quantidade deve ser arbitrariamente selecionada
 20 de 0,1 ppm a 10.000 ppm, preferivelmente de 10 a 3.000 ppm.

No caso de utilização para uma aplicação de caixa sementeira, um efeito a longo prazo pode ser exibido fornecendo uma formulação em que uma propriedade de eluição do composto é controlada.

- O agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural da Invenção pode controlar doenças de planta causadas por fungos filamentosos, bactérias e vírus, de acordo com os padrões de aplicação acima descritos.

- A seguir, doenças de planta específicas serão exemplificadas sem ser limitadas a elas:

Pseudoperonospora cubensis, *Phytophthora melonis*, *Fusarium oxysporum*, *Pythium debaryanum*, *Corynespora cassiicola*, *Botrytis cinerea*,

Colletotrichum lagenarium, *Sphaerotheca cucurbitae*, *Pseudomonas syringae*, *Pseudomonas solanacearum*,

Erysife graminis, *Septoria nodorum*, *Septoria tritici*, *Puccinia recondite*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia graminis*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Pyrenophora teres*, *Rhynchosporium secalis*, *Erwinia carotovora*,
5 *Phytophthora infestans*,

Sclerotinia sclerotiorum, *Cladosporium fulvum*, *Corynebacterium michiganense*, *Pyricularia oryzae*, *Rhizoctonia solani*, *Cochliobolus miyabeanus*, *Xanthomonas oryzae*, *Fusarium* spp., *Pythium* spp., *Rhizopus* spp., *Trichoderma* sp.,
10

Burkholderia glumae, *Burkholderia plantarii*, *Acidovorax avenae*, *Erwinia ananas*, *Venturia inaequalis*, *Alternaria mali*, *Gymnosporangium yamadae*, *Physalospora piricola*, *Alternaria kikuchiana*, *Phomopsis fukushii*, *Monilinia fructicola*,

15 *Glomerella cingulata*, *Plasmopara viticola*, *Diaporthe citri*, *Elsinoe fawcetti* e similares.

A seguir, Métodos de Produção do derivado de Fórmula [I] que podem ser empregados no agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural de acordo com a invenção, métodos de formulação e
20 aplicações serão descritos em detalhes com referência aos Exemplos below. Entretanto, a presente invenção não está limitada a estes Exemplos de modo algum. Na descrição abaixo, '%' significa 'percentual em peso'. Os métodos para produção dos Intermediários de Produção do composto da Invenção serão também descritos.

25 EXEMPLOS

[Exemplo 1]

Produção de 5-sec-butil-4-cloro-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina (Composto inventivo Nº 1192) 0,6 g de hidreto de sódio (pureza: 60%, 13,9 mmols) foi adicionado a 30 ml de uma solução de N,N-dimetilformamida contendo 0,9 g (12,7 mmols) de 1H-pirazol em temperatura
30 ambiente e a mistura foi agitada durante 1 hora. Além disso, 10 ml de uma solução de N,N-dimetilformamida contendo 4,0 g (11,6 mmols) de 5-sec-

butil-4-cloro-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-metilsulfonilpirimidina foram adicionados também em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 1 hora. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com dietiléter. A camada orgânica obtida foi lavada com
5 água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida. Desse modo resíduo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 3,7 g de 5-secbutil-4-cloro-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina como um líquido transparente
10 te (produção: 95%).

Índice refrativo (n_D20): 1,5721

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,83 (3H, t, J=7,4 Hz), 1,01 (3H, d, J=6,6 Hz), 1,24-1,46 (5H, m), 1,60-1,89 (5H, m), 10 2,83-3,06 (3H, m), 3,71-3,75 (2H, m), 6,42-6,44 (1H, m), 7,79 (1H, bs), 8,48 (1H, d, J=2,7 Hz)
15

[Exemplo 2]

Produção de 5-sec-butil-4-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina (Composto inventivo nº 1190) 0,3 g (4,2 mmols) de acetato de sódio anidro e 10mg de paládio carbono foram adicionados a 100 ml de
20 uma solução de metanol contendo 0,7 g (2,1 mmols) de 5-sec-butil-4-cloro-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina. Um gás de hidrogênio foi fornecido sob pressão normal e a mistura foi agitada durante 42 horas em temperatura ambiente. Após confirmada a conclusão da reação, um catalisador foi filtrado através de celita. Após concentração do filtrado desse modo
25 obtido, água foi adicionada e extração foi submetida com acetato de etila. A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anidro, os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida. Desse modo resíduo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,5 g de 5-sec-butil-4-(4-metilpiperidin-
30 1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina como uma substância oleosa transparente incolor (produção: 86%).

Índice refrativo (n_D20): 1,5565

Dados de ^1H -RMN (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0,85 (3H, t, $J=7,4$ Hz), 1,00 (3H, d, $J=6,3$ Hz), 1,29-1,44 (5H, m), 1,57-1,78 (5H, m), 2,68-2,75 (1H, m), 2,89-3,04 (1H, m), 3,79-3,86 (2H, m), 6,42-6,43 (1H, m), 7,77 (1H, s), 8,25 (1H, s), 8,51 (1H, d, $J=2,8$ Hz)

5 [Exemplo 3]

Produção de 5-sec-butil-6-(4-metilpiperidin-1-il)-4-metiltio-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina (Composto inventivo nº 1204), 0,3 g (4,9 mmols) de tiometóxido de sódio foi adicionado a 10 ml de uma solução de tetraidrofurano contendo 1,5 g (4,5 mmols) de 5-sec-butil-4-cloro-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina e a mistura foi agitada durante 3 horas em temperatura ambiente. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida, para obter 1,6 g de 5-sec-butil-6-(4-metilpiperidin-1-il)-4-metiltio-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina como um pó branco (produção: quantitativa).

Ponto de fusão ($^{\circ}\text{C}$): 69 a 71

Dados de ^1H -RMN (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0,81 (3H, t, $J = 7,3$ Hz), 0,99 (3H, d, $J = 6,4$ Hz), 1,28 - 1,59 (6H, m), 1,74-1,96 (4H, m), 2,65 (3H, s), 2,86 - 3,03 (3H, m), 3,51-3,58 (2H, m), 6,42-6,43 (1H, m), 7,80 (1H, s), 8,54 (1H, d, $J = 1,8$ Hz)

[Exemplo 4]

Produção de 5-sec-butil-6-(4-metilpiperidin-1-il)-4-metilsulfonil-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina (Composto inventivo Nº 1206) 2,5 g de ácido m-cloroperbenzóico (pureza: 70%, 10,1 mmols) foram adicionados a 100 ml de uma solução de diclorometano contendo 1,4 g (4,1 mmols) de 5-sec-butil-6-(4-metilpiperidin-1-il)-4-metiltio-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina sob resfriamento por gelo e a mistura foi agitada durante 30 minutos. A mistura foi novamente agitada durante 72 horas em temperatura ambiente. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi lavada com uma solução aquo-

sa de bissulfeto de sódio, água, uma solução de bicarbonato de sódio aquosa e salmoura na referida ordem e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida, para obter 1,3 g de 5-sec-butyl-6-(4-metilpiperidin-1-il)-4-metilsulfonil-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina como uma substância viscosa amarela-pálida (produção: 86%).

Dados de ^1H -RMN (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0,85 (3H, t, $J=7,4$ Hz), 1,01 (3H, d, $J=6,3$ Hz), 1,35-1,43 (2H, m), 1,53 (3H, d, $J=7,1$ 5 Hz), 1,61-1,81 (3H, m), 1,88-1,98 (2H, m), 2,99-3,07 (2H, m), 3,24-3,32 (1H, m), 3,45 (3H, s), 3,85 (2H, m), 6,46-6,48 (1H, m), 7,82 (1H, s), 8,44 (1H, d, $J=2,2$ Hz).

[Exemplo 5]

Produção de 5-sec-butyl-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina-4-carbonitrilo (Composto inventivo N° 1215) 0,3 g (5,4 mmols) de cianeto de sódio foi adicionado a 10 ml de uma solução de dimetilsulfóxido contendo 1,0 g (2,7 mmols) de 5-sec-butyl-6-(4-metilpiperidin-1-il)-4-metilsulfonil-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina e a mistura foi agitada durante 1,5 hora em temperatura ambiente. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com dietiléter. A camada orgânica obtida foi secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida para obter 0,6 g de 5-sec-butyl-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina-4-carbonitrilo como uma substância viscosa amarela (produção: 63%).

Índice refrativo ($n_{\text{D}20}$): 1,5700

Dados de ^1H -RMN (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0,87 (3H, t, $J=7,3$ Hz), 1,02 (3H, d, $J=6,6$ Hz), 1,24-1,44 (2H, m), 1,56 (3H, d, $J=7,1$ Hz), 1,64-2,05 (5H, m), 2,74-2,82 (1H, m), 2,97-3,11 (2H, m), 3,83-3,90 (2H, m), 6,46 (1H, bs), 7,81 (1H, s), 8,49 (1H, d, $J=2,5$ Hz)

[Exemplo 6]

Produção de 5-sec-butyl-4-metil-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina (Composto inventivo N° 1225) 15 ml de uma solução de ácido clorídrico a 12N contendo 1,6 g (3,6 mmols) de 2-[5-sec-butyl-6-(4-

metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidin-4-il]malonato de dimetila foi agitada durante 32 horas a 80°C. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água, neutralizada com uma solução de hidróxido de sódio aquosa a 10% e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida. Desse modo resíduo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,1 g de 5-secbutil-4-metil-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina como uma substância oleosa amarela-pálida (produção: 12%).

Índice refrativo (n_D20): 1,5581

Dados de 1H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,84 (3H, t, J=7,4 Hz), - 153 - 1,00 (3H, d, J=6,6 Hz), 1,33-1,45 (5H, m), 1,64-1,78 (5H, m), 2,58 (3H, s), 2,82-3,01 (3H, m), 3,55-3,60 (2H, m), 6,41 (1H, bs), 7,76 (1H, s), 8,52 (1H, d, J=2,7 Hz)

[Exemplo 7]

Produção de 5-sec-butil-6-cloro-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina (Composto inventivo N° 0350), 0,6 g (9,5 mmols) de 1H-pirazol e 2,2 g (15,8 mmols) de carbonato de potássio foram adicionados a 20 ml de uma solução de N,Ndimetilformamida contendo 2,7 g (7,9 mmols) de 5-sec-butil-6-cloro-2-metilsulfonil-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 8 horas a 60°C. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com dietiléter. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida. Desse modo resíduo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 1,6 g de 5-sec-butil-6-cloro-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina como um pó branco (produção: 61%).

Ponto de fusão (°C): 137 a 139

Dados de 1H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,92 (t, 3H), 1,35 (d,

-154 - 3H), 1,75 (m, 2H), 3,42 (br, 1H), 4,38 (m, 2H), 5,23 (br, 1H), 6,45 (t, 1H), 7,80 (d, 1H), 8,46 (d, 1H).

[Exemplo 8]

Produção de 5-sec-butil-6-flúor-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-tri-
 5 fluoroetil)pirimidina-4-amina (Composto Inventivo nº 0349), 0,2 g (4,2 mmols) de fluoreto de potássio foi adicionado a 10 ml de uma solução de dimetilsul-
 fóxido contendo 0,7 g (2,1 mmols) de 5-sec-butil-6-cloro-2-(1H-pirazol-1-il)-
 N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina em temperatura ambiente e a mistura
 foi agitada durante 18 horas a 150°C. Após confirmar a conclusão da reação,
 10 a solução reacional foi vertida em água e extraída com dietiléter. A camada
 orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de
 magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em segui-
 da o solvente foi destilado sob pressão reduzida. Desse modo resíduo obtido
 foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,4 g de 5-
 15 sec-butil-6-20 flúor-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina
 como um pó amarelo-pálido (produção: 58%).

Ponto de fusão (°C): 132 a 134

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,90 (t, 3H), 1,34 (d,
 3H), 1,75 (m, 2H), 2,66 (m, 1H), 4,37 (m, 2H), 5,25 (br, 1H), 6,46 (t, 1H), 7,79
 20 (d, 1H), 8,45 (d, 1H).

[Exemplo 9]

Produção de 5-sec-butil-N,N-dietilamino-6-metil-2-(1H-pirazol-1-
 il)pirimidina-4-amina (Composto inventivo nº 0953) 0,9 g (13,2 mmols) de
 dietilamina foi adicionado a 10 ml de uma solução de N,N-dimetilformamida
 25 contendo 0,5 g (2,0 mmols) de 5-sec-butil-4-cloro-6-metil-2-(1H-pirazol-1-il)
 pirimidina em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 2 dias a
 80°C. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi verti-
 da em água e extraída com dietiléter. A camada orgânica obtida foi lavada
 com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os in-
 30 solúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado
 sob pressão reduzida. Desse modo resíduo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,5 g de 5-sec-butil-N,N-dietilami-

no-6-metil-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina-4-amina como uma substância oleosa laranja (produção: 84%).

Índice refrativo (n_D20): 1,5560

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,80 (t, 3H), 1,18 (t, 6H), 1,39 (d, 3H), 1,74 (m, 2H), 2,59 (s, 3H), 3,01 (m, 1H), 3,25 (m, 2H), 3,44 (m, 2H), 6,42 (t, 1H), 7,77 (d, 1H), 8,49 (d, 1H).

[Exemplo 10]

Produção de 5-sec-butil-6-metiltio-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina (Composto inventivo nº 0361).

Uma solução de metilmercaptano de sódio (conteúdo: 15%, 35 mmols) foi adicionada a 100 ml de uma solução de tetraidrofurano contendo 10,5 g (31,5 mmols) de 5-sec-butil-6-cloro-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 3 dias. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e salmoura neta ordem e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida. Desse modo resíduo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 10,6 g de 5-sec-butil-6-metiltio-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil) pirimidina-4-amina como uma substância viscosa transparente incolor (produção: 97,2%).

Índice refrativo (n_D20): 1,5559

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,91 (t, 3H), 1,32 (d, 3H), 1,73 (m, 2H), 2,62 (s, 3H), 3,14 (br, 1H), 4,38 (m, 2H), 4,88 (br, 1H), 6,44 (t, 1H), 7,80 (s, 1H), 8,52 (d, 1H)

[Exemplo 11]

Produção de 5-sec-butil-6-metilsulfonil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina (Composto Inventivo nº 0363), 16,6 g de ácido m-cloroperbenzóico (pureza: 70%, 67,5 mmols) foram adicionados a 100 ml de uma solução de clorofórmio contendo 10,6 g (30,7 mmols) de 5-sec-butil-6-metiltio-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina

sob resfriamento por gelo e a mistura foi agitada durante 30 minutos. Em seguida, a mistura foi novamente agitada durante a noite em temperatura ambiente. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com clorofórmio. A camada orgânica obtida foi lavada com uma solução aquosa de bissulfeto de sódio, água, uma solução de bicarbonato de sódio aquosa, água e salmoura nesta ordem e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 9,2 g de 5-secbutil-6-metilsulfonil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina como um cristal branco (produção: 79,3%).

Ponto de fusão (°C): 52 a 55

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,96 (t, 3H), 1,38 (d, 3H), 1,77 (m, 2H), 3,46 (s, 3H), 4,02 (m, 1H), 4,45 (m, 2H), 5,48 (br, 1H), 6,49 (t, 1H), 7,83 (s, 1H), 8,42 (d, 1H).

[Exemplo 12]

Produção de 6-benzilóxi-5-sec-butil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina (Composto inventivo nº 0357).

Uma mistura de 1,6 g (4,2 mmols) de 5-sec-butil-6-metilsulfonil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina, 0,7 g (6,4 mmols) de bicarbonato de sódio e 10 ml de álcool benzílico foi agitada durante 12 horas a 150°C. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e salmoura nesta ordem e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter uma mistura de 6-benzilóxi-5-sec-butil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina e álcool benzílico.

[Exemplo 13]

Produção de 5-sec-butil-2-(1H-pirazol-1-il)-6-(2,2,2-trifluoroetil-

amino)pirimidin-4-ol (Composto inventivo nº 0353)

Uma mistura de 6-benzilóxi-5-sec-butil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina e álcool benzílico, que foi obtida no Exemplo 12, foi dissolvida em 20 ml de metanol e 0,1 g de paládio carbono foi adicionado em temperatura ambiente. Um gás de hidrogênio foi fornecido para a solução reacional sob pressão normal e a solução foi agitada durante a noite em temperatura ambiente. Após confirmar a conclusão da reação, os insolúveis foram separados por filtração. Após concentração do filtrado desse modo obtido, água foi adicionada e extração com acetato de etila foi submetida. A camada orgânica obtida foi secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,8 g de 5-sec-butil-2-(1H-pirazol-1-il)-6-(2,2,2-trifluoroetilamino)pirimidin-4-ol como um pó branco (produção: 64,9%).

Ponto de fusão (°C): 141 a 143

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,90 (t, 3H), 1,31 (d, 15 3H), 1,70 (m, 1H), 1,86 (m, 1H), 2,82 (br, 1H), 4,22 (m, 2H), 4,84 (br, 1H), 6,51 (s, 1H), 7,74 (d, 1H), 8,33 (d, 1H)

20 [Exemplo 14]

Produção de 5-sec-butil-6-difluorometóxi-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina (Composto inventivo nº 0358)

0,4 g (3,0 mmols) de carbonato de potássio anidro foi adicionado a 10 ml de uma solução de N,N-dimetilformamida contendo 0,63 g (2,0 mmols) de 5-sec-butil-2-(1H-pirazol-1-il)-6-(2,2,2-trifluoroetilamino)pirimidin-4-ol em temperatura ambiente. A 50°C, a mistura foi agitada durante 1 hora ao mesmo tempo que introduzindo uma quantidade excessiva de clordifluorometano à solução reacional. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e salmoura nesta ordem e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzi-

da. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,35 g de 5-sec-butil-6-difluorometóxi-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina como um pó branco (produção: 47,9%).

5 Ponto de fusão (°C): 94 a 95

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,88 (t, 3H), 1,33 (d, 15 3H), 1,76 (m, 2H), 2,83 (m, 1H), 4,37 (m, 2H), 5,24 (br, 1H), 6,45 (dd, 1H), 7,64 (t, 1H, J = 72,5 Hz), 7,80 (d, 1H), 8,43 (d, 1H).

[Exemplo 15]

10 Produção de 5-amino-1-[5-sec-butil-4-cloro-6-(2,2,2-trifluoroetil-amino)pirimidin-2-il]-1H-pirazol-4-carboxilato de etila (Composto inventivo nº 0601).

0,6 g (3,8 mmols) de etoximetilenocianoacetato de etila foi adicionado a 10 ml de uma solução de etanol contendo 1,0 g (3,2 mmols) de 5-sec-butil-6-cloro-2-hidrazinil-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 27 horas sob refluxo. Após confirmar a conclusão da reação, o solvente foi destilado sob pressão reduzida. A solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,9 g de 5-amino-1-[5-sec-butil-4-cloro-6-(2,2,2-trifluoroetilamino)pirimidin-2-il]-1H-pirazol-4-carboxilato de etila como um pó branco (produção: 63%).

25 Ponto de fusão (°C): 173 a 174

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,91 (t, 3H), 1,34-1,39 (m, 6H), 1,73-1,78 (m, 2H), 3,39 (br, 1H), 4,26-4,44 (m, 15 4H), 5,27 (br, 1H), 7,29 (br, 2H), 7,82 (s, 1H)

[Exemplo 16]

30 Produção de 5-sec-butil-6-cloro-2-(4-cloro-1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina (Composto inventivo nº 0434).

0,4 g (3,3 mmols) de N-clorossuccinimida foi adicionado a 10 ml

de uma solução de acetonitrila contendo 1,0 g (3,0 mmols) de 5-sec-butil-6-cloro-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 2 horas sob refluxo. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,8 g de 5-sec-butil-6-cloro-2-(4-cloro-1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina como um pó branco (produção: 76%).

Ponto de fusão (°C): 173 a 174

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,91 (t, 3H), 1,35 (d, 3H), 1,75 (m, 2H), 3,40 (br, 1H), 4,35 (m, 2H), 5,28 (br, 1H), 7,71 (s, 1H), 8,42 (s, 1H)

15 [Exemplo 17]

Produção de 5-sec-butil-N-(1-metiletil)-2-(1H-pirazol-1-il)-6-trifluorometilpirimidina-4-amina (Composto inventivo nº 0240)

0,4 g (4,0 mmols) de cloridrato de isopropilamina e 0,4 g (4,0 mmols) de trietilamina foram adicionados a 20 ml da solução de tetraidrofurano contendo 0,4 g (1,3 mmol) de 5-sec-butil-4-cloro-2-(1H-pirazol-1-il)-6-trifluorometilpirimidina que pode ser obtida no Exemplo de Referência 19 que será descrito abaixo, em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante a noite a 60°C. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi dissolvido em 20 ml de etanol e 0,2 g (2,4 mmols) de acetato de sódio anidro e 40 mg de 10% de paládio carbono foram adicionados a este. Um gás de hidrogênio foi fornecido sob pressão normal e a mistura foi agitada durante a noite em temperatura ambiente. Após confirmar a conclusão da reação, o catalisador foi removido por filtração e o filtrado desse modo obtido foi concen-

trado. Água foi adicionada ao resíduo e ele foi extraído com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,26 g de 5-sec-butil-N-(1-metiletil)-2-(1H-pirazol-1-il)-6-trifluorometilpirimidina-4-amina como um cristal incolor (produção: 59%).

Ponto de fusão (°C): 85 a 87

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,89 (t, 3H), 1,32 (d, 9H), 1,73 (m, 2H), 3,25 (m, 1H), 4,54 (m, 1H), 5,06 (br, 1H), 6,43 (dd, 1H), 7,80 (d, 1H), 8,52 (d, 1H).

[Exemplo 18]

Produção de 5-sec-butil-6-etil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina (Composto inventivo N° 0385)

0,4 g (6,6 mmols) de 1H-pirazol e 0,9 g (6,6 mmols) de carbonato de potássio foram adicionados a 30 ml de uma solução de N,N-5-dimetilformamida contendo 1,1 g (3,3 mmols) de 5-sec-butil-6-etil-2-metilsulfonil-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 4 dias a 80°C. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 1,0 g de 5-sec-butil-6-etil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina como um pó branco (produção: 89%).

Ponto de fusão (°C): 89 a 90

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,91 (t, 3H), 1,26-1,35 (m, 6H), 1,66-1,78 (m, 2H), 2,76-2,89 (m, 2H), 3,10 (br, 1H), 5,00 (br, 1H), 6,43 (t, 1H), 7,78 (d, 1H), 8,51 (d, 1H)

[Exemplo 19]

Produção de 6-bromo-5-sec-butil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-

trifluoroetil)pirimidina-4-amina (Composto inventivo nº 0351).

0,5 g (7,1 mmols) de 1H-pirazol e 1,6 g (11,9 mmols) de carbonato de potássio anidro foram adicionados a 30 ml de uma solução de N,Ndimetilformamida contendo 2,3 g (5,9 mmols) de 6-bromo-5-sec-butil-2-
 5 metilsulfonil-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 24 horas a 50°C. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados
 10 por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 1,4 g de 6-bromo-5-sec-butil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina como um pó branco (produção: 62%).

Ponto de fusão (°C): 136 a 139

15 Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,93 (t, 3H), 1,33 (d,3H), 1,69-1,79 (m, 2H), 3,50 (br, 1H), 4,32-4,43 (m, 2H), 20 5,22 (br, 1H), 6,45 (q, 1H), 7,79 (d, 1H), 8,45 (d, 1H)

[Exemplo 20]

Produção de 5-sec-butil-6-ciclopropil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-
 20 trifluoroetil)pirimidina-4-amina (Composto inventivo nº 0387).

0,1 g (0,1 mmol) de tetracis(trifenilfosfina)paládio, 0,2 g (2,0 mmols) de ácido ciclopropilborônico, 0,3 g (2,5 mmols) de carbonato de sódio anidro e 5 ml de água foram adicionados a 20 ml de uma solução de tolueno contendo 0,6 g (1,7 mmol) de 5-sec-butil-6-bromo-2-(1H-pirazol-1-il)-
 25 N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina e a mistura foi agitada durante 26 horas sob refluxo. A solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e em seguida o solvente foi destilado sob pressão reduzida.
 30 Resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,3 g de 5-sec-butil-6-ciclopropil-2-(1H-pirazol-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina como um pó amarelo-pálido (produção:

49%).

Ponto de fusão (°C): 84 a 85

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,89 - 1,03 (m, 5H), 1,18 - 1,37 (m, 5H), 1,73-1,83 (m, 2H), 2,10-2,19 (m, 1H), 3,30 (br, 1H), 4,37-4,43 (m, 2H), 4,98 (br, 1H), 6,40 (t, 1H), 7,77 (t, 1H), 8,47 (d, 1H).

[Exemplo 21]

Produção de 5-sec-butil-N₄,N₄-dietil-2-(1H-pirazol-1-il)-N₆-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4,6-diamina (Composto inventivo nº 0371).

0,3 g (2,4 mmols) de carbonato de potássio anidro e 0,1 g (1,6 mmol) de 1H-pirazol foram adicionados a 10 ml de solução de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona contendo 0,6 g (1,6 mmol) de 5-sec-butil-N₄,N₄-dietil-2-metilsulfonyl-N₆-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4,6-diamina e a mistura foi agitada durante 6 horas a 150°C. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,2 g de 5-sec-butil-N₄,N₄-dietil-2-(1H-pirazol-1-il)-N₆-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4,6-diamina como um líquido viscoso marrom amarelado (produção: 38%).

Índice refrativo (n_D20): 1,5280

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,83 (t, 3H), 1,14 (t, 6H), 1,34 (d, 3H), 1,66 (m, 2H), 3,15 (m, 2H), 3,36 (m, 2H), 4,49 - 4,28 (m, 2H), 4,79 (br, 1H), 6,40 (m, 1H), 7,78 (d, 1H), 8,49 (d, 1H).

Em seguida, propriedades físicas dos compostos do presente pedido sintetizados de acordo com os Exemplos mencionados acima 1 a 21 são mostradas na Tabela 41 a 50.

[Tabela 41]

Compound No.	M.P. (°C) OR R.I. (n_{20}^D)	
0002	M.P.	146 - 148
0006	M.P.	141 - 144
0009	M.P.	42 - 44
0010	M.P.	78 - 80
0013	M.P.	53 - 54
0014	M.P.	91 - 92
0018	M.P.	131 - 133
0022	M.P.	148 - 151
0025	R.I.	1.5768
0026	R.I.	1.5888
0029	R.I.	1.5870
0030	M.P.	90 - 91
0035	M.P.	140 - 142
0047	M.P.	149 - 151
0049	M.P.	140 - 142
0133	M.P.	64 - 65
0135	R.I.	1.5766
0147	M.P.	89 - 90
0149	M.P.	107 - 108
0155	M.P.	175 - 178
0159	M.P.	139 - 141
0162	R.I.	1.5691
0163	M.P.	63 - 65
0166	M.P.	55 - 56
0167	M.P.	78 - 79
0171	M.P.	158 - 159
0175	M.P.	120 - 123
0178	R.I.	1.5631
0179	M.P.	41 - 42
0182	R.I.	1.5699
0183	R.I.	1.5696
0186	R.I.	1.5542
0187	M.P.	132 - 133
0190	R.I.	1.5717
0191	M.P.	164 - 165
0194	M.P.	106 - 107
0195	M.P.	138 - 140

[Tabela 42]

Compound No.	M.P. (°C) OR R.I. (n _D ²⁰)	
0198	M.P.	110 - 111
0199	M.P.	150 - 151
0200	R.I.	1.5709
0211	R.I.	1.5740
0222	M.P.	116 - 117
0240	M.P.	85 - 87
0241	M.P.	120 - 121
0242	M.P.	106 - 107
0245	R.I.	1.5449
0246	M.P.	48 - 50
0249	M.P.	99 - 101
0250	M.P.	113 - 114
0253	M.P.	88 - 90
0254	R.I.	1.5668
0259	M.P.	93 - 95
0300	R.I.	1.5555
0301	R.I.	1.5642
0304	M.P.	91 - 93
0305	R.I.	1.5608
0308	M.P.	89 - 90
0309	R.I.	1.5639
0312	R.I.	1.5936
0313	R.I.	1.5587
0316	M.P.	104 - 107
0317	M.P.	125 - 127
0325	R.I.	1.5369
0328	M.P.	138 - 139
0329	M.P.	117 - 119
0332	M.P.	110 - 112
0333	M.P.	93 - 95
0336	M.P.	87 - 90
0337	M.P.	107 - 109
0341	M.P.	114 - 117
0348	M.P.	147 - 149
0349	M.P.	132 - 134
0350	M.P.	137 - 139
0351	M.P.	136 - 139

[Tabela 43]

Compound No.	M.P. (°C) OR R.I. (n_D^{20})	
0353	M.P.	141 - 143
0354	M.P.	95 - 96
0355	M.P.	97 - 98
0356	M.P.	94 - 95
0360	M.P.	104 - 105
0361	R.I.	1.5569
0363	M.P.	62 - 65
0367	R.I.	1.5312
0368	R.I.	1.5289
0370	M.P.	97 - 99
0371	R.I.	1.5280
0372	M.P.	193 - 195
0374	M.P.	102 - 103
0376	M.P.	178 - 180
0377	M.P.	124 - 127
0379	M.P.	173 - 174
0380	M.P.	84 - 85
0381	M.P.	92 - 94
0382	M.P.	88 - 90
0383	R.I.	1.5236
0384	R.I.	1.5342
0385	M.P.	89 - 90
0386	M.P.	94 - 96
0387	M.P.	84 - 85
0389	M.P.	60 - 62
0391	M.P.	109 - 110
0392	M.P.	141 - 143
0393	M.P.	47 - 48
0394	M.P.	67 - 70
0395	M.P.	87 - 89
0401	M.P.	189 - 191
0409	M.P.	177 - 178
0410	M.P.	164 - 165
0422	M.P.	198 - 200
0434	M.P.	173 - 174
0435	M.P.	157 - 160
0436	M.P.	170 - 172

[Tabela 44]

Compound No.	M.P. (°C) OR R.I. (n_D^{20})	
0437	M.P.	180 - 182
0462	M.P.	133 - 134
0489	M.P.	143 - 144
0504	M.P.	213 - 215
0507	M.P.	181 - 182
0508	M.P.	192 - 193
0510	M.P.	189 - 190
0528	M.P.	253 - 255
0536	M.P.	203 - 205
0601	M.P.	173 - 174
0614	M.P.	188 - 189
0710	M.P.	50 - 52
0721	R.I.	1.5458
0723	M.P.	111 - 113
0732	M.P.	56 - 60
0764	M.P.	50 - 52
0768	M.P.	150 - 153
0772	M.P.	83 - 85
0775	M.P.	101 - 102
0776	M.P.	97 - 99
0780	R.I.	1.5781
0784	M.P.	33 - 35
0791	M.P.	76 - 79
0792	M.P.	77 - 79
0796	R.I.	1.5543
0799	R.I.	1.5609
0800	R.I.	1.5547
0812	M.P.	81 - 83
0816	M.P.	57 - 59
0820	M.P.	103 - 105
0824	M.P.	176 - 177
0828	M.P.	173 - 174
0836	R.I.	1.5566
0840	R.I.	1.5511
0844	R.I.	1.5432
0860	M.P.	109 - 111
0864	M.P.	99 - 100

[Tabela 45]

Compound No	M.P. (°C) OR	R.I. (n_D^{20})
0868	M.P.	181 - 183
0900	R.I.	1.5822
0901	R.I.	1.5678
0902	R.I.	1.5720
0903	M.P.	137 - 138
0904	M.P.	116 - 116
0906	M.P.	96 - 98
0907	R.I.	1.5760
0908	R.I.	1.5862
0911	R.I.	1.5742
0912	M.P.	88 - 90
0913	M.P.	149 - 144
0915	R.I.	1.5660
0916	R.I.	1.5734
0919	R.I.	1.5615
0920	R.I.	1.5461
0921	R.I.	1.5681
0934	M.P.	87 - 88
0943	M.P.	95 - 98
0953	R.I.	1.5660
0961	R.I.	1.6273
0962	R.I.	1.5685
0963	R.I.	1.5755
0966	R.I.	1.5500
0967	R.I.	1.5642
0970	R.I.	1.5468
0971	R.I.	1.5630
0974	M.P.	98 - 99
0976	R.I.	1.5674
0979	R.I.	1.5656
0986	R.I.	1.5498
0987	R.I.	1.5640
0990	R.I.	1.5407
0991	R.I.	1.5573
0994	R.I.	1.5427
0995	R.I.	1.5538
0998	M.P.	66 - 67

[Tabela 46]

Compound No.	M.P. (°C) OR R.I. (D ₂₀)	
1000	M.P.	79 - 81
1008	M.P.	99 - 96
1090	M.P.	111 - 119
1091	M.P.	131 - 132
1058	R.I.	1.5730
1060	R.I.	1.5718
1061	R.I.	1.5691
1062	M.P.	87 - 90
1064	R.I.	1.5569
1065	R.I.	1.5670
1068	M.P.	134 - 136
1070	R.I.	1.5671
1071	M.P.	123 - 126
1074	R.I.	1.5528
1075	M.P.	78 - 79
1079	R.I.	1.5661
1081	M.P.	100 - 102
1082	M.P.	86 - 88
1085	R.I.	1.5675
1086	R.I.	1.5652
1087	R.I.	1.5759
1089	R.I.	1.5629
1090	M.P.	87 - 90
1093	R.I.	1.5562
1094	R.I.	1.5645
1097	M.P.	61 - 63
1098	R.I.	1.5699
1101	M.P.	70 - 71
1102	R.I.	1.5810
1106	M.P.	139 - 136
1110	M.P.	102 - 104
1115	M.P.	96 - 98
1160	R.I.	1.5247
1169	M.P.	129 - 130
1167	M.P.	89 - 91
1175	R.I.	1.6079
1178	M.P.	61 - 64

[Tabela 47]

Compound No	M.P. (°C) OR R.I. (n _D ²⁰)
1179	M.P. 89 - 101
1182	R.I. 1.5617
1183	R.I. 1.5671
1186	R.I. 1.5592
1187	R.I. 1.5650
1190	R.I. 1.5565
1191	R.I. 1.5533
1192	R.I. 1.5721
1193	R.I. 1.5888
1195	M.P. 147 - 149
1196	R.I. 1.5503
1197	R.I. 1.5465
1199	M.P. 90 - 93
1204	M.P. 69 - 71
1211	R.I. 1.5621
1215	R.I. 1.5700
1222	M.P. 160 - 162
1225	R.I. 1.5581
1233	R.I. 1.5344
1239	R.I. 1.5690
1243	R.I. 1.5623
1247	R.I. 1.5251
1254	R.I. 1.5707
1255	R.I. 1.5729
1259	R.I. 1.5610
1263	R.I. 1.6000
1267	M.P. 65 - 68
1271	M.P. 89 - 92
1275	R.I. 1.5741
1279	M.P. 152 - 153
1283	M.P. 121 - 124
1286	R.I. 1.5600
1287	R.I. 1.5707
1290	R.I. 1.5653
1291	M.P. 66 - 68
1311	M.P. 83 - 85
1315	M.P. 168 - 169

[Tabela 48]

Compound No.	M.P. (°C) OR	R.I. (n_D^{20})
1318	R.I.	1.5657
1319	R.I.	1.5629
1322	M.P.	56-58
1323	R.I.	1.5741
1328	M.P.	103-104
1342	M.P.	103-105
1426	M.P.	65-67
1428	R.I.	1.5670
1440	M.P.	61-63
1442	M.P.	71-72
1448	M.P.	127-128
1452	M.P.	81-83
1455	R.I.	1.5513
1456	R.I.	1.5731
1459	M.P.	64-66
1460	M.P.	93-95
1497	M.P.	111-113
1511	M.P.	152-155
1533	M.P.	183-184
1554	M.P.	68-70
1576	M.P.	83-85
1595	M.P.	55-57
1597	M.P.	94-96
1609	M.P.	80-83
1611	M.P.	91-93
1617	M.P.	141-143
1624	R.I.	1.5728
1625	R.I.	1.5760
1628	M.P.	117-119
1629	M.P.	118-119
1633	M.P.	123-126
1637	M.P.	145-147
1640	R.I.	1.5700
1641	R.I.	1.5830
1644	R.I.	1.5798
1645	R.I.	1.5877
1657	R.I.	1.5513

[Tabela 49]

Compound No.	M.P. (°C) OR	R.I. (n_D^{20})
1661	M.P.	119 - 122
1737	M.P.	106 - 108
1829	M.P.	151 - 152
1833	R.I.	1.6217
1845	M.P.	118 - 120
1849	R.I.	1.6917
1860	M.P.	141 - 143
1862	M.P.	96 - 98
1898	R.I.	1.6062
1906	M.P.	107 - 109
1914	R.I.	1.5904
1918	M.P.	66 - 67
1994	R.I.	1.5803
1996	M.P.	168 - 170
2011	M.P.	96 - 97
0398	M.P.	145 - 146
0454	M.P.	144 - 145
0455	M.P.	81 - 83
0458	M.P.	168 - 169
0459	M.P.	125 - 127
0461	M.P.	253 - 255
0464	M.P.	249 - 250
0465	M.P.	123 - 125
0481	M.P.	175 - 178
0505	M.P.	203 - 204
0509	M.P.	157 - 160
0511	M.P.	55 - 58
0529	M.P.	188 - 190
0531	M.P.	147 - 149
0533	M.P.	202 - 204
0537	M.P.	168 - 170
0538	M.P.	174 - 176
0539	M.P.	107 - 110
0548	M.P.	180 - 181
0555	M.P.	163 - 164
0556	M.P.	165 - 167
0557	R.I.	1.4794
0615	M.P.	46 - 49
0698	M.P.	193 - 194
0702	M.P.	221 - 222
1958	R.I.	1.5581

Legenda das Tabelas:

Compound No. = Composto N°

M.P.: Ponto de fusão

5 R.I.: Índice refrativo

[Tabela 50]

Compound No.	¹ H-NMR data(CDCl ₃ /TMS δ(ppm))
0232	0.88(t, 3H, J=7.4Hz), 1.26-1.31(m, 9H), 1.65-1.79(m, 2H), 2.48(s, 3H), 4.35-4.50(m, 1H), 4.63(br, 1H), 6.39-6.41(m, 1H), 7.75-7.76(m, 1H), 8.49-8.50(m, 1H)
0373	0.88(t, 3H, J=7.4Hz), 1.34(d, 3H, J=7.2Hz), 1.63-1.79(m, 2H), 4.10-4.15(m, 1H), 4.37-4.46(m, 2H), 5.45(br, 1H), 6.49-6.50(m, 1H), 7.84(s, 1H), 8.53(d, 1H, J=2.8Hz)
0708	0.91-0.97(m, 3H), 1.28-1.32(m, 3H), 1.47(d, 3H, J=6.9Hz), 1.62-1.78(m, 2H), 2.43-2.53(m, 1H), 4.79-4.83(br, 1H), 5.22-5.35(m, 2H), 6.46-6.45(m, 1H), 7.79(s, 1H), 8.48(d, 1H, J=2.1Hz)
0760	0.89(3H, t, J=7.6Hz), 1.31(3H, d, J=7.3Hz), 1.69-1.73(2H, m), 2.49-2.60(2H, m), 3.34-3.51(1H, br), 3.89-3.93(2H, m), 5.34(1H, br), 6.44-6.45(1H, m), 7.78(1H, t), 8.45-8.49(1H, m)
0788	0.91(3H, t, J=7.3 Hz), 1.33(3H, d, J=7.2 Hz), 1.69-1.78(2H, m), 3.36(1H, brs), 3.78(2H, dt, J=9.1, 5.2 Hz), 3.89(2H, t, J=4.8 Hz), 5.60(1H, br), 6.43(1H, dd, J=2.5, 1.7 Hz), 7.77(1H, s), 8.47(1H, d, J=2.2Hz)
0827	0.91(3H, t, J=7.3Hz), 1.28(3H, d, J=6.8Hz), 1.58-1.77(2H, m), 2.48-2.57(1H, m), 2.87(2H, t, J=6.1Hz), 3.86-3.93(2H, m), 5.69(1H, br), 6.44-6.47(1H, m), 7.77(1H, t), 8.08(1H, s), 8.47(1H, d)
1155	0.91(3H, t, J=7.4 Hz), 1.30(3H, d, J=7.7 Hz), 1.58-1.71(2H, m), 2.39-2.53(2H, m), 2.88-2.94(1H, m), 3.95-4.09(4H, m), 6.44(1H, s), 7.79(1H, s), 8.25(1H, s), 8.48(1H, d, J=2.5 Hz)
1156	0.83(3H, t, J=7.5 Hz), 1.48(3H, d, J=7.1 Hz), 1.88-1.97(2H, m), 2.39-2.49(2H, m), 2.83-2.92(2H, m), 3.80-3.93(2H, m), 3.98-4.17(2H, m), 6.45(1H, dd, J=2.6, 1.6 Hz), 7.79(1H, d, J=0.5 Hz), 8.46(1H, d, J=2.7 Hz)
1159	0.92(3H, t, J=7.4 Hz), 1.32(3H, d, J=6.8 Hz), 1.58-1.75(2H, m), 2.77-2.83(1H, m), 4.09-4.30(4H, m), 6.46(1H, d, J=2.5 Hz), 7.81(1H, s), 8.33(1H, s), 8.47(1H, d, J=2.5 Hz)
1206	0.85(3H, t, J=7.4Hz), 1.01(3H, d, J=6.3Hz), 1.35-1.43(2H, m), 1.53(3H, d, J=7.1Hz), 1.61-1.81(3H, m), 1.88-1.98(2H, m), 2.99-3.07(2H, m), 3.24-3.32(1H, m), 3.45(3H, s), 3.85(2H, m), 6.46-6.48(1H, m), 7.82(1H, s), 8.44(1H, d, J=2.2Hz)

Legenda da Tabela:

Compound No. = Composto N^o

5 (Método de produção intermediária)

<Exemplo de Referência 1>

Produção de 5-sec-butil-2-mercaptopirimidina-4,6-diol

69,2 g (203,4 mmols) de uma solução a 20% de etóxido de só-

dio-etanol foram adicionados a 100 ml de uma solução de etanol contendo 20,0 g (92,5 mmols) de sec-butilmalonato de dietila e 7,7 g (101,7 mmols) de tiouréia em temperatura ambiente e a mistura foi agitada sob refluxo durante 6 horas. Uma produção de 5-sec-butil-2-mercaptopirimidina-4,6-diol foi confirmada com uma cromatografia de gás e um espectrômetro de massa de cromatografia de gás.

<Exemplo de Referência 2>

Produção de 5-sec-butil-2-metiltiopirimidina-4,6-15 diol.

14,4 g (101,7 mmols) de iodeto de metila foram adicionados à solução reacional de Exemplo de Referência 1 em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 14 horas em temperatura ambiente. Após confirmada a conclusão da reação, o solvente foi destilado sob pressão reduzida. Ao resíduo obtido, água foi adicionada e pH foi ajustado para 2 utilizando ácido clorídrico concentrado. Um cristal precipitado foi filtrado, lavado com água e em seguida secado para obter 17,5 g de 5-sec-butil-2-metiltiopirimidina-4,6-diol como um cristal branco leitoso (produção: 88%).

Dados de ^1H -RMN (DMSO- d_6 /TMS δ (ppm)): 0,73 (3H, t, J = 7,4 Hz), 1,11 (3H, d, J = 7,1 Hz), 1,39 - 1,53 (1H, m), 1,62 - 1,77 (1H, m), 2,46 (3H, s), 2,74 - 2,86 (1H, m), 11,5 (2H, br).

20 <Exemplo de Referência 3>

Produção de 5-sec-butil-4,6-dicloro-2-metiltiopirimidina.

11,5 g (74,9 mmols) de oxicloreto de fósforo e 3,0 g (24,9 mmols) de N,N-dimetilanilina foram adicionados a 5,0 g (25,0 mmols) de 5-sec-butil-2-metiltiopirimidina-4,6-diol e a mistura foi agitada durante 2 horas a 100°C. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida com uma solução de bicarbonato de sódio aquosa saturada e secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida, para obter 5,9 g de 5-sec-butil-4,6-dicloro-2-metiltiopirimidina (produção: 99%).

Dados de ^1H -RMN (CDCl_3 /TMS δ (ppm)): 0,86 (3H, t, J = 7,4

Hz), 1,36 (3H, d, J=7,1 Hz), 1,67 - 1,83 (1H, m), 1,89 - 2,04 (1H, m), 2,55 (3H, s), 3,38 - 3,51 (1H, m)

<Exemplo de Referência 4>

5 Produção de 5-sec-butil-4-cloro-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-metil-
tiopirimidina.

4,0 g (39,2 mmols) de trietilamina foram adicionados a 35 ml da
solução de tetraidrofurano contendo 4,5 g (17,8 mmols) de 5-sec-butil-4,6-
dicloro-2-metiltiopirimidina. Além disso, 1,9 g (19,6 mmols) de 4-metilpiperi-
dina foram novamente adicionados sob resfriamento por gelo e a mistura foi
10 agitada durante 14 horas em temperatura ambiente. Após confirmada a con-
clusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com
acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com 5% de ácido clorí-
drico, uma solução de bicarbonato de sódio aquosa saturada e uma solução
de cloreto de sódio aquosa saturada e em seguida secada sobre sulfato de
15 magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o
solvente foi destilado sob pressão reduzida, para obter 5,7 g de 5-sec-butil-
4-cloro-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-metiltiopirimidina como uma substância vis-
cosa amarela-pálida (produção: quantitativa).

Índice Refrativo (n_D20): 1,5537

20 Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,81 (3H, t, J=7,4 Hz),
0,98 (3H, d, J=6,6 Hz), 1,25-1,40 (5H, m), 1,57-1,90 (5H, m), 2,50 (3H, s),
2,75-2,95 (3H, m), 3,58-3,63 (2H, m)

<Exemplo de Referência 5>

25 Produção de 5-sec-butil-4-cloro-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-metil-
sulfonilpirimidina.

9,2 g de ácido m-cloroperbenzóico (pureza: 70%, 53,4 mmols)
foram adicionados a 200 ml de uma solução de diclorometano contendo 5,7
g (17,8 mmols) de 5-sec-butil-4-cloro-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-metiltiopirimi-
dina sob resfriamento por gelo e a mistura foi agitada durante 30 minutos.
30 Em seguida, a mistura foi novamente agitada durante 7 horas em temperatu-
ra ambiente. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi
vertida em água e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi

lavada com uma solução aquosa de bissulfeto de sódio, água, uma solução de bicarbonato de sódio aquosa e salmoura nesta ordem e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 5,9 g de 5-sec-butil-4-cloro-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-metilsulfonil-pirimidina como um pó branco (produção: 96%).

Ponto de fusão (°C): 88 a 90

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,84 (3H, t, J = 7,4 Hz), 1,00 (3H, d, J = 6,6 Hz), 1,22 - 1,45 (5H, m), 1,56 - 1,96 (5H, m), 2,77 - 2,85 (1H, m), 2,94 - 3,06 (2H, m), 3,29 (3H, s), 3,79 - 3,83 (2H, m).

<Exemplo de Referência 6>

Produção de 2-[5-sec-butil-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidin-4-il]malonato de dimetila.

1,1 g (8,5 mmols) de malonato de dimetila foram adicionados a 20 ml de uma solução de tetraidrofurano contendo 0,3 g de hidreto de sódio (pureza: 60%, 6,4 mmols) sob resfriamento por gelo e a mistura foi agitada durante 1 hora em temperatura ambiente. Além disso, 10 ml da solução de tetraidrofurano contendo 1,6 g (4,2 mmols) de 5-sec-butil-6-(4-metilpiperidin-1-il)-4-metilsulfonil-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina foram novamente adicionados em gotas sob resfriamento por gelo. A seguir, a mistura foi agitada durante 5 horas a 80°C. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 1,8 g de 2-[5-sec-butil-6-(4-metilpiperidin-1-il)-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidin-4-il]malonato de dimetila (produção: quantitativa).

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,88 (3H, t, J = 7,5 Hz), 1,01 (3H, d, J = 6,6 Hz), 1,32 - 1,43 (4H, m), 1,51-1,95 (10H, m), 2,91 - 3,07 (2H, m), 3,58 - 3,71 (2H, m), 3,78 (3H, s), 5,12 (1H, s), 6,38 - 6,39 (1H,

m), 7,78 (1H, s), 8,47 (1H, d, J = 2,8 Hz).

<Exemplo de Referência 7>

Produção de N-(5-sec-butil-6-cloro-2-metiltiopirimidin-4-il)-N-2,2,2-trifluoroetilcarbamato de terc-butila.

- 5 8,3 g (41,6 mmols) de 2,2,2-trifluoroetilcarbamato de terc-butila foram adicionados a 40 ml de uma solução de N,N-dimetilformamida contendo 1,3 g de hidreto de sódio (pureza: 60%, 33,3 mmols) sob resfriamento por gelo e a mistura foi agitada durante 1 hora. Além disso, 7,0 g (27,7 mmols) de 5-sec-butil-4,6-dicloro-2-metiltiopirimidina foram novamente adicionados
- 10 em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante a noite. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e o solvente foi destilado sob pressão reduzida.
- 15 O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 7,2 g de N-(5-sec-butil-6-cloro-2-metiltiopirimidin-4-il)-N-2,2,2-trifluoroetilcarbamato de terc-butila como uma substância oleosa laranja pálida (produção: 63%).

Índice Refrativo (n_D20): 1,4888

- 20 Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,94 (br, 3H), 1,24 - 1,59 (m, 14H), 2,54 (s, 3H), 2,77 (br, 1H), 4,46 (br, 2H)

<Exemplo de Referência 8>

Produção de 5-sec-butil-6-cloro-2-metiltio-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina.

- 25 7,7 g (67,3 mmols) de ácido trifluoroacético foram adicionados a 20 ml de uma solução de diclorometano contendo 3,7 g (9,0 mmols) de N-(5-sec-butil-6-cloro-2-metiltiopirimidin-4-il)-N-2,2,2-trifluoroetilcarbamato de terc-butila em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante a noite. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e
- 30 extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão re-

duzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 2,6 g de 5-sec-butil-6-cloro-2-metiltio-N-2,2,2-trifluoroetilpirimidina-4-amina como um pó branco (produção: 91%).

Ponto de fusão (°C): 82 a 83

5 Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,89 (t, 3H), 1,29 (d, 3H), 1,70 (m, 2H), 2,50 (s, 3H), 3,29 (br, 1H), 4,28 (m, 2H), 5,02 (br, 1H).

<Exemplo de Referência 9>

Produção de 5-sec-butil-6-cloro-2-metilsulfonil-N-2,2,2-trifluoroetilpirimidina-4-amina.

10 7,9 g de ácido m-cloroperbenzóico (pureza: 70%, 32,2 mmols) foram adicionados a 200 ml da solução de clorofórmio contendo 2,9 g (9,2 mmols) de 5-sec-butil-6-cloro-2-metiltio-N-2,2,2-trifluoroetilpirimidina-4-amina sob resfriamento por gelo e a mistura foi agitada durante 30 minutos. Em seguida, a mistura foi novamente agitada durante 1,5 hora em temperatura ambiente. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi lavada com uma solução aquosa de bissulfeto de sódio, água, uma solução de bicarbonato de sódio aquosa e salmoura nesta ordem e em seguida se-

15 cada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 2,74 g de 5-sec-butil-6-cloro-2-metilsulfonil-N-2,2,2-trifluoroetilpirimidina-4-amina como um cristal branco (produção: 86%).

20

Ponto de fusão (°C): 107 a 109

25 Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,92 (t, 3H), 1,35 (d, 3H), 1,77 (m, 2H), 3,29 (s, 3H), 3,44 (br, 1H), 4,34 (m, 2H), 5,42 (br, 1H).

<Exemplo de Referência 10>

Produção de 5-sec-butil-4-hidróxi-2-mercaptop-6-metilpirimidina.

A 100 ml de uma solução de etanol contendo 2,7 g (14,5 mmols) de 2-sec-butil-3-oxobutanato de etila sintetizado de acordo com um método descrito em US nº 6348618 e 1,2 g (15,9 mmols) de tiouréia, 9,9 g (29,0 mmols) de uma solução a 20% de etóxido de sódio-etanol foram adicionados

30

em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 4 horas sob refluxo. Uma produção de 5-sec-butil-4-hidróxi-2-mercapto-6-metilpirimidina foi confirmada com uma cromatografia de gás e um espectrômetro de massa de cromatografia de gás.

5 <Exemplo de Referência 11>

Produção de 5-sec-butil-4-hidróxi-6-metil-2-metiltiopirimidina.

2,3 g (15,9 mmols) de iodeto de metila foram adicionados à solução reacional de Exemplo de Referência 10 em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 24 horas em temperatura ambiente. Após confirmada a conclusão da reação, o solvente foi destilado sob pressão reduzida. Ao resíduo desse modo obtido, água foi adicionada, pH foi ajustado para 2 utilizando ácido clorídrico concentrado e extração foi submetida utilizando n-hexano. A camada orgânica obtida foi secada sobre sulfato de magnésio anidro, os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,5 g de 5-sec-butil-4-hidróxi-6-metil-2-metiltiopirimidina como um pó amarelo-pálido (produção: 16%).

Ponto de fusão (°C): 98 a 100

20 Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,83 (t, 3H), 1,29 (d,3H), 1,66 (m, 1H), 1,95 (m, 1H), 2,31 (s, 3H), 2,56 (s, 3H), 2,75 (m, 1H), 11,78 (br, 1H)

<Exemplo de Referência 12>

Produção de 5-sec-butil-4-cloro-6-metil-2-metiltiopirimidina.

25 Oxicloreto de fósforo (6,5 g, 42,4 mmols) e N,N-dimetilanilina (0,5 g, 4,2 mmols) foram adicionados a 3,0 g (14,1mmol) de 5-sec-butil-4-hidróxi-6-metil-2-metiltiopirimidina e a mistura foi agitada durante 2 horas a 100°C. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida lavada com uma solução de bicarbonato de sódio aquosa saturada e secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pres-

são reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 3,0 g de 5-sec-butil-4-cloro-6-metil-2-metiltiopirimidina como uma substância oleosa transparente amarela (produção: 92%).

5 Índice refrativo (n_D20): 1,5613

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,85 (t, 3H), 1,33 (d,3H), 1,75 (m, 1H), 1,87 (m, 1H), 2,53 (s, 3H), 2,54 (s, 3H), 20 3,19 (br, 1H)

<Exemplo de Referência 13>

Produção de 5-sec-butil-4-cloro-6-metil-2-metilsulfonilpirimidina.

10 7,5 g de ácido m-cloroperbenzóico (pureza: 70%, 30,3 mmols) foram adicionados a 200 ml de uma solução de diclorometano contendo 2,8 g (12,1 mmols) de 5-sec-butil-4-cloro-6-metil-2-metiltiopirimidina sob resfriamento por gelo e a mistura foi agitada durante 30 minutos. Em seguida, a mistura foi novamente agitada durante 2 horas em temperatura ambiente.

15 Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi lavada com uma solução aquosa de bissulfeto de sódio, água, uma solução de bicarbonato de sódio aquosa e salmoura nesta ordem e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida para obter 3,3 g

20 de 5-sec-butil-4-cloro-6-metil-2-metilsulfonilpirimidina como uma substância oleosa transparente incolor (produção: quantitativa).

Índice refrativo (n_D20): 1,5368

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,88 (t, 3H), 1,39 (d,3H), 1,82 (m, 1H), 1,90 (m, 1H), 2,73 (s, 3H), 3,35 (s, 3H), 3,35 (br, 1H)

25

<Exemplo de Referência 14>

Produção de 5-sec-butil-4-cloro-6-metil-2-(1Hpirazol-1-il) pirimidina.

30 0,9 g (12,9 mmols) de pirazol foi adicionado a 20 ml da solução de tetraidrofurano contendo 0,5 g de hidreto de sódio (pureza: 60%, 12,9 mmols) a 0°C e a mistura foi agitada durante 30 minutos em temperatura ambiente. A 20 ml de uma solução de tetraidrofurano contendo 3,1 g (11,7

mmols) de 5-sec-butil-4-cloro-6-metil-2-metilsulfonilpirimidina, uma solução preparada antecipadamente foi adicionada em gotas a -70°C e a mistura foi agitada durante 10 minutos na mesma temperatura. Após confirmar a conclusão da reação, 100 ml de água foram adicionados à solução reacional e a
 5 solução reacional foi extraída com dietiléter. A camada orgânica obtida foi lavada com água e secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida, para obter 3,17 g de 5-sec-butil-4-cloro-6-metil-2-(1H-pirazol-1-il)pirimidina como uma substância oleosa transparente amarela (produção:
 10 quantitativa).

Índice refrativo ($n_{\text{D}20}$): 1,5611

Dados de ^1H -RMN (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0,87 (t, 3H), 1,39 (d, 3H), 2,00-1,77 (m, 2H), 2,68 (s, 3H), 3,35 (br, 1H), 6,48 (s, 1H), 7,81 (s, 1H), 8,54 (d, 1H)

15 <Exemplo de Referência 15>

Produção de 5-sec-butil-6-cloro-2-hidrazinil-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina.

0,2 g (4,0 mmols) de monohidrato de hidrazina foi adicionado a 40 ml de uma solução de etanol contendo 1,3 g (3,6 mmols) de 5-sec-butil-6-
 20 cloro-2-metilsulfonil-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 4 horas sob refluxo. Após confirmar a conclusão da reação, o solvente foi destilado sob pressão reduzida. Ao resultante, água foi adicionada e a mistura foi extraída com clorofórmio. A
 camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre
 25 sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 1,1 g de 5-sec-butil-6-cloro-2-hidrazinil-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-
 amina como uma substância oleosa amarela-pálida (produção: 98%).

30 Índice refrativo ($n_{\text{D}20}$): 1,5136

Dados de ^1H -RMN (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0,87 (t, 3H), 1,28 (d, 3H), 1,65-1,70 (m, 2H), 3,27 (br, 1H), 3,86 (br, 1H), 4,18-4,29 (m, 2H),

4,96 (br, 1H), 6,03 (br, 1H)

<Exemplo de Referência 16>

Produção de 5-sec-butil-4-cloro-6-iodo-2-metiltiopirimidina.

5,0 g (19,9 mmols) de 5-sec-butil-4,6-dicloro-2-metiltiopirimidina foram adicionados a 30 ml de 55% de ácido hidriódico e a mistura foi agitada durante 2 horas em temperatura ambiente. A solução reacional foi vertida em água, neutralizada com uma solução de bicarbonato de sódio saturada e extraída com dietiléter. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida, para obter 6,0 g de 5-sec-butil-4-cloro-6-iodo-2-metiltiopirimidina bruta (produção: 81%).

<Exemplo de Referência 17>

Produção de 5-sec-butil-4-cloro-2-metiltio-6-trifluorometilpirimidina.

9,1 g (64,0 mmols) de trifluorometiltrimetilsilano, 1,5 g (25,6 mmols) de fluoreto de potássio e 4,9 g (25,6 mmols) de iodeto de cobre foram adicionados a 50 ml de uma solução de N-metil-2-pirrolidinona contendo 8,8 g (25,6 mmols) de 5-sec-butil-4-cloro-6-iodo-2-metiltiopirimidina bruta em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 1 hora a 60°C. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida, para obter 6,0 g de 5-secbutil-4-cloro-2-metiltio-6-trifluorometilpirimidina bruta (produção: 83%).

<Exemplo de Referência 18>

Produção de 5-sec-butil-4-cloro-2-metilsulfonil-6-trifluorometilpirimidina.

5,7 g de ácido m-cloroperbenzóico (pureza: 70%, 23,4 mmols) foram adicionados a 30 ml de uma solução de diclorometano contendo 3,0 g (10,6 mmols) de 5-sec-butil-4-cloro-2-metiltio-6-trifluorometilpirimidina bruta

sob resfriamento por gelo e a mistura foi agitada durante 30 minutos. Em seguida, a mistura foi novamente agitada durante 1 hora em temperatura ambiente. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi lavada com uma solução aquosa de bissulfeto de sódio, água, uma solução de bicarbonato de sódio aquosa, água e salmoura nesta ordem e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida, para obter 1,8 g de 5-sec-butil-4-cloro-2-metilsulfonil-6-trifluorometilpirimidina bruta (produção: 54%).

<Exemplo de Referência 19>

Produção de 5-sec-butil-4-cloro-2-(1H-pirazol-1-il)-6-trifluorometilpirimidina.

0,41 g (6,0 mmols) de 1H-pirazol foi adicionado a 20 ml da solução de tetraidofurano contendo 0,26 g de hidreto de sódio (pureza: 60%, 5,7 mmols) em temperatura ambiente e a mistura foi agitada durante 30 minutos. A solução reacional foi resfriada para -78°C, 1,8 g (5,7 mmols) de 5-sec-butil-4-cloro-2-metilsulfonil-6-trifluorometilpirimidina bruta foi adicionado à ela e a mistura foi agitada durante 10 minutos. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida, para obter 0,90 g de 5-sec-butil-4-cloro-2-(1H-pirazol-1-il)-6-trifluorometilpirimidina bruta (produção: 52%).

<Exemplo de Referência 20>

Produção de 5-sec-butil-4-cloro-6-etil-2-metilpirimidina.

0,2 g (0,2 mmol) de [1,1-bis(difenilfosfino)ferroceno] dicloropálio complexado com diclorometano foi adicionado a 50 ml de uma solução de tetraidofurano contendo 3,0 g (24,4 mmols) de 5-sec-butil-4,6-dicloro-2-metilpirimidina em temperatura ambiente e a isso 36,6 ml (1,00 mol/l, 36,6 mmols) de uma solução de tetraidofurano de brometo de etil magnésio foram

novamente adicionados em gotas a 45°C. A mistura foi agitada durante 2 horas na mesma temperatura. Após confirmada a conclusão da reação, uma solução aquosa de cloreto de amônio saturado foi adicionada sob resfriamento por gelo, a mistura reacional foi aquecida para temperatura ambiente e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo, desse modo obtido, foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 5,2 g de 5-secbutil-4-cloro-6-etil-2-metiltiopirimidina (produção: 87%).

Dados de ^1H -RMN (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0,85 (t, 3H), 1,24 - 1,37 (m, 6H), 1,76 - 1,82 (m, 3H), 2,55 (s, 3H), 2,81 (q, 2H)

<Exemplo de Referência 21>

Produção de 5-sec-butil-6-etil-2-metiltio-N-(2,2,2-trifluoroetil) pirimidina-4-amina.

2,1 g (21,7 mmols) de 2,2,2-trifluoroetilamina e uma quantidade catalítica de p-toluenossulfonato de sódio foram adicionados a 20 ml de uma solução de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona contendo 1,8 g (7,2 mmols) de 5-sec-butil-4-cloro-6-etil-2-metiltiopirimidina. Em um tubo selado, a mistura foi agitada durante 56 horas a 150°C. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 1,7 g de 5-sec-butil-6-etil-2-metiltio-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina (produção: 75%).

Dados de ^1H -RMN (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0,88 (t, 3H), 1,19 - 1,31 (m, 6H), 1,59 - 1,75 (m, 2H), 2,61 - 2,74 (m, 1H), 3,01 (br, 1H), 4,23 - 4,34 (m, 2H), 4,80 (br, 1H)

<Exemplo de Referência 22>

Produção de 5-sec-butil-6-etil-2-metilsulfonil-N-(2,2,2-trifluoroetil)

pirimidina-4-amina.

3,3 g de ácido m-cloroperbenzóico (pureza: 70%, 13,5 mmols) foram adicionados a 100 ml de uma solução de diclorometano contendo 1,7 g (5,4 mmols) de 5-sec-butil-6-etil-2-metiltio-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-
 5 amina sob resfriamento por gelo e a mistura foi agitada durante 30 minutos. Em seguida, a mistura foi novamente agitada em temperatura ambiente durante 24 horas. Após confirmada a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi lavada com uma solução aquosa de bissulfeto de sódio, água, uma solu-
 10 ção de bicarbonato de sódio aquosa e salmoura nesta ordem e secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 1,12 g de 5-secbutil-6-etil-2-metilsulfonil-N-(2,2,2- trifluoroetil)pirimidina-4-
 15 amina (produção: 61%).

Dados de $^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0,91 (t, 3H), 1,24 - 1,36 (m, 6H), 1,65 - 1,79 (m, 2H), 2,78 - 2,86 (m, 2H), 3,02 (br, 1H), 3,29 (s, 3H), 4,27 - 4,38 (m, 2H), 5,18 (br, 1H)

<Exemplo de Referência 23>

20 Produção de 5-sec-butil-4,6-dibromo-2-metiltiopirimidina.

13,4 g (46,7 mmols) de oxibrometo de fósforo foram adicionados a 40 ml de uma solução de clorobenzeno contendo 5,0 g (23,3 mmols) de 5-sec-butil-2-metiltiopirimidina-4,6-diol e a mistura foi agitada durante 3 horas sob refluxo. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi
 25 vertida em água e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida lavada com uma solução de bicarbonato de sódio aquosa saturada e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado
 30 por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 2,1 g de 5-sec-butil-4,6-dibromo-2-metiltiopirimidina (produção: 26%).

Dados de $^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0,86 (t, 3H), 1,37

(d,3H), 1,70 - 1,81 (m, 1H), 2,00 - 2,10 (m, 1H), 2,55 (s, 3H), 3,46 - 3,51 (m, 1H)

<Exemplo de Referência 24>

5 Produção de 6-bromo-5-sec-butil-2-metiltio-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina.

1,8 g (18,5 mmols) de 2,2,2-trifluoroetilamina foram adicionados a 10 ml de uma solução de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona contendo 2,1 g (6,2 mmols) de 5-sec-butil-4,6-dibromo-2-metiltiopirimidina. Em um tubo selado, a mistura foi agitada durante 10 horas a 120°C. Após confirmar a conclusão da
10 reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para
15 obter 2,2 g de 6-bromo-5-sec-butil-2-metiltio-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina (produção: 99%).

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,91 (t, 3H), 1,28 (d,3H), 1,66 - 1,71 (m, 2H), 2,49 (s, 3H), 3,40 (br, 1H), 4,21 - 4,32 (m, 2H), 4,99 (br, 1H)

20 <Exemplo de Referência 25>

Produção de 6-bromo-5-sec-butil-2-metilsulfonil-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina.

3,8 g de ácido m-cloroperbenzóico (pureza: 70%, 15,2 mmols) foram adicionados a 60 ml de uma solução de diclorometano contendo 2,2 g
25 (6,1 mmols) de 6-bromo-5-sec-butil-2-metiltio-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina sob resfriamento por gelo e a mistura foi agitada durante 30 minutos. Em seguida, a mistura foi novamente agitada em temperatura ambiente durante 2 horas. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com diclorometano. A camada orgânica obtida
30 foi lavada com uma solução aquosa de bissulfeto de sódio, água, uma solução de bicarbonato de sódio aquosa e salmoura nesta ordem e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados

por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida, para obter 2,32 g de 6-bromo-5-sec-butil-2-metilsulfonil-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina (produção: 98%).

Dados de ¹H-RMN (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 0,94 (t, 3H), 1,33 (d, 3H), 1,73 - 1,78 (m, 2H), 3,29 (s, 3H), 3,52 (br, 1H), 4,28 - 4,39 (m, 2H), 5,39 (br, 1H)

<Exemplo de Referência 26>

Produção de 5-sec-butil-N4,N4-dietil-2-metiltio-N6-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4,6-diamina

1,1 g (15,0 mmols) de dietilamina e uma quantidade catalítica de p-toluenossulfonato de sódio foram adicionados a 10 ml de uma solução de 1,3-dimetil-2-imidazolidinona contendo 1,0 g (3,0 mmols) de 5-sec-butil-6-cloro-2-metiltio-N-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4-amina. Em um tubo selado, a mistura foi agitada durante 23 horas a 150°C. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com acetato de etila. A camada orgânica obtida foi lavada com água e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 1,1 g de 5-sec-butil-N4,N4-dietil-2-metiltio-N6-(2,2,2-trifluoroetil) pirimidina-4,6-diamina (produção: quantitativa).

<Exemplo de Referência 27>

Produção de 5-sec-butil-N4,N4-dietil-2-metilsulfonil-N6-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4,6-diamina.

1,9 g de ácido m-cloroperbenzóico (pureza: 70%, 7,5 mmols) foram adicionados, sob resfriamento por gelo, a 50 ml de uma solução de clorofórmio contendo 1,1 g (3,0 mmols) de 5-sec-butil-N4,N4-dietil-2-metiltio-N6-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4,6-diamina obtidos em Exemplo de Referência 26 e a mistura foi agitada durante 30 minutos. Em seguida, a mistura foi novamente agitada durante a noite em temperatura ambiente. Após confirmar a conclusão da reação, a solução reacional foi vertida em água e extraída com clorofórmio. A camada orgânica foi lavada com uma solução a-

quosa de bissulfeto de sódio, água, uma solução de bicarbonato de sódio aquosa e salmoura nesta ordem e em seguida secada sobre sulfato de magnésio anidro. Os insolúveis foram separados por filtração e então o solvente foi destilado sob pressão reduzida. O resíduo desse modo obtido foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para obter 0,6 g de 5-sec-butil-N4,N4-dietil-2-metilsulfonil-N6-(2,2,2-trifluoroetil)pirimidina-4,6-diamina (produção: 52%).

Dados de ^1H -RMN (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0,83 (t, 3H), 1,15 (t, 6H), 1,30 (d, 2H), 1,66 (m, 2H), 3,02 (q, 1H), 3,17 (m, 2H), 3,24 (s, 3H), 3,34 (m, 2H), 4,30 (m, 2H), 4,91 (br, 1H)

Em seguida, um método de preparação de formulação será descrito em detalhes com referência a exemplos de formulação representativos. O tipo e relação de mistura do composto e aditivo não são limitados a eles e eles podem ser alterados em uma ampla faixa. Na descrição abaixo, 'partes' significam 'partes por peso'.

[Exemplo de formulação 1]

Pó umectável

0,5 parte de éter polioxietileno-octilfenílico, 0,5 parte de um sal de sódio de condensado de formalina de ácido β -naftaleno sulfônico, 20 partes de diatomito e 69 partes de argila foram misturadas com 10 partes de Composto N° 0259 e a mistura foi esmagada para obter pó umectável.

[Exemplo de formulação 2]

Pó umectável

50 partes do composto de Composto n° 0350, 45 partes de diatomito, 2 partes de dinaftilmetanodissulfonato de sódio e 3 partes de sulfonato de lignina de sódio foram misturadas homogêneamente e esmagadas para obter pó umectável.

[Exemplo de formulação 3]

Fluível

0,2 parte de goma xantana foi dissolvida em 75,8 partes de água. Além disso, em adição a 13 partes do composto de Composto n° 0147, 4 partes de sulfato de fenil éter estirenado de polioxietileno e 7 partes de

etileno glicol, silicone AF-128N (produzido por Asahi Chemical Industry Co., Ltd.) foram também adicionados por 130 ppm com com respeito à quantidade total e eles foram misturados durante 30 minutos com um agitador em alta velocidade.

- 5 A seguir, a mistura foi esmagada utilizando um pulverizador de umidade para obter um fluível.

[Exemplo de formulação 4]

Emulsão

- 10 60 partes de uma mistura de partes iguais de xileno e isoforona e 10 partes de um densoativo obtido como uma mistura de alquilato de sorbitan de polioxietileno, um polímero de alquilarila de polioxietileno e sulfonato de alquilarila, foram adicionadas a 30 partes do composto de Composto nº 0919 e estes foram bem agitados para obter uma emulsão.

[Exemplo de formulação 5]

- 15 Grânulo

- A 5 partes do composto de Composto Nº 1215, 85 partes de uma carga obtida misturando-se talco e bentonita em uma faixa de 1:3, 5 partes de carbono branco e 5 partes de um densoativo obtido como uma mistura de alquilato de sorbitan de polioxietileno, um polímero de alquilarila de polioxietileno e sulfonato de alquilarila, estes adicionados a 10 partes de água e a mistura foi bem esmagada para fornecer uma forma pastosa. Este produto pastoso foi empurrado através de uma peneira tendo um diâmetro de 0,7 mm, ele foi em seguida secado e cortado em um comprimento de 0,5 a 1 mm, para obter um grânulo.

- 25 Com compostos mostrados nas Tabelas 1 a 40, várias formulações podem ser produzidas na mesma maneira de acordo com Exemplo de formulações 1 a 5.

 Em seguida, efeitos exibidos pelo composto da invenção serão descritos com referência a Exemplos teste.

- 30 [Exemplo Teste 1]

 Em teste sobre efeito protetor contra *Pyricularia oryzae* sementes de arroz (variedade: *Aichi Asahi*) foram semeadas em cada pote de argi-

la tendo um diâmetro de 7,5 cm e deixadas desenvolver durante 2 a 4 semanas em uma estufa. O pó umectável preparado de acordo com Exemplo de formulação 1 foi diluído em água de maneira que uma concentração de ingrediente ativo fosse de 500 ppm, um dispersante (Kumiten) foi adicionado para o fator diluição ser de 3.000 vezes e o agente resultante fosse vaporizado às plantas de arroz em um estágio de quatro folhas na quantidade de 20 ml por 1 pote. Após secagem a ar, as plantas de arroz foram inoculadas vaporizando uma suspensão de conidia de *Pyricularia oryzae* e incubadas em uma câmara úmida a 25°C (umidade relativa de 100%) até um desenvolvimento de doença. 5 dias após a inoculação, o número de lesão sobre uma folha que estava no topo do tempo de vaporização do agente foi contado e um nível de controle (%) foi calculado utilizando a expressão mostrada abaixo.

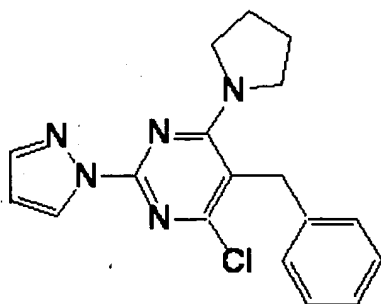
De acordo com este teste, compostos fornecendo um nível de controle de 100% foram Composto Nºa: 0009, 0010, 0018, 0022, 0025, 0026, 0029, 0035, 0049, 0133, 0135, 0147, 0159, 0162, 0163, 0166, 0175, 0178, 0179, 0186, 0194, 0195, 0198, 199, 0200, 0222, 0240, 0242, 0246, 0249, 0250, 0254, 0259, 0301, 0305, 0309, 0312, 0313, 0317, 0328, 0329, 0336, 0337, 0341, 0349, 0350, 0351, 0354, 0358, 0361, 0370, 0372, 0384, 0385, 0387, 0389, 0391, 0392, 0434, 0435, 0436, 0710, 0732, 0760, 0764, 0768, 0776, 0780, 0792, 0800, 0828, 0844, 0860, 0864, 0868, 0907, 0916, 0919, 0921, 0943, 0962, 0963, 0966, 0967, 0971, 0975, 0979, 0986, 0987, 0990, 0991, 0994, 0995, 0998, 1000, 1008, 1031, 1058, 1060, 1061, 1062, 1065, 1068, 1071, 1082, 1085, 1086, 1087, 1090, 1093, 1094, 1106, 1110, 1115, 1156, 1160, 1179, 1187, 1191, 1196, 1239, 1283, 1286, 1287, 1291, 1311, 1315, 1318, 1319, 1323, 1328, 1342, 1426, 1428, 1442, 1452, 1455, 1456, 1459, 1460, 1497, 1511, 1554, 1576, 1595, 1597, 1617, 1624, 1625, 1628, 1633, 1640, 1641, 1657, 1898 e similares. Aqui, Composto comparativo 1 não exibiu um efeito de controle.

Aqui abaixo, uma expressão para calcular um nível de controle (%) é mostrada.

[Expressão 1]

$$\text{Nível de Controle (\%)} = \left(1 - \frac{\text{média do número de lesão na área tratada}}{\text{média do número de lesão na área não-tratada}} \right) \times 100$$

Composto comparativo 1 mencionado acima é Composto nº 1-1693 descrito em JP-A Nº 2005-232081. Uma estrutura deste é mostrada abaixo.

5 [Fórmula Química 32]

Composto Nº 1-1693 em
JP-A Nº 2005-232081

<Exemplo de Teste 2>

- Teste sobre efeito protetor contra sementes de arroz *Rhizoctonia solani* (variedade: *Kinmaze*) foram semeadas em cada pote de argila tendo um diâmetro de 7,5 cm e deixadas desenvolver durante 3 semanas em uma
- 10 estufa. O pó umectável preparado de acordo com o Exemplo de Formulação 1 foi diluído em água de maneira que uma concentração ingrediente ativo seja 500 ppm, um dispersante (Kumiten) foi adicionado para o fator de diluição ser 3.000 vezes e o agente resultante foi vaporizado ao arroz em um estágio de duas e meia a três folhas na quantidade de 20 ml por 1 pote. A-
- 15 pós secagem por ar, as plantas foram inoculadas uniformemente cobrindo a superfície do solo com *Rhizoctonia solani* cultivado em um meio de farelo de rosca de arroz e incubado em uma câmara úmica a 30°C (umidade relativa de 100%) até um desenvolvimento de doença. 5 dias após a inoculação, os índices de desenvolvimento de doença de todos os potes foram examinados
- 20 de acordo com o padrão descrito abaixo e um nível de controle (%) foi calculado utilizando a expressão mostrada abaixo.

De acordo com este teste, compostos fornecendo um nível de controle de 100% foram os compostos N^{os}: 0006, 0010, 0018, 0035, 0049, 0135, 0159, 0163, 0186, 0190, 0191, 0194, 0195, 0199, 0200, 0222, 0232, 0241, 0242, 0246, 0249, 0250, 0254, 0259, 0301, 0305, 0309, 0312, 0313, 0328, 0329, 0333, 0336, 0337, 0341, 0348, 0349, 0350, 0351, 0354, 0361, 0367, 0368, 0370, 0372, 0373, 0377, 0382, 0384, 0387, 0389, 0391, 0393, 0395, 0401, 0434, 0435, 0436, 0437, 0536, 0708, 0710, 0732, 0760, 0764, 0768, 0772, 0775, 0776, 0780, 0788, 0792, 0796, 0800, 0812, 0824, 0828, 0840, 0844, 0860, 0864, 0868, 0904, 0908, 0913, 0915, 0916, 0920, 0921, 0943, 0953, 0962, 0963, 0967, 0971, 0975, 0979, 0998, 1000, 1008, 1031, 1058, 1060, 1062, 1065, 1068, 1071, 1082, 1086, 1087, 1090, 1094, 1098, 1102, 1106, 1110, 1115, 1156, 1167, 1179, 1187, 1190, 1191, 1192, 1204, 1215, 1255, 1263, 1283, 1290, 1315, 1318, 1319, 1328, 1342, 1426, 1428, 1442, 1452, 1497, 1511, 1533, 1554, 1576, 1595, 1597, 1617, 1625, 1633, 1637, 1640, 1641, 1833, 1849, 1898, 1906, 1914, 1994, 2011 e similares. Aqui, o Composto Comparativo 1 não exibiu um efeito de controle e o Composto Comparativo 2 mostrou um nível de controle de 50%.

O padrão para índice de desenvolvimento de doença é como segue:

20

[Tabela 51]

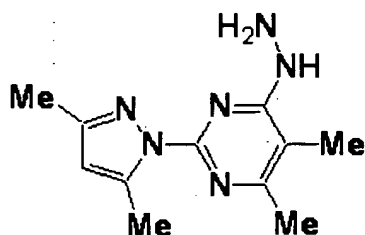
Índice de Desenvolvimento de Doença	
0:	O Desenvolvimento de Doença não é reconhecido
1:	Altura infectada é menor do que 25% daquela em área não tratada.
2:	Altura infectada é 25% ou mais a menos do que 50% daquela em área não tratada
3:	Altura infectada é 50% ou mais a menos do que 75% daquela em área não tratada.
4:	Altura infectada é 75% ou mais daquela em área não tratada.

Aqui abaixo, uma expressão para calcular um nível de controle (%) é mostrada.

[Expressão 2]

$$\text{Nível de Controle (\%)} = \left(1 - \frac{\text{média do índice de desenvolvimento da doença da área tratada}}{\text{média do índice de desenvolvimento da doença da área não-tratada}} \right) \times 100$$

Aqui, Compostos Comparativos 1 e 2 mencionados acima são Composto Nº 1-1693 descrito em JP-A Nº 2005-232081 e Composto Nº 182 descrito em JP-A Nº S54-115384, respectivamente. Uma estrutura do Composto Comparativo 1 é mostrada como acima e a estrutura do Composto Comparativo 2 é mostrada abaixo.

[Fórmula química 33]

Composto Nº 182 em
JP-A Nº S54-115384

<Exemplo de Teste 3>

Teste sobre efeito protetor contra sementes de pepino *Pseudoperonospora cubensis* 4 (variedade: Sagami-Hanzyo) foram semeadas em cada xícara de plástico tendo um diâmetro de 5,5 cm e deixadas desenvolver durante 7 dias em uma estufa. O pó umectável preparado de acordo com o Exemplo de Formulação 1 foi diluído em água de maneira que uma concentração de ingrediente ativo seja 500 ppm, um dispersante (Kumiten) foi adicionado para o fator de diluição ser 3.000 vezes e o agente resultante foi vaporizado à muda de pepino, a folha da semente da qual é aberta na quantidade de 20 ml por uma xícara. Após secagem por ar, as plantas foram inoculadas por vaporização com uma suspensão de conidia de *Pseudoperonospora cubensis*. As plantas inoculadas foram imediatamente colocadas em uma câmara úmida a 20°C (umidade relativa de 100%) durante 24 horas. A seguir, as plantas foram transferidas para uma estufa. 6 Dias depois, os índices de desenvolvimento de doença de cotilédones para todos os potes

foram examinados de acordo com o padrão descrito abaixo, uma severidade da doença foi determinada utilizando uma Expressão mostrada abaixo e um nível de controle (%) foi calculado utilizando outra Expressão mostrada abaixo. De acordo com este teste, compostos fornecendo um nível de controle

5 de 100% foram os compostos N^{os}: 0002, 0006, 0009, 0010, 0013, 0014, 0018, 0022, 0025, 0026, 0029, 0035, 0049, 0133, 0135, 0147, 0155, 0159, 0162, 0163, 0166, 0178, 0179, 0182, 0186, 0187, 0190, 0191, 0194, 0195, 0200, 0222, 0232, 0241, 0242, 0246, 0249, 0250, 0259, 0300, 0301, 0304, 0305, 0308, 0309, 0313, 0316, 0325, 0328, 0329, 0336, 0341, 0348, 0349, 10 0350, 0351, 0358, 0361, 0368, 0370, 0371, 0372, 0384, 0385, 0387, 0389, 0393, 0394, 0401, 0435, 0436, 0437, 0708, 0710, 0721, 0732, 0760, 0764, 0768, 0772, 0775, 0776, 0791, 0799, 0812, 0824, 0827, 0828, 0860, 0864, 0907, 0908, 0915, 0921, 0943, 0953, 0962, 0963, 0966, 0967, 0970, 0971, 0974, 0975, 0986, 0987, 0990, 0994, 1000, 1008, 1058, 1071, 1075, 1081, 15 1082, 1085, 1086, 1087, 1090, 1094, 1097, 1098, 1101, 1110, 1115, 1178, 1182, 1183, 1186, 1187, 1190, 1197, 1215, 1225, 1263, 1279, 1286, 1287, 1290, 1291, 1318, 1342, 1426, 1440, 1452, 1455, 1456, 1459, 1511, 1533, 1554, 1576, 1595, 1624, 1628, 1637, 1641, 1657, 1829, 1906 e similares. o Composto Comparativo 1 não exibiu um efeito de controle.

20 O padrão para índice de desenvolvimento de doença é como segue:

[Tabela 52]

Índice de Desenvolvimento de Doença	
0:	O Desenvolvimento de Doença não é reconhecido
1:	área de desenvolvimento de doença menor do que 25%
2:	área de desenvolvimento de doença de 25% ou mais a menos do que 50%
3:	área de desenvolvimento de doença de 50% ou mais a menos do que 75%
4:	área de desenvolvimento de doença de 75% ou mais

Aqui abaixo, uma Expressão para calcular uma severidade da doença (%) é mostrada.

[Expressão 3]

$$\text{Severidade da doença} = \left(\frac{n0 \times 0 + n1 \times 1 + n2 \times 2 + n3 \times 3 + n4 \times 4}{4 \times N} \right) \times 100$$

contanto que,

N: número total de folhas examinadas

n0: número de folhas de Índice de Desenvolvimento de Doença 0

5 n1: número de folhas de Índice de Desenvolvimento de Doença 1

n2: número de folhas de Índice de Desenvolvimento de Doença 2

n3: número de folhas de Índice de Desenvolvimento de Doença 3

n4: número de folhas de Índice de Desenvolvimento de Doença 4.

Aqui abaixo, uma expressão para calcular um nível de controle

10 (%) é mostrada.

[Expressão 4]

$$\text{Nível de Controle (\%)} = \left(1 - \frac{\text{severidade da doença da área tratada}}{\text{severidade da doença da área não-tratada}} \right) \times 100$$

O Composto Comparativo 1 mencionado acima é Composto N°

1-1693 descrito em JP-A N° 2005-232081 mencionado anteriormente.

<Exemplo de Teste 4>

15 Teste sobre efeito protetor contra sementes de pepino *Botrytis cinerea* (variedade: Sagami-Hanziro) foram semeadas em cada xícara de plástico tendo um diâmetro de 5,5 cm e deixadas desenvolver durante 7 dias em uma estufa. O pó umectável preparado de acordo com o Exemplo de

20 Formulação 1 foi diluído em água de maneira que uma concentração ingrediente ativo seja 500 ppm, um dispersante (Kumiten) foi adicionado para o fator de diluição ser 3.000 vezes e o agente resultante foi vaporizado à muda de pepino, a folha da semente da qual é aberta na quantidade de 20 ml por uma xícara. Após secagem por ar, um disco de papel esterilizado foi imerso em uma suspensão de conídios de *Botrytis cinerea* e depositado sobre um

25 lado superior de um cotilédono de pepino para inoculação e a seguir cuidado

em uma câmara úmida a 20°C (umidade relativa de 100%) até um desenvolvimento de doença. 2 dias depois, os índices de desenvolvimento de doença de todos os potes foram examinados de acordo com o padrão no Exemplo de Teste 3, uma severidade da doença foi determinada utilizando a Expressão no Exemplo de Teste 3 e um nível de controle (%) foi calculado utilizando a Expressão no Exemplo de Teste 3.

De acordo com este teste, compostos fornecendo um nível de controle de 100% foram os compostos N^{os}: 0049, 0195, 0200, 0222, 0242, 0250, 0254, 0259, 0309, 0313, 0349, 0350, 0351, 0372, 0401, 0434, 0435, 0436, 0437, 0710, 0732, 0776, 0860, 0864, 0943, 1000, 1008, 1086, 1087, 1090, 1097, 1115, 1328, 1342, 1554, 1576, 1845 e similares. O Composto Comparativo 1 não exibiu um efeito de controle e o Composto Comparativo 2 mostrou um nível de controle de 25%.

Aqui, Compostos Comparativos 1 e 2 mencionados acima são Composto n^o 1-1693 descrito em JP-A n^o 2005-232081 e Composto n^o 182 descrito em JP-A n^o S54-115384, respectivamente.

<Exemplo de Teste 5>

Teste sobre efeito protetor contra sementes de trigo *Erysiphe graminis* (variedade: Norin n^o 61) foram semeadas em cada xícara de plástico tendo um diâmetro de 5,5 cm e deixadas desenvolver durante 8 dias em uma estufa. O pó umectável preparado de acordo com o Exemplo de Formulação 1 foi diluído em água de maneira que uma concentração ingrediente ativo seja 500 ppm, um dispersante (Kumiten) foi adicionado para o fator de diluição ser 3.000 vezes e o agente resultante foi vaporizado ao trigo em um estágio de uma e meia a duas folhas na quantidade de 20 ml por uma xícara. Após secagem por ar, as plantas foram inoculadas igualmente borrifando com conídias de *Erysiphe graminis* utilizando um espanador minúsculo ou similar para inoculação e em seguida incubadas em uma estufa até um desenvolvimento de doença. 7 dias depois, os índices de desenvolvimento de doença de primeiras folhas para um total de 5 potes foram examinados de acordo com o padrão no Exemplo de Teste 3, uma severidade da doença foi determinada utilizando a Expressão no Exemplo de Teste 3 e um nível de

controle (%) foi calculado utilizando a Expressão no Exemplo de Teste 3.

De acordo com este teste, compostos fornecendo um nível de controle de 100% foram os compostos nºs: 0010, 0018, 0022, 0025, 0026, 0029, 0035, 0133, 0135, 0149, 0162, 0163, 0166, 0167, 0178, 0179, 0183, 5 0186, 0187, 0194, 0199, 0200, 0211, 0222, 0232, 0240, 0249, 0259, 0305, 0309, 0312, 0313, 0317, 0333, 0341, 0349, 0350, 0351, 0354, 0355, 0358, 0361, 0370, 0371, 0373, 0384, 0385, 0386, 0387, 0389, 0391, 0392, 0401, 0434, 0437, 0708, 0710, 0721, 0732, 0760, 0764, 0768, 0792, 0796, 0800, 0844, 0864, 0900, 0901, 0902, 0906, 0907, 0915, 0916, 0919, 0920, 0921, 10 0934, 0943, 0953, 0961, 0962, 0963, 0966, 0967, 0970, 0971, 0975, 0979, 0986, 0987, 0990, 0991, 0994, 0995, 0998, 1000, 1008, 1030, 1058, 1060, 1061, 1062, 1064, 1065, 1087, 1089, 1093, 1094, 1097, 1098, 1101, 1102, 1115, 1156, 1160, 1178, 1179, 1182, 1183, 1186, 1187, 1190, 1191, 1192, 1196, 1197, 1204, 1215, 1225, 1233, 1239, 1243, 1254, 1255, 1259, 1286, 15 1287, 1290, 1291, 1311, 1318, 1322, 1328, 1342, 1426, 1428, 1440, 1442, 1448, 1452, 1455, 1456, 1497, 1511, 1554, 1576, 1595, 1597, 1624, 1625, 1633, 1640, 1641, 1645, 1657, 1661, 1898, 1906, 1914 e similares.

<Exemplo de Teste 6>

Teste sobre efeito protetor contra sementes de trigo *Septoria nodorum* (variedade: Norin Nº 61) foram semeadas em cada xícara de plástico tendo um diâmetro de 5,5 cm e deixadas desenvolver durante 9 dias em uma estufa. O pó umectável preparado de acordo com Exemplo de Formulação 1 foi diluído em água de maneira que uma concentração de ingrediente ativo seja 500 ppm, um dispersante (Kumiten) foi adicionado para o fator de 20 diluição ser 3.000 vezes e o agente resultante foi vaporizado ao trigo em um estágio de duas folhas na quantidade de 20 ml por uma xícara. Após secagem por ar, as plantas foram inoculadas por vaporização com uma suspensão de *pycnidiospore* de *Septoria nodorum*. As plantas inoculadas foram imediatamente colocadas em uma câmara úmida a 25°C (umidade relativa 30 de 100%) durante 48 horas. A seguir, as plantas foram transferidas para uma estufa. 9 dias depois, os índices de desenvolvimento de doença de primeiras folhas para todos os potes foram examinados de acordo com o pa-

drão no Exemplo de Teste 3, uma severidade da doença foi determinada utilizando a Expressão no Exemplo de Teste 3 e um nível de controle (%) foi calculado utilizando a Expressão no Exemplo de Teste 3. De acordo com este teste, compostos fornecendo um nível de controle de 100% foram os

5 compostos N^{os}: 0002, 0006, 0009, 0010, 0014, 0018, 0025, 0029, 0049, 0133, 0147, 0162, 0163, 0166, 0167, 0178, 0179, 0182, 0186, 0187, 0191, 0194, 0198, 0232, 0241, 0242, 0245, 0249, 0253, 0259, 0300, 0312, 0313, 0316, 0328, 0329, 0332, 0341, 0349, 0350, 0351, 0367, 0384, 0385, 0401, 0710, 0732, 0764, 0772, 5 0775, 0776, 0791, 0799, 0812, 0860, 0868, 0907, 0908, 0915, 0916, 0919, 0921, 0953, 0962, 0963, 0966, 0967, 0970, 0979,

10 0990, 0994, 1000, 1008, 1062, 1065, 1087, 1085, 1087, 1093, 1115, 1178, 1182, 1183, 1186, 1187, 1190, 1225, 1263, 1286, 1290, 1318, 1322, 1342, 1426, 1452, 1459, 1511, 1533, 1595, 1640, 1641, 1644, 1898, 1906, 1918, 1794 e similares. O Composto Comparativo 1 não exibiu um efeito de controle e o Composto Comparativo 2 mostrou um nível de controle de 75%.

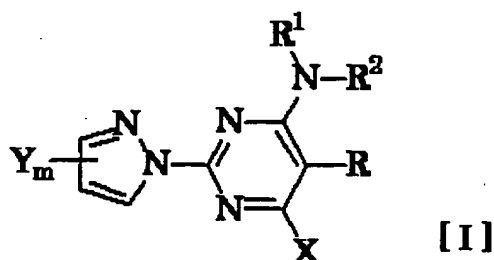
15

Aqui, Compostos Comparativos 1 e 2 mencionados acima são Composto N^o 1-1693 descrito em JP-A N^o 2005-232081 e Composto N^o 182 descrito em JP-A N^o S54-115384, respectivamente.

REIVINDICAÇÕES

1. Agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural, que é caracterizado por conter como um ingrediente ativo um ou mais compostos selecionados de derivados de aminopirimidina representados pela Fórmula Geral [I]:

[Fórmula Química 1]



em que

- R é um grupo C₁₋₁₀ alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C₁₋₃ alquila, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C₂₋₆ alquênila, um grupo C₂₋₆ alquinila, um grupo C₃₋₈ cicloalquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ hidroxialquila, um grupo C₁₋₆ alcóxi C₁₋₆ alquila, um grupo 1,3-dioxolan-2-ila ou um grupo 1,3-dioxan-2-ila;

- R¹ e R² são cada qual independentemente um átomo de hidrogênio, um grupo C₁₋₁₀ alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituinte α, um grupo C₁₋₁₀ alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituinte α, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₂₋₆ alquênila, um grupo C₂₋₆ alquinila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, enquanto R¹ e R² podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituinte α) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de

exofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R^1 e R^2 são ligados;

X é um átomo de hidrogênio ou um substituinte selecionado do Grupo Substituinte α ;

Y é um substituinte selecionado do Grupo Substituinte α ; e m é um número inteiro de 0 a 3, enquanto o Grupo Substituinte α sendo definido como segue:

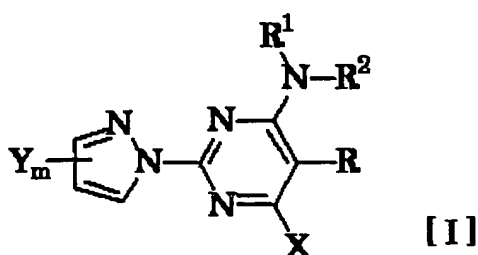
"Grupo Substituinte α ":

um átomo de halogênio, um grupo C₁₋₁₀ alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C1-3 alquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquenila, um grupo C1-10 alcóxi, um grupo C₁₋₆ alcóxi C1-3 alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquilóxi, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C1-3 alquilóxi, um grupo C₁₋₆ haloalcóxi, um grupo C2-6 alquinilóxi, um grupo C2-6 alqueni-
lóxi, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C₁₋₆ alquiltio, um grupo C₁₋₆ alquil-
sulfonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquiltio, um grupo
C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo ciano, um
grupo amino, um grupo nitro, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ hidroxilalqui-
la, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)amino, um grupo di(C₁₋₆ alquil) amino, um gru-
po C₁₋₆ acila, um grupo carboxila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo
carbamoila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ al-
quil)aminocarbonila, um grupo tiol, um grupo tiocianato, um grupo tri(C₁₋₆ al-
quil)silila, um grupo benzilóxi opcionalmente substituído, um grupo hidroxii-
minometila, um grupo C₁₋₆ alcoxiiminometila e um grupo fenila opcionalmente
substituído e sais agricolamente aceitáveis destes.

2. Derivado de aminopirimidina representado pela Fórmula Geral

[I]:

[Fórmula Química 2]



em que

R é um grupo C₂₋₁₀ alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C1-3 alquila, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C2-6 alquênica, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C₃₋₈ cicloalquênica, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ hidroxialquila, um grupo C₁₋₆ alcóxi C₁₋₆ alquila, um grupo
 5 1,3-dioxolin-2-ila ou um grupo 1,3-dioxan-2-ila;

R¹ e R² são cada qual independentemente um átomo de hidrogênio, um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituinte α , um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do
 10 Grupo Substituinte α , um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquênica, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila, um grupo carbamoila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo
 15 sulfamoila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, enquanto R¹ e R² podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituinte α) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo
 20 de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R¹ e R² são ligados;

X é um átomo de hidrogênio ou um substituinte selecionado do Grupo Substituinte α ;

Y é um substituinte selecionado do Grupo Substituinte α ; e
 25 m é um número inteiro de 0 a 3, ao mesmo tempo que o Grupo Substituinte α sendo definido como segue:

"Grupo Substituinte α ":

um átomo de halogênio, um grupo C1-10 alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C1-3 alquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquênica, um grupo C1-10 alcóxi, um grupo C₁₋₆ alcóxi C1-3 alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquilóxi, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C1-3 alquilóxi, um grupo C₁₋₆ haloalcóxi, um grupo C2-6 alquinilóxi, um grupo C2-6 alqueni-
 30

lói, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C₁₋₆ alquiltio, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquiltio, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo ciano, um grupo amino, um grupo nitro, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ hidroxilalquila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)amino, um grupo di(C₁₋₆ alquil) amino, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo carboxila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo tiol, um grupo tiocianato, um grupo tri(C₁₋₆ alquil)silila, um grupo benzilói opcionalmente substituído, um grupo hidroximinometila, um grupo C₁₋₆ alcoxiiminometila e um grupo fenila opcionalmente substituído ou um sal agricolamente aceitável destes.

3. Derivado de aminopirimidina ou um sal agricolamente aceitável deste de acordo com a Reivindicação 2, em que,

na Fórmula Geral [I],

R¹ é um átomo de hidrogênio, um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituinte α , um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituinte α , um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila e

R² é um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituinte α , um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituinte α , um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfa-

moíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, enquanto R¹ e R² podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituente α) com
 5 um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R¹ e R² são ligados.

4. Derivado de aminopirimidina ou um sal agricolamente aceitável deste de acordo com a Reivindicação 2,

10 em que, na Fórmula Geral [I],

R¹ é um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituente β , um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituente α , um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C2-6 alquinila,
 15 um grupo C2-6 alquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil) aminossulfonila ou um grupo
 20 di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila e

R² é um átomo de hidrogênio, um grupo C1-10 alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituente α , um grupo C1-10 alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituente α , um grupo C₃₋₈ cicloalquila,
 25 la, um grupo C2-6 alquinila, um grupo C2-6 alquenila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcoxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila ou
 30 um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, enquanto R¹ e R² podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros é independentemente substituído com 1 a 4 átomos de halogênio e/ou um

grupo C₁₋₆ haloalquila) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R¹ e R² são ligados,

5 onde o Grupo Substituente β é definido como segue:

"Grupo Substituente β ":

um átomo de halogênio, um grupo C₂₋₆ alquilila, um grupo C₃₋₈ cicloalquilóxi, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C₁₋₃ alquilóxi, um grupo C₁₋₆ haloal-
cói, um grupo C₂₋₆ alquililóxi, um grupo C₂₋₆ alquênilóxi, um grupo C₁₋₆
10 haloalquila, um grupo C₁₋₆ alquiltio, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquiltio, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo ciano, um grupo nitro, um
grupo C₁₋₆ acila, um grupo carboxila, um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila, um grupo carbamoila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆
15 alquil)aminocarbonila e um grupo tri(C₁₋₆ alquil)silila.

5. Derivado de aminopirimidina ou um sal agricolamente aceitável deste de acordo com a Reivindicação 2, em que, na Fórmula Geral [I],

R¹ é um átomo de hidrogênio, um grupo C₁₋₁₀ alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substi-
20 tuinte α , um grupo C₁₋₁₀ alcói que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituente α , um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₂₋₆ alquilila, um grupo C₂₋₆ alquênila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo hidroxila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila, um grupo carbamoila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila,
25 um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoila, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila
e

R² é um átomo de hidrogênio, um grupo C₁₋₁₀ alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substi-
30 tuinte β , um grupo C₁₋₁₀ alcói que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados de Grupo Substituente α , um grupo C₂₋₆ alquilila,

um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcoxi-carbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila ou um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, enquanto R¹ e R² podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros é independentemente substituído com 1 a 4 átomos de halogênio e/ou um grupo C₁₋₆ haloalquila) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R¹ e R² são ligados, onde o Grupo Substituente β é definido como segue:

"Grupo Substituente β":

um átomo de halogênio, um grupo C₂₋₆ alquinila, um grupo C₃₋₈ cicloalquilóxi, um grupo C₃₋₈ cicloalquil C₁₋₃ alquilóxi, um grupo C₁₋₆ haloalcóxi, um grupo C₂₋₆ alquinilóxi, um grupo C₂₋₆ alquenilóxi, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C₁₋₆ alquiltio, um grupo C₁₋₆ alquilsulfinila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquiltio, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfinila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo ciano, um grupo nitro, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo carboxila, um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila e um grupo tri(C₁₋₆ alquil)silila.

6. Derivado de aminopirimidina ou um sal agricolamente aceitável deste de acordo com a Reivindicação 5, em que, na Fórmula Geral [I],

R² é um grupo C₁₋₁₀ alquila que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituente β, um grupo C₁₋₁₀ alcóxi que pode ser substituído com um ou mais substituintes selecionados do Grupo Substituente α, um grupo C₂₋₆ alquinila, um grupo C₁₋₆ acila, um grupo C₁₋₆ haloalquilcarbonila, um grupo C₁₋₆ alcóxicarbonila, um grupo carbamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonila, um grupo C₁₋₆ alquilsulfonila, um grupo C₁₋₆ haloalquilsulfonila, um grupo sulfamoíla, um grupo mono(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila ou

- um grupo di(C₁₋₆ alquil)aminossulfonila, enquanto que R¹ e R² podem formar um anel de 5 membros ou 6 membros (o anel de 5 membros ou 6 membros é independentemente substituído com 1 a 4 átomos de halogênio e/ou um grupo C₁₋₆ haloalquila) com um átomo arbitrariamente selecionado do grupo
- 5 consistindo em um átomo de carbono, um átomo de oxigênio, um átomo de nitrogênio e um átomo de enxofre, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual R¹ e R² são ligados.

7. Agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural, que é caracterizado por conter como um ingrediente ativo, um
- 10 ou mais compostos selecionados do derivado de aminopirimidina como definido em qualquer uma das reivindicações 2 a 6 e um sal agricolamente aceitável destes.

8. Método de utilizar um agente, que inclui aplicar uma quantidade eficaz de um ou mais compostos selecionados do derivado de aminopirimidina como definido em qualquer uma das reivindicações 2 a 6, e um sal agricolamente aceitável destes, para alvejar colheitas úteis ou solo, para proteger as colheitas úteis de doença de planta.
- 15

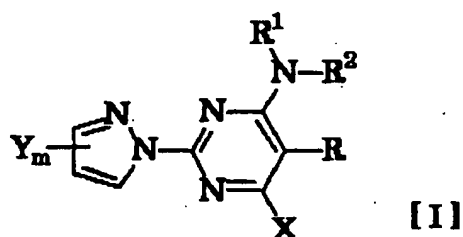
RESUMO

Patente de Invenção: "DERIVADO DE AMINOPYRIMIDINA E AGENTE DE CONTROLE DE DOENÇA DE PLANTA PARA USO AGRÍCOLA OU HORTICULTURAL".

5 A presente invenção refere-se a um derivado de aminopirimidina que exiba um efeito significativo sobre uma doença de planta e um agente de controle de doença de planta para uso agrícola ou horticultural que contém como um ingrediente ativo o derivado de aminopirimidina.

um agente de controle de doença de planta caracterizado por
10 conter como um ingrediente ativo um ou mais compostos selecionados dos derivados de aminopirimidina representados pela Fórmula Geral [I]:

[Fórmula Química 1]



em que R é um substituinte tal como um grupo C2-10 alquila; R¹ e R² são
cada qual independentemente um átomo de hidrogênio ou um substituinte tal
15 como um grupo C1-10 alquila opcionalmente substituído; X é um átomo de
hidrogênio ou um substituinte selecionado do Grupo Substituinte predefinido;
Y é um substituinte selecionado de um Grupo Substituinte predefinido; e m é
um número inteiro de 0 a 3 e sais agricolamente aceitáveis destes.

O agente soluciona os problemas de agentes de controle de do-
20 ença de planta convencionais e também tem excelente efeito de controle,
eficácia residual e similares.