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

(21) **PI0615140-0 A2**

*BRPI0615140A2*

(22) Data de Depósito: 31/08/2006
**(43) Data da Publicação: 12/01/2010**
**(RPI 2036)**

***(51) Int.Cl.:***
**C07D 409/12 (2010.01)**
**C07D 333/54 (2010.01)**
**C07D 407/12 (2010.01)**
**C07D 413/12 (2010.01)**
**C07D 417/12 (2010.01)**
**A61K 31/559 (2010.01)**
**A61P 25/00 (2010.01)**

(54) Título: **COMPOSTO HETEROCÍCLICO OU UM SAL DO MESMO, COMPOSIÇÃO FARMACÊUTICA, PROCESSO PARA PRODUZIR A MESMA, USO DE UM COMPOSTO HETEROCÍCLICO OU UM SAL DO MESMO, MÉTODO PARA TRATAR OU PREVENIR UM DISTÚRBIO DO SISTEMA NERVOSO CENTRAL, E, PROCESSO PARA PRODUZIR UM COMPOSTO HETEROCÍCLICO**

(30) Prioridade Unionista: 31/08/2005 JP 2005-251055

(73) Titular(es): OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD

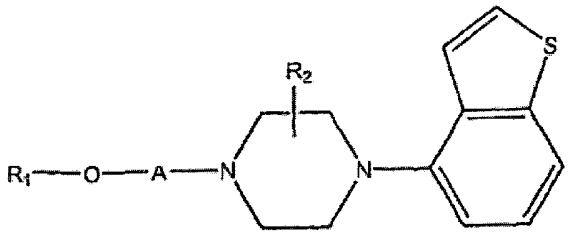
(72) Inventor(es): HARUKA TAKAHASHI, HIDEAKI KURODA, HIROSHI YAMASHITA, JUN MATSUBARA, KAZUMI KONDO, KUNIO OSHIMA, MOTOHIRO ITOTANI, NOBUAKI ITO, SATOSHI SHIMIZU, SHIN MIYAMURA, SHINICHI TAIRA, TAE FUKUSHIMA, TAKESHI KURODA, TATSUYOSHI TANAKA, YOHJI SAKURAI

(74) Procurador(es): Momsen, Leonardos & CIA.

(86) Pedido Internacional: PCT JP2006317704 de 31/08/2006

(87) Publicação Internacional: WO 2007/026959de 08/03/2007

(57) Resumo: COMPOSTO HETEROCÍCLICO OU UM SAL DO MESMO, COMPOSIÇÃO FARMACÊUTICA, PROCESSO PARA PRODUZIR A MESMA, USO DE UM COMPOSTO HETEROCÍCLICO OU UM SAL DO MESMO, MÉTODO PARA TRATAR OU PREVEMR UM DISTÚRBIO DO SISTEMA NERVOSO CENTRAL, E, PROCESSO PARA PRODUZIR UM COMPOSTO HETEROCÍCLICO. É descrito um composto heterocíclico ou um sal do mesmo representado pela fórmula (1): [Fórmula 1] onde $R^2$ representa um átomo de hidrogénio ou um grupo alquila inferior; A representa um grupo alquileno inferior ou grupo alquileno inferior; e $R^1$ representa um grupo aromático ou um grupo heterocíclico. O composto da presente invenção tem um amplo espectro de tratamento para distúrbios mentais incluindo outros distúrbios do sistema nervoso central, nenhum efeito colateral e alta segurança.



PI0615140-0



"COMPOSTO HETEROCÍCLICO OU UM SAL DO MESMO, COMPOSIÇÃO FARMACÊUTICA, PROCESSO PARA PRODUZIR A MESMA, USO DE UM COMPOSTO HETEROCÍCLICO OU UM SAL DO MESMO, MÉTODO PARA TRATAR OU PREVENIR UM DISTÚRBIO DO SISTEMA NERVOSO CENTRAL, E, PROCESSO PARA PRODUZIR UM COMPOSTO HETEROCÍCLICO"

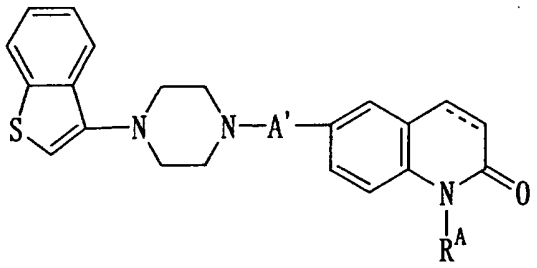
CAMPO TÉCNICO

A presente invenção diz respeito a um composto heterocíclico inédito.

FUNDAMENTOS DA TÉCNICA

Uma vez que o fator de causa da esquizofrenia, bem como distúrbio bipolar, distúrbios de humor e distúrbios emocionais é heterogêneo, deseja-se que um medicamento tenha múltiplos efeitos farmacológicos de maneira a desenvolver amplo espectro de tratamento.

WO2004/026864A1 descreve que um derivado de carboestirila representado pela fórmula geral:

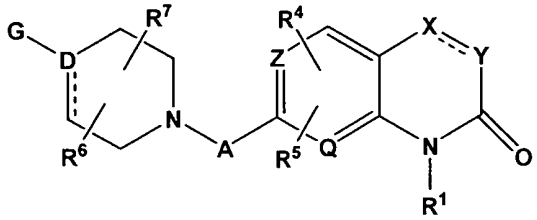


(em que A' representa $-(CH_2)_mCH_2-$, $-(CH_2)_mO-$, etc.; m representa um número inteiro de 1 a 4; e $R^A$ representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila C1-4 que pode ser substituído por 1 a 3 átomos de flúor, etc.) tem atividade antagonista do receptor $D_2$ e atividade antagonista do receptor de serotonina 2A ($5\text{-}HT_{2A}$) e é efetivo para o tratamento de esquizofrenia e outros distúrbios do sistema nervoso central).

Entretanto, não existe descrição em WO2004/026864A1 que derivados de carboestirila descritos no documento tenham atividade agonista

parcial do receptor $D_2$, atividade antagonista do receptor 5-$HT_{2A}$, atividade antagonista do receptor $\alpha_1$ e atividade inibitória da absorção de serotonina juntos e tenham um amplo espectro de tratamento.

WO 2005/019215 A1 descreve os compostos representados pela seguinte fórmula:




(em que A é $-(CH_2)_mCH_2-$, $-(CH_2)_mO-$ou similares; m é um número inteiro de 2 a 5; D é N, C ou similares; Z e Q são independentemente N, C ou CH, desde que pelo menos um de Z e Q seja N; X e Y são independentemente C, N ou similares, e a ligação entre X e Y é uma ligação simples ou dupla; $R^1$ é hidrogênio, grupo alquil($C_1$-$C_3$) ou similares; $R^4$, $R^5$, $R^6$ e $R^7$ cada representa hidrogênio, grupo alquila ou similares; e G representa um grupo de composto monocíclico ou bicíclico ), que se liga aos receptores de dopamina $D_2$. WO 2005/019215 A1 preceitua que alguns compostos descritos nela têm uma atividade como agonistas parciais de receptores $D_2$ ou uma atividade como antagonistas de receptores $D_2$, e podem ser efetivos para o tratamento de esquizofrenia e outros distúrbios do sistema nervoso central.

Entretanto, WO 2005/019215 não descreve especificamente os compostos da presente invenção.

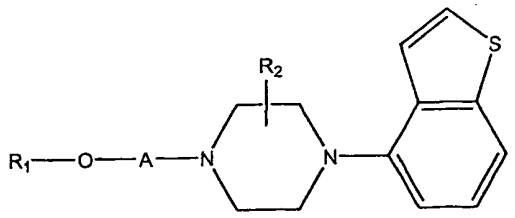
DESCRIÇÃO DA INVENÇÃO

Um objetivo da presente invenção é fornecer um medicamento antipsicótico que tenha um espectro de tratamento mais amplo, menos efeitos colaterais e excelente tolerabilidade e segurança comparado aos medicamentos antipsicóticos típicos e atípicos bem conhecidos.

Os presentes inventores conduziram estudos intensivos a respeito do problema descrito anteriormente e conseqüentemente tiveram sucesso na síntese de um composto inédito que tem atividade agonista parcial

do receptor de dopamina D2 (atividade agonista parcial do receptor D2), atividade antagonista do receptor de serotonina 5-HT2A (atividade antagonista do receptor 5-$HT_{2A}$) e atividade antagonista do receptor $\alpha_1$ adrenalina (atividade antagonista do receptor $\alpha_1$) e adicionalmente tem efeito inibitório da absorção da serotonina (ou efeito inibitório da reabsorção da serotonina) juntos, além destes efeitos. A presente invenção foi completada com base nestas observações.

É fornecido um composto heterocíclico ou um sal do mesmo representado pela fórmula (1):




(1)

onde $R^2$ representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila inferior;

A representa um grupo alquileno inferior ou grupo alquenileno inferior; e

$R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (IV) a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$;

(II) um grupo aromático selecionado de um grupo fenila, um grupo naftila, um grupo diidroindenila e um grupo tetraidronaftila;

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, um átomo de oxigênio e um átomo de enxofre; e

(IV) um grupo heterocíclico fundido a benzeno que tem 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, um átomo de oxigênio e um átomo de enxofre e que é selecionado do grupo

que consiste em (1) um grupo tetraidroquinoxalinila, (2) um grupo tetraidroquinazolinila, (3) um grupo diidroquinazolinila, (4) um grupo indolinila, (5) um grupo indolila, (6) um grupo isoindolinila, (7) um grupo benzimidazolila, (8) um grupo diidrobenzimidazolila, (9) um grupo tetraidrobenzazepinila, (10) um grupo tetraidrobenzodiazepinila, (11) um grupo hexaidrobenzazocinila, (12) um grupo diidrobenzoxazinila, (13) um grupo diidrobenzoxazolila, (14) um grupo benzisoxazolila, (15) um grupo benzoxadiazolila, (16) um grupo tetraidrobenzoxazepinila, (17) um grupo diidrobenzotiazinila, (18) um grupo benzotiazolila, (19) um grupo benzoxatiolila, (20) um grupo cromenila, (21) um grupo diidrobenzofurila, (22) um grupo carbazolila, (23) um grupo dibenzofurila e (24) um grupo quinoxalinila

em que pelo menos um grupo selecionado do grupo que consiste nos grupo (1) a (66) a seguir pode estar presente como um substituinte no grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, no grupo aromático e no grupo heterocíclico representados por $R^1$:

(1) um grupo alquila inferior,

(2) um grupo alquenila inferior,

(3) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(5) um grupo arilóxi,

(6) um grupo alquiltio inferior,

(7) um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio,

(8) um grupo hidróxi,

(9) um grupo hidróxi protegido,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(11) um grupo hidróxi alquila inferior protegido,

(12) um átomo de halogênio,

(13) um grupo ciano,

(14) um grupo arila,

(15) um grupo nitro,

(16) um grupo amino,

(17) um grupo amino tendo um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alquil inferior carbamoíla, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcóxi carbonil inferior amino alcanoíla inferior como um substituinte,

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(19) um grupo aril sulfonila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo arila,

(20) um grupo carbóxi,

(21) um grupo alcoxicarbonila inferior,

(22) um grupo carbóxi alquila inferior,

(23) um grupo alcoxicarbonila inferior alquila inferior,

(24) um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(25) um grupo carbóxi alquenila inferior,

(26) um grupo alcoxicarbonila inferior alquenila inferior,

(27) um grupo carbamoil alquenila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio como um substituinte,

(28) um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste nos grupo (i) a (lxxviii) a seguir como um substituinte:

(i) um grupo alquila inferior,

(ii) um grupo alcóxi inferior,

(iii) um grupo hidróxi alquila inferior,

(iv) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(v) um grupo arilóxi alquila inferior,

(vi) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(vii) um grupo amino alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo aroíla e um grupo carbamoíla,

(viii) um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo fenil alcóxi inferior como um substituinte,

(ix) um grupo alquila inferior substituído por cicloalquila $C_3$-$C_8$,

(x) um grupo alquenila inferior,

(xi) um grupo carbamoil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo fenila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior e um(s) grupo(s) fenila que pode ter um(s) grupo(s) alcóxi inferior como um substituinte,

(xii) um grupo alcoxicarbonila inferior alquila inferior,

(xiii) um grupo furil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte) no grupo furila,

(xiv) um grupo tetraidrofuril alquila inferior,

(xv) um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior,

(xvi) um grupo tetraidropiranil alquila inferior,

(xvii) um grupo pirrolil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo pirrolila),

(xviii) um grupo alquila inferior substituído por um grupo diidropirazolila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(xix) um grupo pirazolil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo pirazolila),

(xx) um grupo imidazolil alquila inferior,

(xxi) um grupo piridil alquila inferior,

(xxii) um grupo pirazinil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo pirazinila),

(xxiii) um grupo pirrolidinil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um(s) grupo(s) oxo e um grupo alquila inferior como um substituinte no grupo pirrolidinila),

(xxiv) um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo benzoíla e um grupo alcanoíla inferior como um substituinte no grupo piperidinila),

(xxv) um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo piperazinila),

(xxvi) um grupo morfolinil alquila inferior,

(xxvii) um grupo tienil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo tienila),

(xxviii) um grupo tiazolil alquila inferior,

(xxix) um grupo diidrobenzofuril alquila inferior,

(xxx) um grupo benzopiranil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) oxo como um substituinte no grupo benzopiranila),

(xxxi) um grupo benzimidazolil alquila inferior,

(xxxii) um grupo indolil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior),

(xxxiii) um grupo imidazolil alquila inferior que tem um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior,

(xxxiv) um piridila grupo que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquiltio inferior alquila inferior como um substituinte,

(xxxv) um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s)

selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla como um substituinte,

(xxxvi) um grupo piperidila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um átomo de halogênio como um substituinte,

(xxxvii) um grupo tetraidrofurila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(xxxviii) um grupo hexaidroazepinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(xxxix) um grupo pirazolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo arila e um grupo furila como um substituinte,

(xl) um grupo tiazolila,

(xli) um grupo tiadiazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(xlii) um grupo isoxazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(xliii) um grupo indazolila,

(xliv) um grupo indolila,

(xlv) um grupo tetraidrobenzotiazolila,

(xlvi) um grupo tetraidroquinolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um átomo de halogênio e um grupo oxo como um substituinte,

(xlvii) um grupo quinolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(xlviii) um grupo benzodioxolil alquila inferior,

(xlix) um grupo arila que pode ter um(s) grupo(s) como um substituinte, selecionado do grupo que consiste em

um átomo de halogênio; um grupo alquila inferior; um grupo alcóxi inferior; um grupo alquila inferior substituído por halogênio; um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio; um grupo alquenila inferior; um grupo amino que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo alquila inferior e um grupo arila; um grupo sulfamoíla; um grupo alquiltio inferior; um grupo alcanoíla inferior; um grupo alcoxicarbonila inferior; um grupo pirrolila; um grupo alquinila inferior; um grupo ciano; um grupo nitro; um grupo arilóxi; um grupo aril alcóxi inferior; um grupo hidróxi; um grupo hidróxi alquila inferior; um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo arila; um grupo pirazolila; um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo; um grupo oxazolila; um grupo imidazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior; um grupo diidrofurila que pode ter um(s) grupo(s) oxo; um grupo tiazolidinil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) oxo; um grupo imidazolil alcanoíla inferior e um grupo piperidinil carbonila,

(l) um grupo ciano alquila inferior,

(li) um grupo diidroquinolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo oxo,

(lii) um grupo alquil inferior amino substituído por halogênio,

(liii) um grupo alquiltio inferior alquila inferior,

(liv) um grupo amidino que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(lv) um grupo amidino alquila inferior,

(lvi) um grupo alquenil inferioróxi alquila inferior,

(lvii) um grupo arilamino que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, no grupo arila,

(lviii) um grupo aril alquenila inferior,

(lix) um grupo piridilamino que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(lx) um grupo aril alquila inferior (que pode ter no grupo arila e/ou no grupo alquila inferior um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior, um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior como um substituinte),

(lxi) um grupo alquinila inferior,

(lxii) um grupo arilóxi alquila inferior (que pode ter como um substituinte no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior; um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior; e um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo),

(lxiii) um grupo isoxazolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(lxiv) um grupo diidroindenila,

(lxv) um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior,

(lxvi) um grupo tetraidropiranila,

(lxvii) um grupo azetidinila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla,

(lxviii) um grupo azetidinil alquila inferior que pode ter um(s)

grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e grupo aroíla,

(lxix) um grupo tetrazolila,

(lxx) um grupo indolinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(lxxi) um grupo triazolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquiltio inferior,

(lxxii) um grupo imidazolila que pode ter um(s) grupo(s) carbamoíla,

(lxxiii) um grupo oxazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(lxxiv) um grupo isotiazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(lxxv) um grupo benzimidazolila,

(lxxvi) um grupo diidrobenzotiazolila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(lxxvii) um grupo tienila que pode ter um(s) grupo(s) alcoxicarbonila inferior, e

(lxxviii) um grupo oxazolil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior

(29) um grupo amino alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior, um grupo aroíla e um grupo alquila substituídos por amino (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo amino) no grupo amino,

(30) um grupo alquila inferior substituído por um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste

em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(31) um grupo tiocarbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(32) um grupo sulfamoíla,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(34) um grupo imidazolidinila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(36) um grupo imidazolila,

(37) um grupo triazolila,

(38) um grupo isoxazolila,

(39) um grupo piperidila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo aril sulfonila, um grupo oxo, um grupo hidróxi, e um grupo amino que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(40) um grupo piperidil carbonila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo carbóxi alquila inferior, um grupo alquil inferior carbamoil alquila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alcóxi inferior, um grupo carbóxi, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino (em que 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo aroíla podem estar presentes), um grupo piperidila (em que um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um

grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo aroíla pode estar presente), grupo piperazinila (em que um(s) grupo(s) alquila inferior pode estar presente como um substituinte), um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decila, um grupo morfolinila, um grupo hexaidro-1,4-diazepinila (em que um(s) grupo(s) alquila inferior pode estar presente como um substituinte), um grupo piridila, um grupo piridilóxi, um grupo piridil alcóxi inferior, um grupo tetraidroquinolila (em que um(s) grupo(s) oxo pode estar presente), um grupo benzodioxolila, um grupo aril alcóxi inferior (que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio no grupo arila), um grupo arila (em que um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alcóxi inferior, um grupo hidróxi pode estar presente), um grupo arilóxi (que pode ter no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo ciano, um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio), um grupo aril alquila inferior (que pode ter no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio), e um grupo aroíla (que pode ter no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alcóxi inferior),

(41) um grupo pirrolidinil carbonila que pode ter um grupo como um substituinte, selecionado do grupo que consiste em um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo hidróxi, um grupo amino (que pode ter no grupo amino um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior, um grupo piperazinil

alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo piperazinila), um grupo amino alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo amino), um grupo arilóxi (que pode ter um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio(s) no grupo arila), um grupo arilóxi alquila inferior (que pode ter um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio(s) no grupo aril) e um grupo tetraidroquinolila (em que um(s) grupo(s) oxo pode estar presente),

(42) um grupo piperazinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) como um substituinte, selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, um grupo alcanoíla inferior, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo amino), um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo piperidinila), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior, um grupo tetraidrofuril alquila inferior, um grupo piridil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) fenila como um substituinte no grupo alquila inferior), um grupo imidazolil alquila inferior, um grupo furil alquila inferior, um grupo pirrolidinil carbonil alquila inferior, um grupo piperidila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte, grupo piridila (que pode ter no grupo piridila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo ciano e um grupo alquila inferior substituído por halogênio como um substituinte), um grupo tieno[2,3-b] piridila, um grupo arila (em que um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alquila inferior pode estar presente), um grupo aroíla, um furil carbonila grupo, um arila grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo oxo,

(43) um grupo hexaidroazepinil carbonila,

(44) um grupo hexaidro-1,4-diazepinil carbonila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo piridila,

(45) um grupo diidropirrolil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(46) um grupo tiomorfolinil carbonila,

(47) um grupo morfolinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior e um grupo arila,

(48) um grupo tiazolidinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) arila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo ciano,

(49) um grupo azabiciclo[3.2.2]nonil carbonila,

(50) um grupo 8-azabiciclo[3.2.1]octil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) arila substituído ou não substituído por halogênio,

(51) um grupo indolinil carbonila,

(52) um grupo tetraidroquinolil carbonila,

(53) um grupo tetraidropirido[3.4-b]indolil carbonila,

(54) um grupo morfolinil alquila inferior,

(55) um grupo piperazinil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo piperazinila,

(56) um grupo morfolinil carbonil alquila inferior,

(57) um grupo piperazinil carbonil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo piperazinila,

(58) um grupo oxo,

(59) um grupo amino alcóxi inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo amino),

(60) um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior,

(61) um grupo piperazinila que pode ter um(s) grupo(s)

selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior,

(62) um grupo morfolinila,

(63) um grupo 1,3,8-triazaspiro[4.5]decanil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo arila,

(64) um grupo tetraidropiridil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) piridila,

(65) um grupo imidazolidinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) tioxo, e

(66) um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decanila.

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que

$R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (IV) a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$;

(II) um grupo aromático selecionado de um grupo fenila, grupo naftila, grupo diidroindenila e grupo tetraidronaftila;

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico que tem 1 a 2 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, átomo de oxigênio e átomo de enxofre, e que é selecionado do grupo que consiste em um grupo pirrolidinila, grupo piperidila, grupo pirazolila, grupo piridila, grupo pirimidinila, grupo pirazinila, grupo isoxazolila, grupo tiazolila, grupo piranila, e grupo tienila; e

(IV) um grupo heterocíclico fundido a benzeno que tem 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, átomo de oxigênio e átomo de enxofre e que é selecionado do grupo que consiste em (1) um grupo tetraidroquinoxalinila, (2) um grupo

tetraidroquinazolinila, (3) um grupo diidroquinazolinila, (4) um grupo indolinila, (5) um grupo indolila, (6) um grupo isoindolinila, (7) um grupo benzimidazolinila, (8) um grupo diidrobenzimidazolila, (9) um grupo tetraidrobenzazepinila, (10) um grupo tetraidrobenzodiazepinila, (11) um grupo hexaidrobenzazocinila, (12) um grupo diidrobenzoxazinila, (13) um grupo diidrobenzoxazolila, (14) um grupo benzisoxazolila, (15) um grupo benzoxadiazolila, (16) um grupo tetraidrobenzoxazepinila, (17) um grupo diidrobenzotiazinila, (18) um grupo benzotiazolila, (19) um grupo benzoxatiolila, (20) um grupo cromenila, (21) um grupo diidrobenzofurila, (22) um grupo carbazolila, (23) um grupo dibenzofurila, e (24) um grupo quinoxalinila em que, no grupo aromático e no grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste nos grupo (1) a (66) a seguir podem estar presentes como um substituinte(s):

(1) um grupo alquila inferior,

(2) um grupo alquenila inferior,

(3) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(5) um grupo fenóxi,

(6) um grupo alquiltio inferior,

(7) um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio,

(8) um grupo hidróxi,

(9) um grupo fenil alcóxi inferior,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(11) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(12) um átomo de halogênio,

(13) um grupo ciano,

(14) um grupo fenila,

(15) um grupo nitro,

(16) um grupo amino,

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alquil inferior carbamoíla, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonil inferior amino alcanoíla inferior como um substituinte(s),

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(19) um grupo fenil sulfonila que pode ter um único grupo alquila inferior no grupo fenila,

(20) um grupo carbóxi,

(21) um grupo alcoxicarbonila inferior,

(22) um grupo carbóxi alquila inferior,

(23) um grupo alcoxicarbonila inferior alquila inferior,

(24) um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(25) um grupo carbóxi alquenila inferior,

(26) um grupo alcoxicarbonila inferior alquenila inferior,

(27) um grupo carbamoil alquenila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por 1 a 3 átomos de halogênio como um substituinte(s),

(28) um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste nos grupo (i) a (lxxviii) a seguir como um substituinte(s):

(i) um grupo alquila inferior,

(ii) um grupo alcóxi inferior,

(iii) um grupo hidróxi alquila inferior,

(iv) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(v) um grupo fenóxi alquila inferior,

(vi) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(vii) um grupo amino alquila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo benzoíla e um grupo carbamoíla,

(viii) um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo fenil alcóxi inferior como um substituinte(s),

(ix) um grupo alquila inferior substituído por cicloalquila $C_3$-$C_8$,

(x) um grupo alquenila inferior,

(xi) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos como um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo fenila que pode ter um único grupo alquila inferior e um grupo fenila que pode ter um único grupo alcóxi inferior,

(xii) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos alcóxi inferior carbonila,

(xiii) um grupo furil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo furila),

(xiv) um grupo tetraidrofuril alquila inferior,

(xv) um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior,

(xvi) um grupo tetraidropiranil alquila inferior,

(xvii) um grupo pirrolil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior no grupo pirrolila como um substituinte(s)),

(xviii) um grupo alquila inferior substituído por um grupo diidropirazolila que pode ter um único grupo oxo,

(xix) um grupo pirazolil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirazolila),

(xx) um grupo imidazolil alquila inferior,

(xxi) um grupo piridil alquila inferior,

(xxii) um grupo pirazinil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirazinila),

(xxiii) um grupo pirrolidinil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirrolidinila),

(xxiv) um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo benzoíla e um grupo alcanoíla inferior como um substituinte(s) no grupo piperidinila),

(xxv) um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo piperazinila),

(xxvi) um grupo morfolinil alquila inferior,

(xxvii) um grupo tienil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo tienila),

(xxviii) um grupo tiazolil alquila inferior,

(xxix) um grupo diidrobenzofuril alquila inferior,

(xxx) um grupo benzopiranil alquila inferior (que pode ter um único grupo oxo como um substituinte no grupo benzopiranila),

(xxxi) um grupo benzimidazolil alquila inferior,

(xxxii) um grupo indolil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior),

(xxxiii) um grupo imidazolil alquila inferior que tem 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior, no grupo alquila inferior,

(xxxiv) um grupo piridila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquiltio inferior alquila inferior como um

substituinte(s),

(xxxv) um grupo pirrolidinila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla como um substituinte(s),

(xxxvi) um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um átomo de halogênio como um substituinte(s) no grupo fenila),

(xxxvii) um grupo tetraidrofurila que pode ter um único grupo oxo

(xxxviii) um grupo hexaidroazepinila que pode ter um único grupo oxo,

(xxxix) um grupo pirazolila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo fenila e um grupo furila como um substituinte(s),

(xl) um grupo tiazolila,

(xli) um grupo tiadiazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(xlii) um grupo isoxazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(xliii) um grupo indazolila,

(xliv) um grupo indolila,

(xlv) um grupo tetraidrobenzotiazolila,

(xlvi) um grupo tetraidroquinolila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um átomo de halogênio e um grupo oxo como um substituinte(s),

(xlvii) um grupo quinolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(xlviii) um grupo benzodioxolil alquila inferior,

(xlix) um grupo fenila ou grupo naftila que pode ter 1 a 3 grupos como um substituinte(s), selecionado do grupo que consiste em

um átomo de halogênio; um grupo alquila inferior; um grupo alcóxi inferior; um grupo alquila inferior substituído por halogênio; um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio; um grupo alquenila inferior; um grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo alquila inferior e um grupo arila; um grupo sulfamoíla; um grupo alquiltio inferior; um grupo alcanoíla inferior; um grupo alcoxicarbonila inferior; pirrolila grupo; um grupo alquinila inferior; um grupo ciano; um grupo nitro; um grupo fenilóxi; um grupo fenil alcóxi inferior; um grupo hidróxi; um grupo hidróxi alquila inferior; um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo fenila; um grupo pirazolila; um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo; grupo oxazolila; um grupo imidazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior; um grupo diidrofurila que pode ter um único grupo oxo; grupo tiazolidinil alquila inferior que pode ter dois grupos oxo; grupo imidazolil alcanoíla inferior e grupo piperidinil carbonila,

(l) um grupo ciano alquila inferior,

(li) um grupo diidroquinolila que pode ter 1 a 3 grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e grupo oxo,

(lii) um grupo alquil inferior amino substituído por halogênio,

(liii) um grupo alquiltio inferior alquila inferior,

(liv) um grupo amidino que pode ter um grupo alquila inferior,

(lv) um grupo amidino alquila inferior,

(lvi) um grupo alquenil inferioróxi alquila inferior,

(lvii) um grupo fenilamino que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio no grupo fenila,

(lviii) um grupo fenil alquenila inferior,

(lix) um grupo piridilamino que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(lx) um grupo fenil alquila inferior (que pode ter como um substituinte(s) no grupo fenila e/ou o grupo alquila inferior 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior, grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior),

(lxi) um grupo alquinila inferior,

(lxii) um grupo fenilóxi alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior, grupo N-alcóxi inferior-N-alquil inferior carbamoíla e grupo oxo pirrolidinila como um substituinte(s) no grupo fenila),

(lxiii) um grupo isoxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(lxiv) um grupo diidroindenila,

(lxv) um grupo fenil alcóxi inferior alquila inferior,

(lxvi) um grupo tetraidropiranila,

(lxvii) um grupo azetidinila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e grupo benzoíla,

(lxviii) um grupo azetidinil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e

grupo benzoíla,

(lxix) um grupo tetrazolila,

(lxx) um grupo indolinila que pode ter um único grupo oxo,

(lxxi) um grupo triazolila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquiltio inferior,

(lxxii) um grupo imidazolila que pode ter 1 a 3 grupos carbamoíla,

(lxxiii) um grupo oxazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(lxxiv) um grupo isotiazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(lxxv) um grupo benzimidazolila,

(lxxvi) um grupo diidrobenzotiazolila que pode ter um único grupo oxo,

(lxxvii) um grupo tienila que pode ter 1 a 3 grupos alcoxicarbonila inferiores, e

(lxxviii) um grupo oxazolil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(29) um grupo amino alquila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo fenila, um grupo fenil alquila inferior, um grupo benzoíla e um grupo alquila substituído por amino (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo amino), no grupo amino,

(30) um grupo alquila inferior substituído por um único grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por

halogênio,

(31) um grupo tiocarbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior,

(32) um grupo sulfamoíla,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(34) um grupo imidazolidinila que pode ter 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(36) um grupo imidazolila,

(37) um grupo triazolila,

(38) um grupo isoxazolila,

(39) um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquil inferior fenil sulfonila, um grupo oxo, um grupo hidróxi, e um grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(40) um grupo piperidil carbonila que pode ter 1 a 3 substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo carbóxi alquila inferior, um grupo alquil inferior carbamoil alquila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alcóxi inferior, um grupo carbóxi, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino (em que 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo benzoíla pode estar presente), um grupo piperidila (em que 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo

alcoxicarbonila inferior e um grupo benzoíla pode estar presente), um grupo piperazinila (em que 1 a 3 grupos alquila inferior podem estar presentes como um substituinte(s)), um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decila, um grupo morfolinila, um grupo hexaidro-1,4-diazepinila (em que um único grupo alquila inferior pode estar presente como um substituinte), um grupo piridila, um grupo piridilóxi, um grupo piridil alcóxi inferior, um grupo tetraidroquinolila (em que um único grupo oxo pode estar presente), um grupo benzodioxolila, um grupo fenil alcóxi inferior (que pode ter no grupo fenila 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio), um grupo fenila (em que 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alcóxi inferior e um grupo hidróxi pode estar presente), grupo fenilóxi (que pode ter no grupo fenila 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo ciano, um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio), um grupo fenil alquila inferior (no grupo fenila, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio pode estar presente), e um grupo benzoíla (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alcóxi inferior no grupo fenila),

(41) um grupo pirrolidinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos como um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo hidróxi alquila inferior, grupo carbamoíla, um grupo hidróxi, um grupo amino (que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla no grupo amino), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior, um grupo piperazinil alquila

inferior (que pode ter um único grupo alquila inferior como um substituinte no grupo piperazinila), um grupo amino alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior podem estar presentes como um substituinte no grupo amino), grupo fenilóxi (que pode ter 1 a 3 grupos alcóxi inferior substituídos por halogênios no grupo fenila), um grupo fenilóxi alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupo alcóxi inferior substituído por halogênios no grupo fenil) e um grupo tetraidroquinolila (em que um grupo oxo pode estar presente),

(42) um grupo piperazinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos como um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, um grupo alcanoíla inferior, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo amino), um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo piperidinila), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo 1,3-dioxoranil alquila inferior, um grupo tetraidrofuril alquila inferior, um grupo piridil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos fenila como um substituinte(s) no grupo alquila inferior), um grupo imidazolil alquila inferior, um grupo furil alquila inferior, um grupo pirrolidinil carbonil alquila inferior, um grupo piperidila que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s)), um grupo piridila (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo ciano e um grupo alquila inferior substituído por halogênio como um substituinte(s) no grupo piridila), um grupo tieno[2,3-b] piridila, um grupo fenila (em que 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alquila inferior pode estar presente), um grupo benzoíla, um furil carbonila grupo, um grupo fenila alcoxicarbonila inferior e um grupo oxo,

(43) um grupo hexaidroazepinil carbonila,

(44) um grupo hexaidro-1,4-diazepinil carbonila que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo piridila,

(45) um grupo diidropirrolil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(46) um grupo tiomorfolinil carbonila,

(47) um grupo morfolinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior e um grupo fenila,

(48) um grupo tiazolidinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos fenila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo ciano,

(49) um grupo azabiciclo[3.2.2]nonil carbonila,

(50) um grupo 8-azabiciclo[3.2.1]octil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos fenilóxi substituídos ou não substituídos por halogênio,

(51) um grupo indolinil carbonila,

(52) um grupo tetraidroquinolil carbonila,

(53) um grupo tetraidropirido[3.4-b]indolil carbonila,

(54) um grupo morfolinil alquila inferior,

(55) um grupo piperazinil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior no grupo piperazinila,

(56) um grupo morfolinil carbonil alquila inferior,

(57) um grupo piperazinil carbonil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior no grupo piperazinila,

(58) um grupo oxo,

(59) um grupo amino alcóxi inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior no grupo amino),

(60) um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior,

(61) um grupo piperazinila que pode ter 1 a 3 grupos

selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior,

(62) um grupo morfolinila,

(63) um grupo 1,3,8-triazaspiro[4.5]decanil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo fenila,

(64) um grupo tetraidropiridil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos piridila,

(65) um grupo imidazolidinil carbonila que pode ter um único grupo tioxo, e

(66) um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decanila.

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que A é um grupo alquileno inferior.

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que $R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (III) apresentado a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$;

(II) um grupo fenila; e

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado do grupo que consiste em um grupo pirrolidinila, um grupo piperidila, um grupo pirazolila, um grupo piridila, grupo pirimidinila e um grupo tiazolila, e

no grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, o grupo aromático e o grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que $R^1$ representa (I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, e, no

grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$ representado por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que $R^1$ representa (II) um grupo fenila, e, no grupo aromático representado por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que $R^1$ representa (III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado de um grupo pirrolidinila, um grupo piperidila, grupo pirazolila, um grupo piridila, um grupo pirimidinila e um grupo tiazolila, e, no grupo heterocíclico representado por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que $R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (III) apresentado a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$;

(II) um grupo fenila; e

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado de um grupo pirrolidinila, um grupo piperidila, um grupo pirazolila, um grupo piridila, um grupo pirimidinila e um grupo tiazolila, e

no grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, grupo aromático e grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) apresentados a seguir podem estar presentes como um

substituinte(s):

(1) um grupo alquila inferior,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alquil inferior carbamoíla, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonil inferior amino alcanoíla inferior, como um substituinte(s),

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(21) um grupo alcoxicarbonila inferior,

(28) um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste nos grupo (i), (ii), (iv), (xii) e (xxi) a seguir como um substituinte(s):

(i) um grupo alquila inferior,

(ii) um grupo alcóxi inferior,

(iv) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(xii) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos alcóxi inferior carbonila,

(xxi) um grupo piridil alquila inferior,

(29) um grupo amino alquila inferior que pode ter, no grupo amino, 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo fenila, um grupo fenil alquila inferior, um grupo benzoíla e um grupo alquila inferior substituído por amino (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior podem estar presentes como um substituinte(s) no grupo amino),

(30) um grupo alquila inferior substituído por um único grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(34) um grupo imidazolidinila que pode ter 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(36) um grupo imidazolila,

(39) um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquil inferior fenil sulfonila, um grupo oxo, grupo hidróxi, e um grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(61) um grupo piperazinila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior, e

(62) um grupo morfolinila.

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que $R^1$ representa (I) um grupo cicloexila, e, no grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$ representado por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) definidos na reivindicação 8 podem estar presentes como um substituinte(s).

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que $R^1$ representa (II) um grupo fenila, e, no grupo

aromático representado por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18) (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) definidos na reivindicação 8 podem estar presentes como um substituinte(s).

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que $R^1$ representa (II) um grupo fenila, e, no grupo aromático representado por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (28), (33), (35), (39) e (61) apresentados a seguir podem estar presentes como um substituinte(s).

(1) um grupo alquila inferior,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcóxi carbonil inferior amino alcanoíla inferior, como um substituinte(s),

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(28) um grupo carbamoíla tendo um único grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(39) um grupo piperidila, e

(61) um grupo piperazinila que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior.

O composto de acordo com a reivindicação 11, em que $R^1$ é um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo amino tendo 1 ou 2 grupos alquila inferior no grupo amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo carbamoíla tendo um único grupo alquila inferior, que tem dois grupos alcóxi inferior no grupo alquila inferior;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo hidróxi alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo oxazolidinila tendo um único grupo oxo no grupo oxazolidinila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo pirrolidinila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperidila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcanoíla inferior no grupo piperazila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcanoíla inferior e um único grupo oxo no grupo piperazila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcoxicarbonila inferior e um único grupo oxo no grupo piperazila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo N-[(N-alcóxi inferior-carbonilamino)alcanoíl inferior]amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo N-(amino alcanoil inferior) amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo N-[(N-alcanoil

inferior amino)alcanoil inferior] amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alcóxi inferior, um único grupo alcanoíla inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcoxicarbonila inferior no grupo piperazila; ou

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alcóxi inferior, um único grupo hidróxi alquila inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcoxicarbonila inferior no grupo piperazila.

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que $R^1$ representa um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado de um grupo piperidila, grupo pirazolila e grupo tiazolila, e, no grupo heterocíclico representado por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) definidos na reivindicação 8 podem estar presentes como um substituinte(s).

A presente invenção fornece um composto representado pela fórmula geral (1), em que $R^1$ representa (III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado de um grupo piperidila, grupo pirazolila e grupo tiazolila, e, no grupo heterocíclico representado por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (17) e (28) apresentados a seguir podem estar presentes como um substituinte(s).

(1) um grupo alquila inferior;

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alcanoíla inferior, como um substituinte(s); e

(28) um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior.

A presente invenção fornece um composto representado pela

fórmula geral (1), em que $R^1$ representa

um grupo pirazolila tendo um único grupo alquila inferior e um único grupo alcanoil inferior amino;

um grupo pirazolila tendo um único grupo alquila inferior e um único grupo N,N-di-alquil inferior amino;

um grupo piperidila tendo um único grupo N,N-di-alquil inferior carbamoíla; ou

um grupo tiazolila tendo um único grupo N,N-di-alquil inferior carbamoíla.

A presente invenção fornece uma composição farmacêutica compreendendo um composto heterocíclico da fórmula geral (1) ou um sal do mesmo de acordo com a presente invenção, como um ingrediente ativo e um veículo farmaceuticamente aceitável.

A presente invenção fornece uma composição farmacêutica de acordo com a presente invenção que pode ser usada como uma composição farmacêutica para tratar ou prevenir outros distúrbios do sistema nervoso central.

A presente invenção fornece uma composição farmacêutica de acordo com a presente invenção que pode ser usada como uma composição farmacêutica para tratar ou prevenir outros distúrbios do sistema nervoso central selecionados do grupo que consiste em esquizofrenia; esquizofrenia refratória, intratável ou crônica; perturbação emocional; distúrbio psicótico; distúrbio de humor; distúrbio bipolar tipo I; distúrbio bipolar tipo II; depressão; endógeno; depressão; depressão maior; depressão de melancolia e refratória; distúrbio distímico; distúrbio ciclotímico; ataque de pânico; distúrbio de pânico; agorafobia; fobia social; distúrbio obsessivo-compulsivo; distúrbio de estresse pós traumático; distúrbio de ansiedade generalizada; distúrbio de estresse agudo; histeria; distúrbio de somatização; distúrbio de conversão; distúrbio de dor; hipocondríase; distúrbio factioso; distúrbio

dissociativo; disfunção sexual; distúrbio de desejo sexual; distúrbio de excitação sexual; disfunção erétil; anorexia nervosa; bulimia nervosa; distúrbio do sono; distúrbio do ajuste; abuso de álcool; intoxicação por álcool; abstinência de medicamento; intoxicação por estimulante; narcotismo; anhedonia; anhedonia iatrogênica; anhedonia de uma causa psíquica ou mental; anhedonia associada a depressão; anhedonia associada a esquizofrenia; delírio; falha cognitiva; falha cognitiva associada o mal de Alzheimer, mal de Parkinson e outros distúrbios neurodegenerativos; falha cognitiva causada pelo mal de Alzheimer; mal de Parkinson e doenças neurodegenerativas associadas; falha cognitiva de esquizofrenia; falha cognitiva causada por esquizofrenia refratória, intratável ou crônica; vômito; doença do movimento; obesidade; enxaqueca; dor (cabeça); retardo mental; distúrbio de autismo (autismo); distúrbio de Tourette; distúrbio de cacoete; distúrbio de déficit de atenção/hiperatividade; distúrbio de conduta; e síndrome de Down.

A presente invenção fornece um processo para produzir uma composição farmacêutica compreendendo misturar um composto heterocíclico representado pela fórmula (1) ou um sal do mesmo com um veículo farmaceuticamente aceitável.

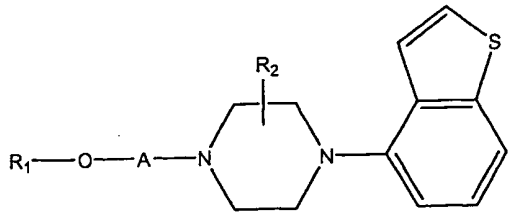
A presente invenção fornece o uso de um composto heterocíclico representado pela fórmula (1) ou um sal do mesmo como um medicamento.

Especificamente é fornecido um composto heterocíclico representado pela fórmula (1) ou um sal do mesmo, como um agonista parcial do receptor de dopamina D2 e/ou antagonista do receptor de serotonina 5-HT2A e/ou um antagonista do receptor de adrenalina α1 e/ou um inibidor da absorção de serotonina (ou um inibidor da reabsorção de serotonina).

A presente invenção fornece um método para tratar ou prevenir um distúrbio do sistema nervoso central compreendendo administrar

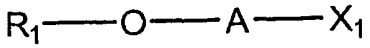
um composto heterocíclico da fórmula (1) ou um sal do mesmo a humano ou animal.

A presente invenção fornece um processo para produzir um composto heterocíclico representado pela fórmula (1):

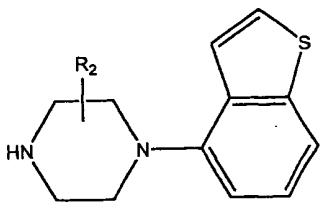



(1)

[em que $R_1$, $R_2$ e A são os mesmos definidos na reivindicação 1] ou um sal do mesmo, caracterizado por compreender uma reação de um composto representado pela fórmula:




[em que $R_1$ e A são os mesmos definidos anteriormente, e $X_1$ representa um átomo de halogênio ou um grupo que provoca uma reação de substituição a mesma que em um átomo de halogênio] ou um sal do mesmo com um composto representado pela fórmula:




[em que $R_2$ é o mesmo definido anteriormente] ou um sal do mesmo.

MELHOR MODO PARA REALIZAR A INVENÇÃO

Exemplos específicos de cada um dos grupos apresentados na fórmula geral (1) são como se segue.

Exemplos específicos de cada um dos grupos apresentados na fórmula geral são como se segue.

Exemplos do grupo alquila inferior incluem um grupo alquila

reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono. Exemplos específicos destes incluem um grupo metila, grupo etila, grupo n-propila, grupo isopropila, grupo n-butila, grupo isobutila, grupo terc-butila, grupo sec-butila, grupo n-pentila, grupo 1-etil propila, grupo isopentila, grupo neo-pentila, grupo n-exila, grupo 1,2,2-trimetila propila, grupo 3,3-dimetil butila, grupo 2-etil butila, grupo isoexila, e grupo 3-metil pentila.

Exemplos do grupo alquileno inferior incluem um grupo alquileno reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono. Exemplos específicos destes incluem um grupo metileno, grupo etileno, grupo trimetileno, grupo 2-metil trimetileno, grupo 2,2-dimetil etileno, grupo 2,2-dimetil trimetileno, grupo 1-metil trimetileno, grupo metil metileno, grupo etil metileno grupo, tetrametileno, grupo pentametileno, e grupo hexametileno.

Exemplos do grupo alquileno inferior incluem um grupo alquenileno reto ou ramificado tendo 1 a 3 ligações duplas e 2 a 6 átomos de carbono. Exemplos específicos destes incluem um grupo vinileno, grupo 1-propenileno, grupo 1-metil-1-propenileno, grupo 2-metil-1-propenileno, grupo 2-propenileno, grupo 2-butenileno, grupo 1-butenileno, grupo 3-butenileno, grupo 2-pentenileno, grupo 1-pentenileno, grupo 3-pentenileno, grupo 4-pentenileno, grupo 1,3-butadienileno, grupo 1,3-pentadienileno, grupo 2-penten-4-inileno, grupo 2-hexenileno, grupo 1-hexenileno, grupo 5-hexenileno, grupo 3-hexenileno, grupo 4-hexenileno, grupo 3,3-dimetil-1-propenileno, grupo 2-etil-1-propenileno, grupo 1,3,5-hexatrienileno, grupo 1,3-hexadienileno, e grupo 1,4-hexadienileno.

Exemplos do grupo alquenila inferior incluem um grupo alquenila reto ou ramificado tendo 1 a 3 ligações duplas e 2 a 6 átomos de carbono, incluindo configurações tanto trans quanto cis. Exemplos específicos destes incluem um grupo vinila, 1-grupo propenila, grupo 2-propenila, grupo 1-metil-1-propenila, grupo 2-metil-1-propenila, grupo 2-metil-2-propenila, grupo 2-propenila, grupo 2-butenila, grupo 1-butenila, grupo 3-butenila,

grupo 2-pentenila, grupo 1-pentenila, grupo 3-pentenila, grupo 4-pentenila, grupo 1,3-butadienila, grupo 1,3-pentadienila, grupo 2-penten-4-ila, grupo 2-hexenila, grupo 1-hexenila, grupo 5-hexenila, grupo 3-hexenila, grupo 4-hexenila, grupo 3,3-dimetil-1-propenila, grupo 2-etil-1-propenila, grupo 1,3,5-hexatrienila, grupo 1,3-hexadienila, e grupo 1,4-hexadienila.

Exemplos do átomo de halogênio incluem um átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo e átomo de iodo.

Exemplos do grupo alquila inferior substituído por halogênio incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente substituído por 1 a 7, mais preferivelmente, 1 a 3 átomos de halogênio. Exemplos específicos destes incluem um grupo fluormetila, grupo difluormetila, grupo trifluormetila, grupo clorometila, grupo diclorometila, grupo triclorometila, grupo bromometila, grupo dibromometila, grupo diclorofluormetila, grupo 2,2-difluoretila, grupo 2,2,2-trifluoretila, grupo pentafluoretila, grupo 2-fluoretila, grupo 2-cloroetila, grupo 3,3,3-trifluorpropila, grupo heptafluorpropila, grupo 2,2,3,3,3-pentafluorpropila, grupo heptafluoroisopropila, 3-cloropropila grupo, grupo 2-cloropropila, grupo 3-bromopropila, grupo 4,4,4-trifluorbutila, grupo 4,4,4,3,3-pentafluorbutila, grupo 4-clorobutila, grupo 4-bromobutila, grupo 2-clorobutila, grupo 5,5,5-trifluorpentila, grupo 5-cloropentila, grupo 6,6,6-trifluorexila, grupo 6-clorexila, e grupo perfluorexila.

Exemplos do grupo alcóxi inferior incluem um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono. Exemplos específicos destes incluem um grupo metóxi, grupo etóxi, grupo n-propóxi, grupo isopropóxi, grupo n-butóxi, grupo isobutóxi, grupo terc-butóxi, grupo sec-butóxi, grupo n-pentilóxi, grupo isopentilóxi, grupo neopentilóxi, grupo n-etilóxi, grupo isoetilóxi, e grupo 3-metil pentilóxi.

Exemplos do grupo arila incluem um grupo fenila, grupo fenila substituído, grupo bifenila, grupo bifenila substituído, grupo naftila, e

grupo naftila substituído. Exemplos do substituinte para um grupo arila incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila inferior reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), um átomo de halogênio da forma ilustrada anteriormente, e um grupo amino. No grupo arila, 1 a 7, preferivelmente 1 a 5, mais preferivelmente, 1 a 2 substituintes de pelo menos um tipo destes podem estar presentes. Exemplos específicos do grupo arila podem incluir um grupo fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) bifenila, grupo (1-ou 2-) naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-) metil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) etil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) n-propil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) n-butil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) n-pentil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) n-hexil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) isobutil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) terc-butil fenila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) metil-2-bifenila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) metil-3-bifenila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) metil-4-bifenila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) etil-2-bifenila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) etil-3-bifenila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) etil-4-bifenila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-propil-2-bifenila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-propil-3-bifenila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-propil-4-bifenila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-butil-2-bifenila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-butil-3-bifenila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-butil-4-bifenila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-pentil-2-bifenila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-pentil-3-bifenila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-pentil-4-bifenila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-hexil-2-bifenila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-hexil-3-bifenila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-hexil-4-bifenila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) isobutil-2-bifenila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) isobutil-3-bifenila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) isobutil-4-bifenila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) terc-butil-2-

bifenila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) terc-butil-3-bifenila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) terc-butil-4-bifenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) metil-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) metil-2-naftila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) etil-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) etil-2-naftila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-propil-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-propil-2-naftila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-butil-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-butil-2-naftila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-pentil-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-pentil-2-naftila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-hexil-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-hexil-2-naftila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) isobutil-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) isobutil-2-naftila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) terc-butil-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) terc-butil-2-naftila, grupo (2-, 3-ou 4-) clorofenila, grupo (2-, 3-ou 4-) fluorfenila, grupo (2-, 3-ou 4-) bromofenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) cloro-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) cloro-2-naftila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) flúor-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) flúor-2-naftila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) bromo-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) bromo-2-naftila, grupo (2-, 3-ou 4-) aminofenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) amino-1-naftila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) amino-2-naftila, grupo 2,3-dimetil fenila, grupo 3,4-dimetil fenila, grupo 2,4-dimetil fenila, grupo 2,5-dimetil fenila, grupo 2,6-dimetil fenila, grupo 2,4,6-trimetil fenila, grupo 3,4,5-trimetil fenila, grupo 2,3,4,5-tetraetil fenila, grupo pentametil fenila, grupo 2,4-dimetil-1-naftila, grupo 2,3-dimetil-1-naftila, grupo 3,4-dimetil-1-naftila, grupo 3,5,7-trietil naftila, grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftila, grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftila, grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftila, grupo heptametil-1-naftila, grupo 2,3-diaminofenila, grupo 2,4,6-triaminofenila, e grupo 2-metil-5-cloro-1-naftila.

Exemplos do grupo arilóxi incluem um grupo fenilóxi, grupo fenilóxi substituído, grupo bifenilóxi, grupo bifenilóxi substituído, grupo

naftilóxi, e grupo naftilóxi substituído. Exemplos do substituinte para um grupo arilóxi incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), um átomo de halogênio da forma ilustrada anteriormente, e um grupo amino. No grupo arila, 1 a 7, preferivelmente 1 a 5, mais preferivelmente, 1 a 2 substituintes de pelo menos um tipo destes podem estar presentes. Exemplos específicos dos grupos arilóxi incluem um grupo fenilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) bifenilóxi, grupo (1-ou 2-) naftilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) metil fenilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) etil fenilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) n-propil fenilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) n-butil fenilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) n-pentil fenilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) n-hexil fenilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) isobutil fenilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) terc-butil fenilóxi, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) metil-2-bifenilóxi, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) metil-3-bifenilóxi, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) metil-4-bifenilóxi, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) etil-2-bifenilóxi, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) etil-3-bifenilóxi, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) etil-4-bifenilóxi, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-propil-2-bifenilóxi, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-propil-3-bifenilóxi, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-propil-4-bifenilóxi, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-butil-2-bifenilóxi, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-butil-3-bifenilóxi, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-butil-4-bifenilóxi, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-pentil-2-bifenilóxi, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-pentil-3-bifenilóxi, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-pentil-4-bifenilóxi, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-hexil-2-bifenilóxi, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-hexil-3-bifenilóxi, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) n-hexil-4-bifenilóxi, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) isobutil-2-bifenilóxi, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) isobutil-3-bifenilóxi, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-,

ou 6'-) isobutil-4-bifenilóxi, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) terc-butil-2-bifenilóxi, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) terc-butil-3-bifenilóxi, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-) terc-butil-4-bifenilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) metil-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) metil-2-naftilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) etil-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) etil-2-naftilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-propil-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-propil-2-naftilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-butil-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-butil-2-naftilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-pentil-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-pentil-2-naftilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-hexil-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) n-hexil-2-naftilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) isobutil-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) isobutil-2-naftilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) terc-butil-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) terc-butil-2-naftilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) clorofenilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) fluorfenilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) bromofenilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) cloro-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) cloro-2-naftilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) flúor-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) flúor-2-naftilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) bromo-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) bromo-2-naftilóxi, grupo (2-, 3-ou 4-) aminofenilóxi, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) amino-1-naftilóxi, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-) amino-2-naftilóxi, grupo 2,3-dimetil fenilóxi, grupo 3,4-dimetil fenilóxi, grupo 2,4-dimetil fenilóxi, grupo 2,5-dimetil fenilóxi, grupo 2,6-dimetil fenilóxi, grupo 2,4,6-trimetil fenilóxi, grupo 3,4,5-trimetil fenilóxi, grupo 2,3,4,5-tetraetil fenilóxi, grupo pentametil fenilóxi, grupo 2,4-dimetil-1-naftilóxi, grupo 2,3-dimetil-1-naftilóxi, grupo 3,4-dimetil-1-naftilóxi, grupo 3,5,7-trietil-1-naftilóxi, grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftilóxi, grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftilóxi, grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftilóxi, grupo heptametil-1-naftilóxi, grupo 2,3-diaminofenilóxi, grupo 2,4,6-

triaminofenilóxi, e grupo 2-metil-5-cloro-1-naftilóxi.

Exemplos do grupo alquiltio inferior incluem um grupo alquiltio reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono. Exemplos específicos destes incluem um grupo metiltio, grupo etiltio, grupo n-propiltio, grupo isopropiltio, grupo n-butiltio, grupo terc-butiltio, grupo n-pentiltio, e grupo n-hexiltio.

Exemplos do grupo alcóxi inferior substituído por halogênio incluem um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente substituído por 1 a 7, preferivelmente, 1 a 3 átomos de halogênio. Exemplos específicos destes incluem um grupo fluormetóxi, grupo difluormetóxi, grupo trifluormetóxi, grupo clorometóxi, grupo diclorometóxi, grupo triclorometóxi, grupo bromometóxi, grupo dibromometóxi, grupo diclorofluormetóxi, grupo 2,2,2-trifluoretóxi, grupo pentafluoretóxi, grupo 2-cloroetóxi, grupo 3,3,3-trifluorpropóxi, grupo heptafluorpropóxi, grupo heptafluorisopropóxi, grupo 3-cloropropóxi, grupo 2-cloropropóxi, grupo 3-bromopropóxi, grupo 4,4,4-trifluorbutóxi, grupo 4,4,4,3,3-pentafluorbutóxi, grupo 4-clorobutóxi, grupo 4-bromobutóxi, grupo 2-clorobutóxi, grupo 5,5,5-trifluorpentóxi, grupo 5-cloropentóxi, grupo 6,6,6-trifluoretilóxi, e grupo 6-cloroetilóxi.

Exemplos do grupo protetor de um grupo hidróxi incluem um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono, um grupo alcanoíla inferior (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), e um grupo fenil alquila inferior cuja fração alquila inferior é um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono.

Exemplos do grupo hidróxi protegido incluem um grupo metóxi, grupo etóxi, grupo n-propóxi, grupo isopropóxi, grupo n-butóxi, grupo isobutóxi, grupo terc-butóxi, grupo sec-butóxi, grupo n-pentilóxi, grupo isopentilóxi, grupo neopentilóxi, grupo n-etilóxi, grupo isoetilóxi, grupo 3-metil pentilóxi, grupo alcanoil inferior óxi e grupo fenil alcóxi inferior.

Exemplos específicos incluem um grupo formilóxi, grupo acetilóxi, grupo propionilóxi, grupo butirilóxi, grupo isobutirilóxi, grupo pentanoilóxi, grupo terc-butil carbonilóxi, grupo hexanoilóxi, grupo benzilóxi, grupo 2-fenil etóxi, grupo 1-fenil etóxi, grupo 3-fenil propóxi, grupo 4-fenil butóxi, grupo 5-fenil pentilóxi, grupo 6-fenil hexilóxi, grupo 1,1-dimetil-2-fenil etóxi, e grupo 2-metil-3-fenil propóxi.

Exemplos do grupo hidróxi alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente tendo 1 a 5, preferivelmente 1 a 3 grupos hidróxi (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo hidroximetila, grupo 2-hidroxietila, grupo 1-hidroxietila, grupo 3-hidroxipropila, grupo 2,3-diidroxipropila, grupo 4-hidroxibutila, grupo 3,4-diidroxibutila, grupo 1,1-dimetil-2-hidroxietila, grupo 5-hidroxipentila, grupo 6-hidroxiexila, grupo 3,3-dimetil-3-hidroxipropila, grupo 2-metil-3-hidroxipropila, grupo 2,3,4-triidroxibutila, e grupo peridroxiexila.

Exemplo de um grupo protetor de um grupo hidróxi alquila inferior inclui um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono, um grupo alcanoíla inferior (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), e um grupo fenil alquila inferior cuja fração alquila inferior é um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono.

Exemplos do grupo hidróxi alquila inferior protegido incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 5, preferivelmente 1 a 3 grupos hidróxi protegidos da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi inferior, grupo alcanoil inferior óxi ou grupo fenil alcóxi inferior). Exemplos específicos destes incluem um grupo metoximetila, grupo 2-metoxietila, grupo 2-etoxietila, grupo 2-n-propoxietila, grupo 2-isopropoxietila, grupo 2-n-butoxietila, grupo

2-isobutoxietila, grupo 2-terc-butoxietila, grupo 2-sec-butoxietila, grupo 2-n-pentil oxietila, grupo 2-isopentil oxietila, grupo 2-neopentil oxietila, grupo 2-n-hexil oxietila, grupo 2-isoexil oxietila, grupo 2-(3-metil pentilóxi) etila, grupo 2-formil oxietila, grupo 2-acetil oxietila, grupo 2-propionil oxietila, grupo 2-butiril oxietila, grupo 2-isobutiril oxietila, grupo 2-pentanoil oxietila, grupo 2-terc-butil carbonil oxietila, grupo 2-hexanoil oxietila, grupo 2-benzil oxietila, grupo 2-(2-fenil etóxi)etila, grupo 2-(1-fenil etóxi) etila, grupo 2-(3-fenil propóxi)etila, grupo 2-(4-fenil butóxi)etila, grupo 2-(5-fenil pentilóxi)etila, grupo 2-(6-fenil hexilóxi)etila, grupo 2-(1,1-dimetil-2-fenil etóxi)etila, grupo 2-(2-metil-3-fenil propóxi)etila, grupo 3-etoxipropila, grupo 2,3-dietoxipropila, grupo 4-etoxibutila, 3,4-dietoxibutila, grupo 1,1-dimetil-2-etoxietila, grupo 5-etoxipentila, grupo 6-etoxiexila, grupo 3,3-dimetil-3-etoxipropila, grupo 2-metil-3-etoxipropila, e grupo 2,3,4-trietoxibutila.

Exemplos do grupo alcanoíla inferior incluem um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono. Exemplos específicos destes incluem um grupo formila, grupo acetila, grupo propionila, grupo butirila, grupo isobutirila, grupo pentanoíla, grupo terc-butil carbonila, e grupo hexanoíla.

Exemplos do grupo alcoxicarbonila inferior incluem um grupo alcoxicarbonila reto ou ramificado cuja fração alcóxi inferior é da forma ilustrada anteriormente, e preferivelmente tendo 1 a 6 átomos de carbono. Exemplos específicos destes incluem um grupo metoxicarbonila, grupo etoxicarbonila, grupo n-propoxicarbonila, grupo isopropoxicarbonila, grupo n-butoxicarbonila, grupo isobutóxi carbonila, grupo terc-butoxicarbonila, grupo sec-butoxicarbonila, grupo n-pentiloxicarbonila, grupo neopentilóxi, grupo n-hexil oxicarbonila, grupo isoexil oxicarbonila, e grupo 3-metil pentil oxicarbonila.

Exemplos do grupo alquil inferior sulfonila incluem um alquil sulfonila reto ou ramificado cuja fração alquila inferior é da forma ilustrada

anteriormente, e preferivelmente tendo 1 a 6 átomos de carbono. Exemplos específicos destes incluem um grupo metil sulfonila, grupo etil sulfonila, grupo n-propil sulfonila, grupo isopropil sulfonila, grupo n-butil sulfonila, grupo isobutil sulfonila, grupo terc-butil sulfonila, grupo terc-butil sulfonila, grupo n-pentil sulfonila, grupo isopentil sulfonila, grupo neopentil sulfonila, grupo n-hexil sulfonila, grupo isoexil sulfonila, e grupo 3-metil pentil sulfonila.

Exemplos do grupo alquil inferior carbamoíla incluem um grupo carbamoíla tendo 1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) como um substituinte(s). Exemplos específicos destes incluem um grupo N-metil carbamoíla, grupo N,N-dimetil carbamoíla, grupo N-etil carbamoíla, grupo N,N-dietil carbamoíla, grupo N-n-propil carbamoíla, grupo N-n-butil carbamoíla, grupo N-n-pentil carbamoíla, grupo N-n-hexil carbamoíla, grupo N-isobutil carbamoíla, grupo N-terc-butil carbamoíla, e grupo N,N-di-n-propil carbamoíla.

Exemplos do grupo aminoalcanoíla incluem um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3 grupos (preferivelmente 1) amino. Exemplos específicos destes incluem um grupo aminoacetila, grupo 3-aminopropionila, grupo 4-aminobutirila, grupo 3,4-diaminobutirila, grupo 3,3-dimetil-3-aminopropionila, grupo 4-aminobutirila e grupo 5-aminovalerila.

Exemplos do grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior incluem um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) cuja fração do grupo alcanoíla inferior tem 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alcanoil inferior amino da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo N-formilaminoacetila, grupo N-

acetilaminoacetila, grupo N-propionilaminoacetila, grupo 3-(N-acetilamino) propionila, grupo 4-(N-acetilamino)butirila, grupo 3,4-di(N-acetilamino) butirila, grupo 3,3-dimetil-3-(N-propinilamino) propionila, grupo 4-(N-formilamino) butirila, e grupo 5-(N-acetilamino) valerila.

Exemplos do grupo alcóxi inferior carbonilamino inferior alcanoíla incluem um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) cuja fração alcóxi carbonila inferior tem 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alcóxi inferior carbonilamina da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo N-metoxicarbonilaminoacetila, grupo N-etoxicarbonilaminoacetila, grupo N-terc-butoxicarbonilaminoacetila, grupo 3-(N-metoxicarbonilamino) propionila, grupo 4-(N-acetilamino) butirila, grupo 3,4-di(N-acetilamino) butirila, grupo 3,3-dimetil-3-(N-propinilamino) propionila, grupo 4-(N-formilamino) butirila e grupo 5-(N-acetilamino) valerila. Exemplos do grupo amino tendo, como um substituinte, um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo alcanoíla inferior, grupo alcóxi carbonila inferior, grupo alquil inferior sulfonila, grupo carbamoíla, grupo alquil inferior carbamoíla inferior, grupo amino alcanoíla inferior, grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior, e grupo alcoxicarbonil inferior amino alcanoíla inferior incluem um grupo amino tendo, como um substituinte, 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada

anteriormente (preferivelmente um grupo alcoxicarbonila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alquilsulfonila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquilsulfonila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo carbamoíla;

um grupo alquil inferior carbamoíla da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo carbamoíla tendo, como um substituinte, 1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono)); um grupo amino alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente; um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente; e um grupo alcoxicarbonil inferior amino alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo amino, grupo N-metilamino, grupo N,N-dimetilamino, grupo N-etilamino, grupo N-n-propilamino, grupo N-isopropilamino, grupo N-formilamino, N-grupo etilamino, N-terc-butoxicarbonilamino, grupo N-metoxicarbonilamino, grupo N-metil sulfonilamino, grupo N-etil sulfonilamino, grupo N-metil-N-acetilamino, grupo N-metil-N-metoxicarbonilamino, grupo N-[N,N-dimetil carbamoil] amino, grupo N-carbamoilamino, grupo N-[N-metil carbamoíla] amino, grupo N-[N,N-dietil carbamoíla] amino, grupo N-[aminoacetila] amino, grupo N-[[N-formilamino] acetila] amino, grupo N-[[N-acetilamino] acetila] amino, grupo N-[[N-metoxicarbonilamino] acetila] amino, e grupo N-[[N-terc-butoxicarbonilamino] acetil] amino.

Exemplos do grupo aril sulfonila que podem ter um grupo alquila inferior em um grupo arila incluem um grupo aril sulfonila cuja fração arila é fenila, bifenila, naftila ou similares e em que 1 a 7, preferivelmente 1 a 5, mais preferivelmente, 1 a 2 grupos alquila retos ou ramificados tendo 1 a 6

átomos de carbono. Exemplos específicos do grupo aril sulfonila que pode ter um grupo alquila inferior em um grupo arila incluem um grupo fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)bifenil sulfonila, grupo (1-ou 2-)naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)metil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)etil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-propil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-butil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-pentil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-hexil fenil sulfonil, grupo (2-, 3-, ou 4-)isobutil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)terc-butil fenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)metil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)metil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)metil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)etil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)etil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)etil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-propil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-propil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-propil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-butil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-butil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-butil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-pentil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-pentil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-pentil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-hexil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-hexil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-hexil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)isobutil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)isobutil-3-bifenil sulfonila, (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)isobutil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)terc-butil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)terc-butil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-,

5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)terc-butil-4-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)metil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)metil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)etil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)etil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-propil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-propil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-butil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-butil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-pentil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-pentil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-hexil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-hexil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)isobutil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)isobutil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)terc-butil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)terc-butil-2-naftil sulfonila, grupo 2,3-dimetil fenil sulfonila, grupo 3,4-dimetil fenil sulfonila, grupo 2,4-dimetil fenil sulfonila, grupo 2,5-dimetil fenil sulfonila, grupo 2,6-dimetil fenil sulfonila, grupo 2,4,6-trimetil fenil sulfonila, grupo 3,4,5-trimetil fenil sulfonila, grupo 2,3,4,5-tetraetil fenil sulfonila, grupo pentametil fenil sulfonila, grupo 2,4-dimetil-1-naftil sulfonila, grupo 2,3-dimetil-1-naftil sulfonila, grupo 3,4-dimetil-1-naftil sulfonila, grupo 3,5,7-trietil-1-naftil sulfonila, grupo 3,4,5,7-tetrametil-1-naftil sulfonila, grupo 2,3,4,5,7-pentametil-1-naftil sulfonila, grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftil sulfonila, e grupo heptametil-1-naftil sulfonila.

Exemplos de um grupo carboxialquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos carboxila. Exemplos específicos destes incluem grupo carboximetila, grupo 2-carboxietila, grupo 1-carboxietila, grupo 1-carbóxi-1-metil etila, grupo 3-carboxipropila, grupo 2,3-dicarboxipropila, grupo 4-carboxibutila, grupo 4-dicarboxibutila, grupo 1,1-dimetil-2-

carboxietila, grupo 5-carboxipentila, grupo 6-carboxiexila, grupo 3,3-dimetil-3-carboxipropila, grupo 2-metil-3-carboxipropila, e grupo 2,3,4-tricarboxibutila.

Exemplos de um grupo alcoxicarbonil inferior alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcoxicarbonila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo metoxicarbonil metila, grupo etoxicarbonil metila, grupo 1-metoxicarbonil etila, grupo 2-metoxicarbonil etila, grupo 2-etoxicarbonil etila, grupo 1-etoxicarbonil etila, grupo 3-metoxicarbonil propila, grupo 3-etoxicarbonil propila, grupo 4-etoxicarbonil butila, grupo 5-isopropoxicarbonil pentila, grupo 6-n-propoxicarbonil exila, grupo 1,1-dimetil-2-n-butoxicarbonil etila, grupo 1-metil-1-metoxicarbonil etila, grupo 2-metil-1-metoxicarbonil propila, grupo 2-metil-3-terc-butoxicarbonil propila, grupo 3-metil-1-metoxicarbonil butila, grupo dietoxicarbonil metila, grupo 1,2-dietoxicarbonil etila, grupo 2-n-pentil oxicarbonil etila, e grupo n-hexil oxicarbonil metila.

Exemplos do grupo carbamoil alquila inferior que pode ter um grupo, como um substituinte, selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo fenila que pode ter um grupo alquila inferior e um grupo fenila que pode ter um grupo alcóxi inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos carbamoíla. A fração carbamoíla pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo fenila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente grupo alquila reto ou ramificados tendo 1 a 6

átomos de carbono) e um grupo fenila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente grupos alcóxi retos ou ramificados tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos do grupo carbamoil alquila inferior incluem um grupo carbamoil metila, grupo dicarbamoil metila, grupo 2-carbamoil etila, grupo 1-carbamoil etila, grupo 1-carbamoil-2-metil propila, grupo 3-carbamoil propila, grupo 4-carbamoil butila, grupo 5-carbamoil pentila, grupo 6-carbamoil exila, grupo 1,1-dimetil-2-carbamoil etila, grupo 2-metil-3-carbamoil propila, grupo N-metil carbamoil metila, N,N-dimetil carbamoil metila, grupo N-metil-N-etil carbamoil metila, grupo N-metil carbamoil metila, grupo 2-(N-metil carbamoil)etila, grupo 2-(N-etil carbamoil)etil, grupo N-fenil carbamoil metila, grupo N-(2-metoxifenil)carbamoil metila, e grupo N-(4-metil fenil)carbamoil metila.

Exemplos do grupo carboxialquenila inferior incluem um grupo alquenila inferior da forma ilustrada anteriormente tendo 1 a 3, preferivelmente 1, grupos carboxila e incluindo configurações tanto trans quanto cis (preferivelmente um grupo alquenila reto ou ramificado tendo 1 a 3 ligações duplas e 2 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-carboxietenila, grupo 3-carbóxi-2-propenila, grupo 4-carbóxi-2-butenila, grupo 4-carbóxi-3-butenila, grupo 4-carbóxi-1,3-butadienila, grupo 5-carbóxi-1,3,5-hexatrienila, grupo 5-carbóxi-2,4-hexadienila, grupo 5-carbóxi-3-pentenila, e grupo 3-carbóxi-1-propenila.

Exemplos do grupo alcoxicarbonil inferior alquenila inferior incluem um grupo alquenila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquenila reto ou ramificado tendo 1 a 3 ligações duplas e 2 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3 grupos alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcoxicarbonila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) e incluindo configurações tanto trans quanto cis. Exemplo específico do grupo alcoxicarbonil inferior

alquenila inferior incluem um grupo 2-metoxicarbonil etenila, grupo 2-etoxicarbonil etenila, grupo 1-etoxicarbonil etenila, grupo 3-metoxicarbonil-2-propenila, grupo 3-etoxicarbonil-2-propenila, grupo 4-etoxicarbonil-2-butenila, grupo 4-etoxicarbonil-1,3-butadienila, grupo 5-isopropoxicarbonil-3-pentenila, grupo 6-n-propoxicarbonil-1,3,5-hexatrienila, grupo 1,1-dimetil-2-n-butoxicarbonil etenila, grupo 2-metil-3-terc-butoxicarbonil-2-propenila, e grupo 2-n-pentil oxicarbonil etenila.

Exemplos do grupo carbamoil alquenila inferior incluem um grupo alquenila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquenila reto ou ramificado tendo 2 a 6 átomos de carbono e 1 a 3 ligações duplas) tendo 1 a 3, preferivelmente 1, grupos carbamoíla. Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-carbamoil etenila, grupo 3-carbamoil-2-propenila, grupo 4-carbamoil-2-butenila, grupo 4-carbamoil-3-butenila, grupo 4-carbamoil-1,3-butadienila, grupo 5-carbamoil-1,3,5-hexatrienila, grupo 5-carbamoil-2,4-hexadienila, grupo 5-carbamoil-3-pentenila, e grupo 3-carbamoil-1-propenila.

Exemplos do grupo carbamoil alquenila inferior que pode ter, como um substituinte, um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio incluem um grupo alquenila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquenila reto ou ramificado tendo 1 a 3 ligações duplas e 2 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3, preferivelmente 1 grupo carbamoíla que pode ter, no grupo carbamoíla, 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono); e

um grupo alquila inferior substituído por halogênio da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado

tendo 1 a 6 átomos de carbono tendo 1 a 7, preferivelmente 1 a 3 substituintes de átomos de halogênio). Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-carbamoil etenila, grupo 2-(N-metil carbamoil)etenila, grupo 2-(N-etil carbamoil)etenila, grupo 2-(N,N-dimetil carbamoil)etenila, e grupo 2-[N-(2,2,2-trifluoretil)carbamoil]etenila.

Exemplos do grupo alcóxi inferior alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3, preferivelmente 1, grupos alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo metoximetila, grupo 2-metoxietila, grupo 1-etoxietila, grupo 2-etoxietila, grupo 2-isobutoxietila, grupo 2,2-dimetoxietila, grupo 2-metóxi-1-metil etila, grupo 2-metóxi-1-etil etila, grupo 3-metoxipropila, grupo 3-etoxipropila, grupo 2-isopropoxietila, grupo 3-isopropoxipropila, grupo 3-n-butoxipropila, grupo 4-n-propoxibutila, grupo 1-metil-3-isobutóxi propila, grupo 1,1-dimetil-2-n-pentil oxietila, grupo 5-n-hexil oxipentila, grupo 6-metoxiexila, grupo 1-etoxiisopropila, e grupo 2-metil-3-metoxipropila.

Exemplos do grupo arilóxi alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3, preferivelmente 1 grupos arilóxi cuja fração arila é fenila, bifenila, naftila ou similares. Exemplos de um substituinte para um grupo arila incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), um átomo de halogênio da forma ilustrada anteriormente, e um grupo amino. Um a sete substituintes de pelo menos um tipo destes podem estar presentes em um anel arila. Exemplos específicos do grupo arilóxi alquila inferior incluem um grupo fenoximetila, grupo 2-fenoxietila, grupo 2-[(1-ou 2-)naftilóxi]etila,

grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)metil fenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)etil fenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)n-propil fenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)n-butil fenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)n-pentil fenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)n-hexil fenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)isobutil fenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)terc-butil fenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)metil-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)metil-2-naftilóxi)etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)etil-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)etil-2-naftilóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-propil-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-propil-2-naftilóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-butil-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-butil-2-naftilóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-pentil-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-pentil-2-naftilóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-hexil-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-hexil-2-naftilóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)isobutil-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)isobutil-2-naftilóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)terc-butil-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)terc-butil-2-naftilóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)clorofenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)fluorfenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)bromofenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)cloro-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)cloro-2-naftilóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)flúor-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)flúor-2-naftilóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)bromo-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)bromo-2-naftilóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)aminofenóxi]etila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)amino-1-naftilóxi]etila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)amino-2-naftilóxi]etila, grupo 2-(2,3-dimetilfenóxi)etila, grupo 2-(3,4-dimetilfenóxi)etila, grupo 2-(2,4-dimetilfenóxi)etila, grupo 2-(2,5-dimetilfenóxi)etila, grupo 2-(2,6-dimetilfenóxi)etila, grupo 2-(2,4,6-

trimetilfenóxi)etila, grupo 2-(3,4,5-trimetilfenóxi)etila, grupo 2-(2,3,4,5-tetraetilfenóxi)etila, grupo 2-(pentametilfenóxi)etila, grupo 2-(2,4-dimetil-1-naftilóxi)etila, grupo 2-(2,3-dimetil-1-naftilóxi)etila, grupo 2-(3,4-dimetil-1-naftilóxi)etila, grupo 2-(3,5,7-trietil-1-naftilóxi)etila, grupo 2-(3,4,5,7-tetrametil-1-naftilóxi)etila, grupo 2-(2,3,4,5,7-pentametil-1-naftilóxi)etila, grupo 2-(2,3,4,5,6,7-hexaetil-1-naftilóxi)etila, grupo 2-(heptametil-1-naftilóxi)etila, grupo 2-(2,3-diaminofenóxi)etila, grupo 2-(2,4,6-triaminofenóxi)etila, grupo 2-(2-metil-5-cloro-1-naftil)etila, grupo 3-fenoxipropila, grupo 2,3-difenoxipropila, grupo 4-fenoxibutila, grupo 3,4-difenoxibutila, grupo 1,1-dimetil-2-fenoxietila, grupo 5-fenoxipentila, grupo 6-fenoxiexila, grupo 3,3-dimetil-3-fenoxipropila, grupo 2-metil-3-fenoxipropila, e grupo 2,3,4-trifenoxibutila, grupo 3-[(1-ou 2-)naftilóxi]propila, grupo 2,3-di[(1-ou 2-)naftilóxi]propila, grupo 4-[(1-ou 2-)naftilóxi]butila, grupo 3,4-di[(1-ou 2-)naftilóxi]butila, grupo 1,1-dimetil-2-[(1-ou 2-)naftilóxi]etila, grupo 5-[(1-ou 2-)naftilóxi]pentila, grupo 6-[(1-ou 2-)naftilóxi]hexila, grupo 3,3-dimetil-3-[(1-ou 2-)naftilóxi]propila, grupo 2-metil-3-[(1-ou 2-)naftilóxi]propila, e grupo 2,3,4-tri[(1-ou 2-)naftilóxi]butila.

Exemplos do grupo amino alquila inferior que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo alcanoíla inferior, grupo aroíla e grupo carbamoíla incluem

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 5 (preferivelmente 1) grupos amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), grupo aroíla da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente grupo benzoíla) da forma ilustrada

anteriormente e grupo carbamoíla. Exemplos específicos do grupo amino alquila inferior incluem um grupo aminometila, grupo 2-aminoetila, grupo 1-aminoetila, grupo 3-aminopropila, grupo 4-aminobutila, grupo 5-aminopentila, grupo 6-aminoexila, grupo 1,1-dimetil-2-aminoetila, grupo 2-metil-3-aminopropila, grupo N,N-dimetilaminometila, grupo N-metil-N-etilaminometila, grupo N-metilaminometila, grupo 2-(N-metilamino)etila, grupo 1-metil-2-(N,N-dimetilamino)etila, grupo 1-metil-2-(N,N-dietilamino)etila, grupo 2-(N,N-dimetilamino)etila, grupo 2-(N,N-dietilamino)etila, grupo 2-(N,N-diisopropilamino)etila, grupo 3-(N,N-dimetilamino)propila, grupo 3-(N,N-dietilamino)propila, grupo 2-(N-acetilamino)etila, grupo 2-(N-metil-N-acetilamino)etila, grupo 2-(N-metil-N-n-butirilamino)etila, grupo 2-(N-metil-N-benzoilamino)etila, e grupo 2-(N-carbamoilamino)etila.

Exemplos do grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ incluem um grupo ciclopropila, grupo ciclobutila, grupo ciclopentila, grupo cicloexila, grupo cicloeptila, e grupo ciclooctila.

Exemplos do grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ que pode ter um grupo, como um substituinte, selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo hidróxi, grupo alcóxi inferior carbonila e grupo fenil alcóxi inferior incluem um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos, como um substituinte(s), selecionados do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo hidróxi;

um grupo alcóxi inferior carbonila da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcoxicarbonila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono); e

um grupo alcóxi inferior (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos fenila. Exemplos específicos destes incluem um grupo ciclopropila, grupo ciclobutila, grupo ciclopentila, grupo cicloexila, grupo cicloeptila, grupo ciclooctila, grupo 1-metil ciclopropila, grupo 1-metil ciclopentila, grupo 1-metil cicloexila, grupo 2-metil cicloexila, grupo hidroxicicloexila, grupo 4-metoxicarbonil cicloexila, grupo 2-benzil oxipentila, e grupo 2-benzil oxiexila.

Exemplo do grupo alquila inferior substituído por cicloalquila $C_3$-$C_8$ inclui um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3, preferivelmente 1 grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo ciclopropil metila, grupo cicloexil metila, grupo 2-ciclopropil etila, grupo 1-ciclobutil etila, grupo ciclopentil metila, 3-ciclopentil propila, grupo 4-cicloexil butila, grupo 5-cicloeptil pentila, grupo 6-ciclooctil exila, grupo 1,1-dimetil-2-cicloexil etila, e grupo 2-metil-3-ciclopropil propila.

Exemplos do grupo furil alquila inferior (que pode ter um substituinte de um grupo alquila inferior no grupo furil) incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos furila em que 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) podem estar presentes como um substituinte. Exemplos específicos destes incluem um grupo [(2-ou 3-)furil]metila, grupo 2-[(2-ou 3-)furil]etila, grupo 1-[(2-ou 3-)furil]etila, grupo 3-[(2-ou 3-)furil]propila, grupo 4-[(2-ou 3-)furil]butila, grupo 5-[(2-ou 3-)furil]pentila, grupo 6-[(2-ou 3-)furil]hexila, grupo 1,1-dimetil-2-[(2-ou 3-)furil]etila, grupo 2-metil-3-[(2-ou 3-)furil]propila, grupo

[5-etil-(2-, 3-, ou 4-)furil]metila, grupo [5-metil-(2-, 3-, ou 4-)furil]metila, grupo [2-n-propil-(3-, 4-, ou 5-)furil]metila, grupo [3-terc-butil-(2-, 4-, ou 5-)furil]metila, grupo [4-n-pentil-(2-, 3-, ou 5-)furil]metila, grupo [2-n-hexil-(3-, 4-, ou 5-)furil]metila, grupo [2,5-dimetil-(3-ou 4-)furil]metila, grupo [2,5-dietil-(3-ou 4-)furil]metila, e grupo [2,4,5-trietil-3-furil]metila.

Exemplos do grupo tetraidrofuril alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos tetraidrofurila. Exemplos específicos destes incluem um grupo (2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)metila, 2-[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]etila, grupo 1-[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]etila, grupo 3-[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]propila, grupo 2,3-di[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]propila, grupo 4-[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]butila, grupo 3,4-di[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]butila, grupo 1,1-dimetil-2-[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]etila, grupo 5-[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]pentila, grupo 6-[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]hexila, grupo 3,3-dimetil-3-[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]propila, grupo 2-metil-3-[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]propila, e grupo 2,3,4-tri[(2-ou 3-)(2,3,4,5-tetraidrofuril)]butila.

Exemplos de um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos 1,3-dioxolanila. Exemplos específicos destes incluem um grupo [(2-ou 4-)1,3-dioxolanil]metila, grupo 2-[(2-ou 4-)1,3-dioxolanil]etila, grupo 1-[(2-ou 4-)1,3-dioxolanil]etila, grupo 3-[(2-ou 4-)1,3-dioxolanil]propila, grupo 4-[(2-ou 4-)1,3-dioxolanil]butila, grupo 1,1-dimetil-2-[(2-ou 4-)1,3-dioxolanil]etila, grupo 5-[(2-ou 4-)1,3-dioxolanil]pentila, grupo 6-[(2-ou 4-)1,3-dioxolanil]hexila, grupo 1-[(2-ou 4-)1,3-dioxolanil]isopropila e grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, ou 4-)imidazolil]propila.

Exemplos do grupo tetraidropiranil alquila inferior incluem um

grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos tetraidropiranila. Exemplos específicos destes incluem um grupo [(2-, 3-, ou 4-)tetraidropiranil]metila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)tetraidropiranil]etila, grupo 1-[(2-, 3-, ou 4-)tetraidropiranil]etila, grupo 3-[(2-, 3-, ou 4-)tetraidropiranil]propila, grupo 4-[(2-, 3-, ou 4-)tetraidropiranil]butila, grupo 1,1-dimetil-2-[(2-, 3-, ou 4-)tetraidropiranil]etila, grupo 5 -[(2-, 3-, ou 4-)tetraidropiranil]pentila, grupo 6-[(2-, 3-, ou 4-)tetraidropiranil]hexila, grupo 1-[(2-, 3-, ou 4-)tetraidropiranil]isopropila, e grupo 2-metil-3-[(2-, 3-, ou 4-)tetraidropiranil]propila.

Exemplos do grupo pirrolil alquila inferior (que pode ter um substituinte de um grupo alquila inferior no grupo pirrolil) incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos pirrolila em que 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) podem estar presentes como um substituinte(s). Exemplos específicos destes incluem um grupo [(1-, 2-, ou 3-)pirrolil]metila, grupo 2-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolil]etila, grupo 1-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolil]etila, grupo 3-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolil]propila, grupo 4-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolil]butila, grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolil]etila, grupo 5-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolil]pentila, grupo 6-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolil]hexila, grupo 1-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolil]isopropila, grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolil]propila, grupo [1-metil-(2-ou 3-)pirrolil]metila, grupo [1-etil-(2-ou 3-)pirrolil]metila, grupo [1-n-propil-(2-ou 3-)pirrolil]metila, grupo [1-n-butil-(2-ou 3-)pirrolil]metila, grupo [1-n-pentil-(2-ou 3-)pirrolil]metila, grupo [1-n-hexil-(2-ou 3-)pirrolil]metila, grupo 2-[5-metil-(1-, 2-, 3-, ou 4-)pirrolil]etila, grupo 1-[1-etil-(2-ou 3-)pirrolil]etila, grupo 3-[1-etil-(2-ou 3-)pirrolil]propila,

grupo 4-[1-n-propil-(2-ou 3-)pirrolil]butila, grupo 5-[1-n-butil-(2-ou 3-)pirrolil]pentila, grupo 6-[1-n-pentil-(2-ou 3-)pirrolil]hexila, grupo [1,5-dimetil-(2-, 3-, ou 4-)pirrolil]metila, grupo [1,3,5-trimetil-2-pirrolil]metila, e grupo [1,2,4-trimetil-3-pirrolil]metila.

Exemplos do grupo alquila inferior substituído por um grupo diidropirazolila que pode ter um grupo oxo incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo um grupo 2,3-diidropirazolila ou grupo 4,5-diidropirazolila como um grupo diidropirazolila, em que um grupo oxo pode estar presente. Exemplos específicos destes incluem um grupo 3-(2,3-ou 4,5-)diidropirazolil metila, grupo 2-[4-(2,3-ou 4,5-)diidropirazolil]etila, grupo 1-[5-(2,3-ou 4,5-)diidropirazolil]etila, grupo 3-[3-(2,3-ou 4,5-)diidropirazolil]propila, grupo 4-[4-(2,3-ou 4,5-)diidropirazolil]butila, grupo 5-[1-(2,3-ou 4,5-)diidropirazolil]pentila, grupo 6-[5-(2,3-ou 4,5-)diidropirazolil]hexila, grupo 2-metil-3-[1-(2,3-ou 4,5-)diidropirazolil]propila, grupo 1,1-dimetil-2-[3-(2,3-ou 4,5-)diidropirazolil]etila, grupo 5-oxo-4-(4,5-diidropirazolil)metila, grupo 2-[5-oxo-4-(4,5-diidropirazolil)]etila, e grupo 3-[5-oxo-4-(4,5-diidropirazolil)]propila.

Exemplos do grupo pirazolil alquila inferior (que pode ter um substituinte de um grupo alquila inferior no grupo pirazolil) incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos pirazolila, em que 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) podem estar presentes como um substituinte(s). Exemplos específicos destes incluem um grupo 3-pirazolil metila, grupo 2-(4-pirazolil)etila, grupo 2-(1-pirazolil)etila, grupo 1-(5-pirazolil)etila, grupo 3-(3-pirazolil)propila, grupo 4-(4-

pirazolil)butila, grupo 5-(1-pirazolil)pentila, grupo 6-(5-pirazolil)hexila, grupo 2-metil-3-(1-pirazolil)propila, grupo 1,1-dimetil-2-(3-pirazolil)etila, grupo 1-metil-3-pirazolil metila, grupo 1-etil-3-pirazolil metila, grupo 1-n-propil-3-pirazolil metila, grupo 1-n-butil-3-pirazolil metila, grupo 1-n-pentil-3-pirazolil metila, grupo 1-metil-4-pirazolil metila, grupo 5-metil-3-pirazolil metila, grupo 1-etil-4-pirazolil metila, grupo 1-n-propil-4-pirazolil metila, grupo 1-n-butil-4-pirazolil metila, grupo 1-n-hexil-4-pirazolil metila, grupo 3-metil-1-pirazolil metila, grupo 3-etil-1-pirazolil metila, grupo 3-n-propil-1-pirazolil metila, grupo 3-n-butil-1-pirazolil metila, grupo 1,5-dimetil-3-pirazolil metila, grupo 3,5-dimetil-4-pirazolil metila, grupo 3,4-dimetil-1-pirazolil metila, grupo 1,3-dimetil-5-pirazolil metila, grupo 3,4-dietil-1-pirazolil metila, grupo 3,4-di-n-propil-1-pirazolil metila, grupo 3,4-di-n-butil-1-pirazolil metila, grupo 1,3,5-trimetil-4-pirazolil metila, grupo 3,4,5-trimetil-1-pirazolil metila, grupo 3,4,5-trietil-1-pirazolil metila, grupo 3,4,5-tri-n-propil-1-pirazolil metila, grupo 3,4,5-tri-n-butil-1-pirazolil metila, grupo 1-metil-5-pirazolil metila, grupo 1-etil-5-pirazolil metila, grupo 1-n-propil-5-pirazolil metila, grupo 1-n-butil-5-pirazolil metila, grupo 2-(3-pirazolil)etila, grupo 3-(3-pirazolil)propila, grupo 4-(3-pirazolil)butila, grupo 5-(3-pirazolil)pentila, grupo 6-(3-pirazolil)hexila, grupo 2-(1-(4-clorofenil)-3-pirazolil)etila, grupo 3-(1-metil-3-pirazolil)propila, grupo 3-(3-metil-4-pirazolil)propila, grupo 3-(5-metil-4-pirazolil)propila, grupo 3-(1,5-dimetil-3-pirazolil)propila, grupo 3-(1-etil-3-pirazolil)propila, grupo 3-(1-n-propil-3-pirazolil)propila, grupo 3-(1-n-butil-3-pirazolil)propila, grupo 4-(1-metil-3-pirazolil)butila, grupo 4-(1-etil-3-pirazolil)butila, grupo 4-(1-n-propil-3-pirazolil)butila, grupo 4-(1-n-butil-3-pirazolil)butila, grupo 5-(1-metil-3-pirazolil)pentila, grupo 5-(1-etil-3-pirazolil)pentila, grupo 5-(1-n-propil-3-pirazolil)pentila, grupo 5-(1-n-butil-3-pirazolil)pentila, grupo 6-(1-metil-3-pirazolil)hexila, grupo 6-(1-etil-3-pirazolil)hexila, grupo 6-(1-n-propil-3-pirazolil)hexila, e grupo 6-[1-(3-butil)-3-pirazolil]hexila.

Exemplos do grupo imidazolil alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos imidazolila. Exemplos específicos destes incluem um grupo [(1-, 2-, 4-ou 5-)imidazolil]metila, grupo 2-[(1-, 2-, 4-ou 5-)imidazolil]etila, grupo 1-[(1-, 2-, 4-ou 5-)imidazolil]etila, grupo 3-[(1-, 2-, 4-ou 5-)imidazolil]propila, grupo 4-[(1-, 2-, 4-ou 5-)imidazolil]butila, grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2-, 4-ou 5-)imidazolil]etila, grupo 5-[(1-, 2-, 4-ou 5-)imidazolil]pentila, grupo 6-[(1-, 2-, 4-ou 5-)imidazolil]hexila, grupo 1-[(1-, 2-, 4-ou 5-)imidazolil]isopropila, e grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, 4-ou 5-)imidazolil]propila.

Exemplos do grupo piridil alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos piridila. Exemplos específicos destes incluem um (2-, 3-ou 4-)piridil metila, grupo 2-[(2-, 3-ou 4-)piridil]metila, grupo 1-[(2-, 3-ou 4-)piridil]etila, grupo 3-[(2-, 3-ou 4-)piridil]propila, grupo 4-[(2-, 3-ou 4-)piridil]butila, grupo 1,1-dimetil-2-[(2-, 3-ou 4-)piridil]etila, grupo 5-[(2-, 3-ou 4-)piridil]pentila, grupo 6-[(2-, 3-ou 4-)piridil]hexila, grupo 1-[(2-, 3-ou 4-)piridil]isopropila, grupo 2-metil-3-[(2-, 3-ou 4-)piridil]propila.

Exemplos do grupo pirazinil alquila inferior (um grupo alquila inferior pode estar presente como um substituinte no grupo pirazinil) incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos pirazinila em que 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) podem estar presentes como um substituinte(s). Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-pirazinil metila, grupo 2-(2-pirazinil)etila, grupo 1-(2-pirazinil)etila,

grupo 3-(2-pirazinil)propila, grupo 4-(2-pirazinil)butila, grupo 5-(2-pirazinil)pentila, grupo 6-(2-pirazinil)hexila, grupo 3-metil-3-(2-pirazinil)propila, grupo 1,1-dimetil-2-(2-pirazinil)etila, grupo 3-metil-2-pirazinil metila, grupo 3-etil-2-pirazinil metila, grupo 3-n-propil-2-pirazinil metila, grupo 3-n-butil-2-pirazinil metila, grupo 3-n-pentil-2-pirazinil metila, grupo 5-metil-2-pirazinil metila, grupo 5-etil-2-pirazinil metila, grupo 5-n-propil-2-pirazinil metila, grupo 5-n-butil-2-pirazinil metila, grupo 6-metil-2-pirazinil metila, grupo 6-etil-2-pirazinil metila, grupo 6-n-propil-2-pirazinil metila, grupo 6-n-butil-2-pirazinil metila, grupo 3,5-dimetil-2-pirazinil metila, grupo 3,5-dietil-2-pirazinil metila, grupo 3,5-di-n-propil-2-pirazinil metila, grupo 3,5-di-n-butil-2-pirazinil metila, grupo 2-(5-metil-2-pirazinil)etila, grupo 2-(5-etil-2-pirazinil)etila, grupo 2-(5-n-propil-2-pirazinil)etila, grupo 2-(5-n-butil-2-pirazinil)etila, grupo 3-(5-metil-2-pirazinil)propila, grupo 3-(5-etil-2-pirazinil)propila, grupo 3-(5-n-propil-2-pirazinil)propila, grupo 3-(5-n-butil-2-pirazinil)propila, grupo 4-(5-metil-2-pirazinil)butila, grupo 4-(5-etil-2-pirazinil)butila, grupo 4-(5-n-propil-2-pirazinil)butila, grupo 4-(5-n-butil-2-pirazinil)butila, grupo 5-(5-metil-2-pirazinil)pentila, grupo 5-(5-etil-2-pirazinil)pentila, grupo 5-(5-n-propil-2-pirazinil)pentila, grupo 5-(5-n-butil-2-pirazinil)pentila, grupo 6-(5-metil-2-pirazinil)hexila, grupo 6-(5-etil-2-pirazinil)hexila, grupo 6-(5-n-propil-2-pirazinil)hexila, e grupo 6-(5-n-butil-2-pirazinil)hexila.

Exemplos do grupo pirrolidinil alquila inferior (um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior pode estar presente como um substituinte no grupo pirrolidinil) incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos pirrolidinila, em que 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente

(preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) podem estar presentes como um substituinte(s). Exemplos específicos destes incluem um grupo [(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil]metila, grupo 2-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil]etila, grupo 1-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil]etila, grupo 3-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil]propila, grupo 4-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil]butila, grupo 5-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil]pentila, grupo 6-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil]hexila, grupo 1-metil-2-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil]etila, grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil]etila, grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil)propila, grupo 1-metil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 1-etil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 1-n-propil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 1-n-butil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 1-n-pentil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 1-n-hexil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 2-metil-1-pirrolidinil metila, grupo 2-etil-1-pirrolidinil metila, grupo 2-n-propil-1-pirrolidinil metila, grupo 2-n-butil-1-pirrolidinil metila, grupo 2-n-pentil-1-pirrolidinil metila, grupo 2-n-hexil-1-pirrolidinil metila, grupo 3-metil-2-pirrolidinil metila, grupo 3-etil-2-pirrolidinil metila, grupo 3-n-propil-2-pirrolidinil metila, grupo 3-n-butil-2-pirrolidinil metila, grupo 1,5-dimetil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 1,5-di-etil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 1,5-di-n-propil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 1,5-di-n-butil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 1,4,5-trietil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 1,4,5-tri-n-propil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 1,4,5-tri-n-butil-(2-ou 3-)pirrolidinil metila, grupo 3-[2-oxo-(1-pirrolidinil)propil], grupo 3-[5-oxo-(2-, 3-, ou 4-)pirrolidinil]propila, e grupo 3-[1-metil-5-oxo-(2-, 3-, ou 4-)pirrolidinil]propila.

Exemplos do grupo piperidil alquila inferior (que pode ter como um substituinte no grupo piperidinila, um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo benzoíla e um grupo alcanoíla inferior) incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2

(preferivelmente 1) grupos piperidila tendo 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos, como um substituinte(s), selecionado do grupo que consiste em um grupo benzoíla e um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) no grupo piperidinila(s). Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil metila, grupo 2-[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]etila, grupo 2-[1-benzoil-(2-, 3-, ou 4-)piperidil]etila, grupo 2-[1-acetil-(2-, 3-, ou 4-)piperidil]etila, grupo 2-[1-butiril-(2-, 3-, ou 4-)piperidil]etila, grupo 1-[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]etila, grupo 3-[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]propila, grupo 4-[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]butila, grupo 1,1-dimetil-2-[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]etila, grupo 5-[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]pentila, grupo 6-[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]hexila, grupo 1-[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]isopropila, e grupo 2-metil-3-[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]propila.

Exemplos do grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter um grupo alquila inferior como um substituinte no grupo piperazinil) incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos piperazinila, em que 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) podem estar presentes como um substituinte(s). Exemplos específicos destes incluem um grupo 1-piperazinil metila, grupo 2-piperazinil metila, grupo 2-(1-piperazinil)etila, grupo 2-(2-piperazinil)etila, grupo 1-(1-piperazinil)etila, grupo 1-(2-piperazinil)etila, grupo 3-(1-piperazinil)propila, grupo 3-(2-piperazinil)propila, grupo 4-(1-piperazinil)butila, grupo 4-(2-piperazinil)butila, grupo 2-(4-etil-2-piperazinil)etila, grupo 1-(4-n-propil-2-piperazinil)etila, grupo 2-(4-n-butil-2-piperazinil)etila, grupo 2-(4-n-pentil-2-piperazinil)etila, grupo 1-(4-n-hexil-2-piperazinil)etila, grupo 2-(5-metil-2-

piperazinil)etila, grupo 1-(5-etil-2-piperazinil)etila, grupo 2-(5-n-propil-2-piperazinil)etila, grupo 1-(5-n-butil-2-piperazinil)etila, 2-(5-n-pentil-2-piperazinil)etila, grupo 1-(5-n-hexil-2-piperazinil)etila, grupo 2-(6-metil-2-piperazinil)etila, grupo 1-(6-etil-2-piperazinil)etila, grupo 2-(6-n-propil-2-piperazinil)etila, grupo 1-(6-n-butil-2-piperazinil)etila, grupo 2-(6-n-pentil-2-piperazinil)etila, grupo 2-(6-n-hexil-2-piperazinil)etila, grupo 3-(2-metil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(2-etil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(2-n-propil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(2-n-butil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(2-n-pentil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(2-n-hexil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(3-metil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(3-etil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(3-n-propil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(3-n-butil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(3-n-pentil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(3-n-hexil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(4-metil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(4-etil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(4-n-propil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(4-n-butil-1-piperazinil)propila, grupo 3-(4-n-pentil-1-piperazinil)propila, grupo 6-(5-n-butil-2-piperazinil)hexila, grupo 6-(5-n-pentil-2-piperazinil)hexila, grupo 6-(5-n-hexil-2-piperazinil)hexila, grupo 6-(6-metil-2-piperazinil)hexila, grupo 6-(6-etil-2-piperazinil)hexila, grupo 6-(6-n-propil-2-piperazinil)hexila, grupo 6-(6-n-butil-2-piperazinil)hexila, grupo 6-(6-n-pentil-2-piperazinil)hexila, grupo 6-(6-n-hexil-2-piperazinil)hexila, grupo 2,3-dimetil-1-piperazinil metila, grupo 3,3-dimetil-1-piperazinil metila, e grupo 2-(1,3,4-trimetil-2-piperazinil)etila.

Exemplos do grupo morfolinil alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos morfolinila. Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-morfolinil metila, grupo 3-morfolinil metila, grupo 4-morfolinil metila, grupo 2-(2-morfolinil)etila, grupo 2-(3-morfolinil)etila, grupo 2-(4-morfolinil)etila, grupo 1-(2-morfolinil)etila, grupo 1-(3-morfolinil)etila, grupo

1-(4-morfolinil)etila, grupo 3-(2-morfolinil)propila, grupo 3-(3-morfolinil)propila, grupo 3-(4-morfolinil)propila, grupo 4-(2-morfolinil)butila, grupo 4-(3-morfolinil)butila, grupo 4-(4-morfolinil)butila, grupo 5-(2-morfolinil)pentila, grupo 5-(3-morfolinil)pentila, grupo 5-(4-morfolinil)pentila, grupo 6-(2-morfolinil)hexila, grupo 6-(3-morfolinil)hexila, grupo 6-(4-morfolinil)hexila, grupo 3-metil-3-(2-morfolinil)propila, grupo 3-metil-3-(3-morfolinil)propila, grupo 3-metil-3-(4-morfolinil)propila, grupo 1,1-dimetil-2-(2-morfolinil)etila, grupo 1,1-dimetil-2-(3-morfolinil)etila e grupo 1,1-dimetil-2-(4-morfolinil)etila.

Exemplo de um grupo tienil alquila inferior (que pode ter um grupo alquila inferior como um substituinte no grupo tienil) inclui um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupo tienilas, em que 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) podem estar presentes como um substituinte(s). Exemplos específicos destes incluem um grupo (2-ou 3-)tienil metila, grupo 2-[(2-ou 3-)tienil]etila, grupo 1-[(2-ou 3-)tienil]etila, grupo 3-[(2-ou 3-)tienil]propila, grupo 4-[(2-ou 3-)tienil]butila, grupo 5-[(2-ou 3-)tienil]pentila, grupo 6-[(2-ou 3-)tienil]hexila, grupo 1,1-dimetil-2-[(2-ou 3-)tienil]etila, grupo 2-metil-3-[(2-ou 3-)tienil]propila, grupo 3-metil-(2-, 4-, ou 5-)-tienil metila, grupo [5-metil-(2, 3-ou 4-)tienil]metila, grupo [4-etil-(2-ou 3-)tienil]metila, grupo [5-n-propil-(2, 3-ou 4-)tienil]metila, grupo [3-n-butil-(2-, 4-, ou 5-)-tienil]]]metila, grupo [4,5-dimetil-(2-ou 3-)tienil]metila, grupo (3,4,5-trimetil-2-tienil)metila, grupo 2-[3-metil-(2-, 4-, ou 5-)-tienil]etila, grupo 1-[4-n-pentil-(2-ou 3-)tienil]etila, grupo 3-[3-hexil-2-tienil]propila, grupo 4-[4,5-dimetil-(2-ou 3-)tienil]butila, grupo 5-(2,4,5-trimetil-3-tienil)pentila, e grupo 6-[5-etil-(2-, 3-, ou 4-)tienil]hexila.

Exemplos do grupo tiazolila incluem um grupo (2-, 4-ou 5-)

tiazolila.

Exemplos do grupo tiazolil alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos tiazolila. Exemplos específicos destes incluem um grupo (2-, 4-, ou 5-)tiazolil metila, grupo 2-[(2-, 4-, ou 5-)tiazolil)etila, grupo 1-[(2-, 4-, ou 5-)tiazolil]etila, grupo 3-[(2-, 4-, ou 5-)tiazolil]propila, grupo 4-[(2-, 4-, ou 5-)tiazolil]butila, grupo 5-[(2-, 4-, ou 5-)tiazolil)]pentila, grupo 6-[(2-, 4-, ou 5-)tiazolil)]hexila, grupo 1,1-dimetil-2-[(2-, 4-, ou 5-)tiazolil]etila, e grupo [2-metil-3-[(2-, 4-, ou 5-)tiazolil]propila.

Exemplos do grupo diidrobenzofurila incluem um grupo 2,3-diidro-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-ou 7-)benzofurila.

Exemplos do grupo diidrobenzofuril alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos diidrobenzofurila. Exemplos específicos destes incluem um grupo 2,3-diidro-4-benzofuril metila, grupo 2-(2,3-diidro-4-benzofuril)etila, grupo 3-(2,3-diidro-4-benzofuril)propila, grupo 4-(2,3-diidro-4-benzofuril)butila, grupo 5-(2,3-diidro-4-benzofuril)pentila, grupo 6-(2,3-diidro-4-benzofuril)hexila, grupo 2,3-diidro-5-benzofuril metila, grupo 2-(2,3-diidro-5-benzofuril)etila, grupo 3-(2,3-diidro-5-benzofuril)propila, grupo 4-(2,3-diidro-5-benzofuril)butila, grupo 2,3-diidro-6-benzofuril metila, grupo 2-(2,3-diidro-6-benzofuril)etila, grupo 3-(2,3-diidro-6-benzofuril)propila, grupo 4-(2,3-diidro-6-benzofuril)butila, grupo 5-(2,3-diidro-6-benzofuril)pentila, grupo 2,3-diidro-7-benzofuril metila, 2,3-diidro-7-benzofuril etila, grupo 3-(2,3-diidro-7-benzofuril)propila, grupo 4-(2,3-diidro-7-benzofuril)butila, e grupo 6-(2,3-diidro-7-benzofuril)hexila.

Exemplos do grupo benzopiranil alquila inferior (que pode ter um grupo oxo como um substituinte no grupo benzopiranila ) incluem um

grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) benzopiranila grupos em que um grupo oxo pode estar presente como um substituinte. Exemplos específicos destes incluem um grupo (4H-1-benzopiran-2-il)metila, grupo 2-(4H-1-benzopiran-2-il)etila, grupo 3-(4H-1-benzopiran-2-il)propila, grupo 4-(4H-1-benzopiran-2-il)butila, grupo 5-(4H-1-benzopiran-2-il)pentila, grupo 6-(4H-1-benzopiran-2-il)hexila, grupo (4H-1-benzopiran-3-il)metila, grupo 2-(4H-1-benzopiran-3-il)etila, grupo 3-(4H-1-benzopiran-3-il)propila, grupo 4-(4H-1-benzopiran-3-il)butila, grupo 5-(4H-1-benzopiran-3-il)pentila, grupo 6-(4H-1-benzopiran-3-il)hexila, grupo (4H-1-benzopiran-4-il)metila, grupo 2-(4H-1-benzopiran-4-il)etila, grupo 3-(4H-1-benzopiran-4-il)propila, grupo 4-(4H-1-benzopiran-4-il)butila, grupo 5-(4H-1-benzopiran-4-il)pentila, grupo 6-(4H-1-benzopiran-4-il)hexila, grupo (2H-1-benzopiran-2-il)metila, grupo 2-(2H-1-benzopiran-2-il)etila, grupo 3-(2H-1-benzopiran-2-il)propila, grupo 4-(2H-1-benzopiran-2-il)butila, grupo 5-(2H-1-benzopiran-2-il)pentila, grupo 6-(2H-1-benzopiran-2-il)hexila, grupo (2H-1-benzopiran-3-il)metila, grupo 2-(2H-1-benzopiran-3-il)etila, grupo 3-(2H-1-benzopiran-3-il)propila, grupo 4-(2H-1-benzopiran-3-il)butila, grupo 5-(2H-1-benzopiran-3-il)pentila, grupo 6-(2H-1-benzopiran-3-il)hexila, grupo (2H-1-benzopiran-4-il)metila, grupo 2-(2H-1-benzopiran-4-il)etila, grupo 3-(2H-1-benzopiran-4-il)propila, grupo 4-(2H-1-benzopiran-4-il)butila, grupo 5-(2H-1-benzopiran-4-il)pentila, grupo 6-(2H-1-benzopiran-4-il)hexila, grupo (1H-2-benzopiran-1-il)metila, grupo 2-(1H-2-benzopiran-1-il)etila, grupo 3-(1H-2-benzopiran-1-il)propila, grupo 4-(1H-2-benzopiran-1-il)butila, grupo 5-(1H-2-benzopiran-1-il)pentila, grupo 6-(1H-2-benzopiran-1-il)hexila, grupo (1H-2-benzopiran-3-il)metila, grupo 2-(1H-2-benzopiran-3-il)etila, grupo 3-(1H-2-benzopiran-3-il)propila, grupo 4-(1H-2-benzopiran-3-il)butila, grupo 5-(1H-2-benzopiran-3-il)pentila, grupo 6-(1H-2-benzopiran-3-il)hexila, grupo (1H-2-benzopiran-3-il)metila, grupo 2-(1H-2-benzopiran-4-il)etila,

grupo 3-(1H-2-benzopiran-4-il)propila, grupo 4-(1H-2-benzopiran-4-il)butila, grupo 5-(1H-2-benzopiran-4-il)pentila, grupo 6-(1H-2-benzopiran-4-il)hexila, grupo (4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)metila, grupo 2-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)etila, grupo 3-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)propila, grupo 4-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)butila, grupo 5-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)pentila, grupo 6-(4-oxo-4H-1-benzopiran-2-il)hexila, grupo (4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)metila, grupo 2-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)etila, grupo 3-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)propila, grupo 4-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)butila, grupo 5-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)pentila, grupo 6-(4-oxo-4H-1-benzopiran-3-il)hexila, grupo (4-oxo-4H-1-benzopiran-4-il)metila, grupo (2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)metila, grupo 2-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)etila, grupo 3-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)propila, grupo 4-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)butila, grupo 5-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)pentila, grupo 6-(2-oxo-2H-1-benzopiran-3-il)hexila, grupo (2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)metila, grupo 2-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)etila, grupo 3-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)propila, grupo 4-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)butila, grupo 5-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)pentila, grupo 6-(2-oxo-2H-1-benzopiran-4-il)hexila, grupo (1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)metila, grupo 2-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)etila, grupo 3-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)propila, grupo 4-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)butila, grupo 5-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)pentila, grupo 6-(1-oxo-1H-2-benzopiran-3-il)hexila, grupo (1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)metila, grupo 2-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)etila, grupo 3-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)propila, grupo 4-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)butila, grupo 5-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)pentila, e grupo 6-(1-oxo-1H-2-benzopiran-4-il)hexila.

Exemplos do grupo benzimidazolil alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos benzimidazolila. Exemplos específicos destes

incluem um grupo 1-benzimidazolil metila, grupo 2-(1-benzimidazolil)etila, grupo 3-(1-benzimidazolil)propila, grupo 4-(1-benzimidazolil)butila, grupo 5-(1-benzimidazolil)pentila, grupo 6-(1-benzimidazolil)hexila, grupo 2-benzimidazolil metila, grupo 2-(2-benzimidazolil)etila, grupo 3-(2-benzimidazolil)propila, grupo 4-(2-benzimidazolil)butila, grupo 5-(2-benzimidazolil)pentila, e grupo 6-(2-benzimidazolil)hexila.

Exemplos do grupo indolil alquila inferior que pode ter um grupo alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior incluem um grupo alquila inferior (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) da forma ilustrada anteriormente que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente grupo alcoxicarbonila reto ou ramificados tendo 1 a 6 átomos de carbono) que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos indolila. Exemplos específicos destes incluem um grupo indol (-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, ou -7-)il metila, grupo 2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, ou -7-)il etila, grupo 3-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, ou -7-)il propila, grupo 4-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, ou -7-)il butila, grupo 5-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, ou -7-)il pentila, grupo 6-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, ou -7-)il exila, grupo 3-metil-3-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, ou -7-)il propila, grupo 1,1-dimetil-2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, ou -7-)il etila, e grupo 1-metoxicarbonil-2-indol(-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6-, ou -7-)il etila.

Exemplos do grupo imidazolil alquila inferior tendo um substituinte selecionado do grupo que consiste em um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior incluem um grupo imidazolil alquila inferior tendo um 1 a 3, preferivelmente 1, substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente no grupo alquila cuja fração alquila inferior é a mesma que a ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de

carbono. Exemplos específicos destes incluem um grupo carbamoil-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo metoxicarbonil-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo etoxicarbonil-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo n-butoxicarbonil-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo isobutoxicarbonil-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo terc-butoxicarbonil-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo sec-butoxicarbonil-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo n-pentiloxicarbonil-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo neopentilóxi-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo n-etiloxicarbonil-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo isoetiloxicarbonil-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo 3-metil pentiloxicarbonil-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] metila, grupo 1-carbamoil-2-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] etila, grupo 1-metoxicarbonil-2-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] etila, grupo 1,1-dimetoxicarbonil-2-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] etila, grupo 1,1-dicarbamoil-2-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] etila, grupo 2-carbamoil-1-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] etila, grupo 2-metoxicarbonil-3-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil]propila, grupo 2-carbamoil-4-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil]butila, grupo 1-metil-1-carbamoíla metil-2-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] etila, grupo 2-metoxicarbonil-5-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil]pentila, grupo 3-carbamoil-6-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil]hexila, grupo 2-metoxicarbonil-1-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil] isopropila, e grupo 2-carbamoíla metil-3-[(1-, 2-, 4-, ou 5-)imidazolil]propila.

Exemplos do grupo piridila que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo alcóxi inferior, e grupo alquiltio inferior alquila inferior, como um substituinte incluem um grupo piridila que pode ter 1 a 4 (preferivelmente 1) grupos, como um substituinte(s), que são selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi

reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), e um grupo alquiltio inferior alquila inferior em que as duas frações alquila inferior cada uma são compostas de um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-piridila, grupo 3-piridila, grupo 4-piridila, grupo 4-metil-2-piridila, grupo 5-metil-2-piridila, grupo 5-etil-3-piridila, grupo 2-n-propil-3-piridila, grupo 4-n-butil-2-piridila, grupo 4-terc-butil-2-piridila, grupo 5-n-pentil-3-piridila, grupo 4-n-hexil-2-piridila, grupo 4-metóxi-2-piridila, grupo 5-metóxi-2-piridila, grupo 2-metiltiometil-3-piridila, grupo 5-etiltiometil-2-piridila, grupo 4-n-propiltiometil-2-piridila, grupo 3-n-butiltiometil-2-piridila, grupo 5-n-pentiltiometil-3-piridila, grupo 4-n-exiltiometil-3-piridila, grupo 2-(2-metiltioetil)-3-piridila, grupo 2-(3-metiltiopropil)-4-piridila, grupo 3-(4-metiltiobutil)-4-piridila, grupo 3-(5-metiltiopentil)-2-piridila, grupo 4-(6-metiltioexil)-2-piridila, grupo 3,4-dimetil-2-piridila, grupo 2,4,6-trietil-3-piridila, grupo 2,3,5,6-tetrametil-4-piridila, e grupo 2-metil-3-metiltiometil-4-piridila.

Exemplos do grupo pirrolidinila que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo alcoxicarbonila inferior, grupo alcanoíla inferior, e grupo aroíla como um substituinte incluem um grupo pirrolidinila que pode ter 1 a 3, preferivelmente 1 grupo, como um substituinte(s), que é selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), um grupo alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcoxicarbonila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) um grupo alcanoíla inferior da forma descrita anteriormente (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), e um grupo aroíla (preferivelmente um grupo

benzoíla). Exemplos específicos destes incluem um grupo pirrolidin-1-ila, grupo pirrolidin-2-ila, grupo pirrolidin-3-ila, grupo 1-metil pirrolidin-3-ila, grupo 2-etil pirrolidin-3-ila, grupo 3-n-propil pirrolidin-3-ila, grupo 4-n-butil pirrolidin-3-ila, grupo 1-terc-butil pirrolidin-3-ila, grupo 5-n-pentil pirrolidin-3-ila, grupo 1-n-exil pirrolidin-2-ila, grupo 2-metoxicarbonil-2-ila, grupo 3-etoxicarbonil pirrolidin-2-ila, grupo 1-terc-butoxicarbonil pirrolidin-3-ila, grupo 4-propoxicarbonil pirrolidin-2-ila, grupo 5-butoxicarbonil pirrolidin-2-ila, grupo 1-pentoxicarbonil-2-ila, grupo 2-etiloxicarbonil pirrolidin-2-ila, grupo 1,3-dimetoxicarbonil pirrolidin-2-ila, grupo 3,4,5-trietil pirrolidin-2-ila, grupo 2,3,4,5-tetrametil pirrolidin-1-ila, grupo 2,4-dimetoxicarbonil pirrolidin-1-ila, grupo 3,4,5-trietoxicarbonil pirrolidin-1-ila, grupo 2-metil-4-metoxicarbonil pirrolidin-1-ila, grupo 1-benzoil pirrolidin-3-ila, grupo 1-acetil pirrolidin-3-ila, e grupo 1-butiril pirrolidin-3-ila.

Exemplos do grupo piperidila que pode ter um grupo como um substituinte selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, e um grupo aroíla que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um átomo de halogênio incluem um grupo piperidila que pode ter 1 a 5 (preferivelmente 1 a 4) grupos, como um substituinte(s), que são selecionado do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono); e

um grupo aroíla que pode ter 1 a 3 grupos (preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente e um átomo de halogênio da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo benzoíla). Exemplos específicos destes incluem um 1-grupo piperidila, grupo 2-piperidila, grupo 3-piperidila, grupo 4-piperidila, grupo 1-metil-4-piperidila, grupo 2-etil-4-piperidila, grupo 3-n-propil-4-piperidila, grupo 4-n-butil-4-piperidila, grupo 1-n-pentil-4-piperidila, grupo 2-n-hexil-4-piperidila, grupo 1-metoxicarbonil-4-piperidila, grupo 1-etoxicarbonil-4-piperidila, grupo 4-n-propoxicarbonil-4-piperidila, grupo 5-n-butoxicarbonil-4-piperidila, grupo 1-terc-butoxicarbonil-4-piperidila, grupo 1-formil-4-piperidila, grupo 1-acetil-4-piperidila, grupo 1-butiril-4-piperidila, grupo 1-butiril-3-piperidila, grupo 2-propionil-4-piperidila, grupo 3-butiril-4-piperidila, grupo 4-isobutiril-4-piperidila, grupo 1-n-pentanoil-4-piperidila, grupo 2-terc-butil carbonil-4-piperidila, grupo 3-n-hexanoil-4-piperidila, grupo 1-benzoil-4-piperidila, grupo 1-benzoil-3-piperidila, grupo 1-(2-, 3-, ou 4-clorobenzoil)-4-piperidila, grupo 1-(2-, 3-, ou 4-fluorbenzoil)-4-piperidila, grupo 1-(2-, 3-, ou 4-metil benzoil)-4-piperidila, grupo 2,6-dimetil-4-piperidila, grupo 2,4,6-trimetil-3-piperidila, grupo 2,2,6,6-tetrametil-4-piperidila, e grupo 2,2,4,4,6-pentametil-3-piperidila.

Exemplos do grupo tetraidrofurila que pode ter um grupo oxo incluem um grupo 2-tetraidrofurila, grupo 3-tetraidrofurila, grupo 3-oxo-2-tetraidrofurila, grupo 4-oxo-2-tetraidrofurila, grupo 5-oxo-2-tetraidrofurila, grupo 2-oxo-3-tetraidrofurila, grupo 4-oxo-3-tetraidrofurila, e grupo 5-oxo-4-tetraidrofurila.

Exemplos do grupo hexaidroazepinila que pode ter um grupo oxo incluem grupo 2-hexaidroazepinila, grupo 3-hexaidroazepinila, grupo 4-hexaidroazepinila, grupo 2-oxo-3-hexaidroazepinila, grupo 3-oxo-2-hexaidroazepinila, grupo 4-oxo-2-hexaidroazepinila, grupo 5-oxo-2-hexaidroazepinila, e grupo 6-oxo-2-hexaidroazepinila.

Exemplos do grupo pirazolila que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, arila grupo, e grupo furila como um substituinte incluem um grupo pirazolila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos, como um substituinte(s), que são selecionado do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo arila da forma ilustrada anteriormente; e

um grupo furila. Exemplos específicos destes incluem um grupo 1- pirazolila, grupo 3-pirazolila, grupo 4-pirazolila, grupo 1-metil-5-pirazolila, grupo 1-etil-5- pirazolila, grupo 3-n-propil-5- pirazolila, grupo 4-n-butil-5- pirazolila, grupo 1-terc-butil- 4-pirazolila, grupo 1-n-pentil- 4-pirazolila, grupo 3-n-hexil- 4-pirazolila, grupo 3-fenil-5- pirazolila, grupo 1-(2-naftil)- 3-pirazolila, grupo 4-(2-metil fenil)- 3-pirazolila, grupo 5-(3-etil fenil)- 3-pirazolila, grupo 1-(4-n-propil fenil)- 4-pirazolila, grupo 3-(2-n-butil fenil)- 4-pirazolila, grupo 5-(3-n-pentil fenil)- 4-pirazolila, grupo 1-(4-n-exil fenil)-5- pirazolila, grupo 3-(2-isobutil fenil)-5- pirazolila, grupo 4-(3-terc-butil fenil)-5- pirazolila, grupo 3-(2-clorofenil)-1- pirazolila, grupo 4-(3-fluorfenil)-1- pirazolila, grupo 5-(4-bromofenil)-1- pirazolila, grupo 1-(2-aminofenil)- 3-pirazolila, grupo 4-(2,3-dimetil fenil)- 3-pirazolila, grupo 5-(3,4,5-trimetil fenil)- 3-pirazolila, grupo 1-(2,3-diaminofenil)- 4-pirazolila, grupo 3-(2-furil)-5- pirazolila, grupo 1,3-dimetil-5- pirazolila, grupo 1,3,4-trietil-5- pirazolila, grupo 1,3,5-trimetil- 4-pirazolila, e grupo 1-metil-3-fenil-5- pirazolila.

Exemplos do grupo tiadiazolila incluem um grupo 1,2,3-tiadiazolila, grupo 1,2, 4-tiadiazolila, grupo 1,2,5- tiadiazolila ou grupo 1,3, 4-tiadiazolila.

Exemplos do grupo tiadiazolila que pode ter um grupo alquila

inferior incluem um grupo tiadiazolila da forma ilustrada anteriormente que pode ter 1 a 3, preferivelmente 1, grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo 4-ou 5-(1, 2, 3-tiadiazolila), grupo 3-ou 5-(1, 2, 4-tiadiazolila), grupo 3-(1, 2, 5-tiadiazolila), grupo 2-(1, 3, 4-tiadiazolila), grupo 5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-ila, grupo 4-etil-1,2,3-tiadiazol-5-ila, grupo 5-n-propil-1,2,4-tiadiazol-3-ila, grupo 5-n-butil-1,3,4-tiadiazol-2-ila, grupo 4-terc-butil-1,2,3-tiadiazol-5-ila, grupo 5-n-pentil-1,2,4-tiadiazol-3-ila, e grupo 5-n-hexil-1,3,4-tiadiazol-2-ila.

Exemplos de um grupo isoxazolila que pode ter um grupo alquila inferior incluem um grupo isoxazolila que pode ter 1 a 2 grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo 3-isoxazolila, grupo 4-isoxazolila, grupo 5-isoxazolila, grupo 3-metil-5- isoxazolila, grupo 4-etil-5- isoxazolila, grupo 4-n-propil- 3-isoxazolila, grupo 5-metil- 3-isoxazolila, grupo 5-n-butil- 3-isoxazolila, grupo 3-terc-butil- 4-isoxazolila, grupo 5-n-pentil- 4-isoxazolila, grupo 3-n-hexil-5- isoxazolila, e grupo 3,4-dimetil-5- isoxazolila.

Exemplos do grupo indazolila incluem um grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-ou 7-) indazolila.

Exemplos do grupo tetraidrobenzotiazolila incluem um grupo (2-, 4-, 5-, 6-, ou 7-)(4,5,6,7-tetraidrobenzotiazolila).

Exemplos do grupo tetraidroquinolila incluem um grupo (1-, 2-, 4-, 5-, 6-ou -8)(1, 2, 3, 4-tetraidroquinolila.

Exemplo de um grupo tetraidroquinolila que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo alcóxi inferior, átomo de halogênio e grupo oxo como um substituinte incluem um grupo tetraidroquinolila da forma ilustrada anteriormente que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos, como um substituinte(s), que

são selecionado do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono); um átomo de halogênio; e

um grupo oxo. Exemplos específicos destes incluem um grupo 1-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 2-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 3-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 4-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 5-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 6-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 7-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 8-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 2-metil-3-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 3-etil-2-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 4-n-propil-2-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 5-n-butil-3-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 6-terc-butil-3-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 7-n-pentil-2-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 8-n-hexil-2-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 2-metóxi-4-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 3-etóxi-4-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 4-propóxi-5-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 5-butóxi-6-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 6-pentóxi-7-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 7-etilóxi-8-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 4-oxo-3-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 2-oxo-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 2-oxo-8-metil-(3-, 4-, 5-, 6-, ou 7-)-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 2-oxo-8-metóxi-3-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 2-oxo-5-metóxi-(1-, 3-, 4-, 6-, 7-, ou 8-)-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), grupo 2-oxo-8-flúor-(3-, 4-, 5-, 6-, ou 7-)-(1,2,3,4-tetraidroquinolila), e grupo 2-oxo-6,8-dimetil-3-(1,2,3,4-tetraidroquinolila).

Exemplos do grupo quinolila incluem um grupo 2-quinolila, grupo 3-quinolila, grupo 4-quinolila grupo, 5- quinolila, grupo 6- quinolila, grupo 7- quinolila, e grupo 8- quinolila. Exemplos do grupo quinolila que

pode ter um grupo alquila inferior incluem um grupo quinolila que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente grupo alquila reto ou ramificados tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-ou 8- quinolila, grupo 2-metil-6- quinolila, grupo 4-etil-5- quinolila, grupo 4-n-propil- 3-quinolila, grupo 5-metil- 3-quinolila, grupo 5-n-butil- 3-quinolila, grupo 3-terc-butil- 4-quinolila, grupo 5-n-pentila-1- 4-quinolila, grupo 3-n-hexil-5- quinolila e grupo 3,4-dimetil-5- quinolila.

Exemplos do grupo benzodioxolil alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos benzodioxolila. Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-, 4-ou 5-(1,3-benzodioxolil) metila, grupo 2-(2-, 4-ou 5-)(1,3-benzodioxolil) etila e grupo 3-(2-, 4-ou 5-)(1,3-benzodioxolil) propila.

Exemplos do grupo arila que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um átomo de halogênio; um grupo alquila inferior; um grupo alcóxi inferior; um grupo alquila inferior substituído por halogênio; um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio; um grupo alquenila inferior; um grupo amino que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquilsulfonila inferior, grupo alquila inferior, e arila grupo; um grupo sulfamoíla; um grupo alquiltio inferior; um grupo alcanoíla inferior; um grupo alcoxicarbonila inferior; um pirrolila grupo; grupo alquinila inferior; grupo ciano, grupo nitro; grupo arilóxi; arila grupo alcóxi inferior; grupo hidróxi; grupo hidróxi alquila inferior; grupo carbamoíla que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo arila; grupo pirazolila; grupo pirrolidinila que pode ter um grupo oxo; grupo oxazolila; grupo imidazolila que pode ter um grupo alquila inferior; grupo diidrofurila que pode ter um grupo oxo; grupo tiazolidinil alquila inferior que pode ter um grupo oxo; grupo imidazolil alcanoíla

inferior; e grupo piperidinil carbonila incluem um grupo arila da forma ilustrada anteriormente que pode ter 1 a 7, preferivelmente 1 a 5, mais preferivelmente, 1 a 2 grupos, como um substituinte(s), que são selecionado do grupo que consiste em

um átomo de halogênio da forma ilustrada anteriormente;

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alquila inferior substituído por halogênio da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono substituído por 1 a 7 átomos de halogênio);

um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono substituído por 1 a 7 átomos de halogênio);

um grupo alquenila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquenila reto ou ramificado tendo 1 a 3 ligações duplas e 2 a 6 átomos de carbono (incluindo configurações tanto trans quanto cis));

um grupo amino tendo 1 a 2 grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente, grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente, e arila grupos da forma ilustrada anteriormente;

um grupo sulfamoíla;

um grupo alquiltio inferior cuja fração alquila inferior é um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente

(preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcoxicarbonila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono); um grupo pirrolila; um grupo alquinila da forma ilustrada a seguir; grupo ciano; grupo nitro; grupo arilóxi cuja fração arila é da forma ilustrada anteriormente; grupo aril alcóxi inferior cuja fração arila e fração alcóxi inferior são da forma ilustrada anteriormente; grupo hidróxi; um grupo hidróxi alquila inferior cuja fração alquila inferior é da forma ilustrada anteriormente; um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente e arila grupo da forma ilustrada anteriormente; grupo pirazolila; grupo pirrolidinila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos oxo; grupo oxazolila; grupo imidazolila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente; grupo diidrofurila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos oxo; grupo tiazolidinila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos oxo e tendo uma fração alquila inferior da forma ilustrada anteriormente; grupo imidazolil alcanoíla inferior cuja fração alcanoíla é da forma ilustrada anteriormente e grupo piperidinil carbonila. Exemplos específicos destes incluem um grupo fenila, grupo 1- naftila, grupo 2- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)bi fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)cloro fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)fluorfenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)bromo fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) metil fenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)etil-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-) n-propil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) n-butil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) n-pentil fenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-hexil-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-) isobutil fenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)terc-butil-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)metóxi fenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)etóxi-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-propóxi fenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)isopropóxi-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-

butóxi fenila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)isobutóxi- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)terc-butóxi fenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)sec-butóxi-1-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-pentilóxi fenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)isopentilóxi-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)neopentilóxi fenila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-etilóxi- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)isoetilóxi fenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)(3-metil pentilóxi)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)clorometil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)trifluormetil fenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)fluoretil-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-bromopropil) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(4-clorobutil) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(5-fluorpentil) fenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)(6-bromoexil)-1-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1,1-dimetil-2-cloroetil) fenila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)(2-metil-3-fluorpropil)- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)clorometoxi fenila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)(2-fluoretóxi)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-bromopropóxi) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(4-clorobutóxi) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(5-fluorpentilóxi) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)trifluormetoxi fenila, grupo 4-(6-bromoetilóxi)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1,1-dimetil-2-cloroetóxi) fenila, grupo 7-(2-metil-3-fluorpropóxi)- 2-naftila, grupo 2-vinil fenila, grupo 2-(1-metil vinil) fenila, grupo 2-(1-propenil)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1-metil-1-propenil) fenila, grupo 3-(2-metil-1-propenil)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1-propenil) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(2-propenil) fenila grupo, 4-(2-butenil)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1-butenil) fenila, grupo 5-(3-butenil)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(2-pentenil) fenila, grupo 6-(1-pentenil)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-pentenil) fenila, grupo 7-(4-pentenil)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1,3-butadienil) fenila, grupo 8-(1,3-pentadienil)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(2-penten-4-inil) fenila, 1-(2-hexenil)-grupo 2-naftila, grupo 4-(1-hexenil) fenila, um grupo 3-(5-hexenil)- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-hexenila), grupo 4-(4-hexenil)- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3,3-dimetil-1-propenil) fenila, grupo 5-(2-etil-1-propenil)- grupo 2-naftila, 4-(1,3,5-hexatrienil) fenila, grupo

6-(1,3-hexadienil)- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1,4-hexadienil) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-formilamino) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-acetilamino) fenila, grupo 7-(N-acetilamino)- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-propionilamino) fenila, grupo 8-(N-butirilamino)- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-isobutirilamino) fenila, grupo 2-(N-pentanoilamino)-1- naftila grupo, (2-, 3-, ou 4-)(N-terc-butil carbonilamino) fenila, grupo 3-(N-hexanoilamino)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N,N-diformilamino) fenila, grupo 4-(N,N-diacetilamino)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N,N-dimetilamino) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-fenilamino) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-) sulfamoil fenila, grupo 5-sulfamoil-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)metiltio fenila, grupo 6-etiltio-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-propiltio fenila, grupo 7-isopropiltio-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-butiltio fenila, grupo 8-terc-butiltio-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-pentiltio fenila, grupo 1-n-hexiltio- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-metil(sulfonilamino) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)formil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)acetil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)butiril fenila, grupo 3-acetil- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)propionil fenila, grupo 4-butiril- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)isobutiril fenila, grupo 5-pentanoil- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)ciano fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)metoxicarbonil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)terc-butil carbonil fenila, grupo 6-hexanoil- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)etoxicarbonil fenila, grupo 7-etoxicarbonil- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-propoxicarbonil fenila, grupo 8-isopropoxicarbonil- 2-naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-butoxicarbonil fenila, grupo 2-isobutoxicarbonil-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)terc-butoxicarbonil fenila, grupo 3-sec-butoxicarbonil-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-pentiloxicarbonil fenila, grupo 4-neopentilóxi-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-etiloxicarbonil fenila, grupo 5-isoetiloxicarbonil-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-metil pentiloxicarbonil) fenila, grupo 6-(1-pirrolil)-1- naftila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1-pirrolil) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)etinil fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-metil carbamoil) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-fenil carbamoil)

fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(2-hidroxietil) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)fenóxi fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)nitro fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)benzilóxi fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)hidróxi fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(2-oxo-2,5-diidrofuran-4-il) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1-imidazolila acetil) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(2,4-dioxotiazolidin-5-il metil) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil carbonil] fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(1-, 3-, 4-, ou 5-)pirazolil] fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[2-oxo-(1-ou 3-)pirrolidinil] fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 4-, ou 5-)oxazolil] fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(2-etil-4-metil imidazol-1-il) fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)bifenila, grupo 2,3-dimetóxi fenila, grupo 2,4-dimetoxifenila, grupo 2,5-dimetóxi fenila, grupo 2,6-dimetóxi fenila, grupo 3,4-dimetóxi fenila, grupo 3,5-dimetóxi fenila, grupo 2,3-dicloro fenila, grupo 2,4-dicloro fenila, grupo 3,4-dicloro fenila, grupo 2-metóxi-5-cloro fenila, grupo 2-metóxi-5- metil fenila, grupo 2-metóxi-5-acetilamino fenila, grupo 2-vinil- 4-metil fenila, grupo 2-vinil-5- etil fenila, grupo 2,6-di sulfamoil fenila, grupo 2,4,6-trimetóxi fenila, grupo 3,4,5-trietoxifenila, grupo 2-vinil-3,4,5-tri etil fenila, grupo pentametóxi fenila, grupo 2-vinil naftila, grupo 2,3-dimetóxi-1- naftila, grupo 3,4-dietóxi fenila, grupo 2-metóxi-5-metoxicarbonil fenila, grupo 3,5-dimetoxicarbonil fenila, grupo 3-cloro-4-hidróxi fenila, grupo 2-cloro-5-(N-acetilamino) fenila, grupo 2-cloro-5-ciano fenila, grupo 2-cloro-5- carbamoíla fenila, grupo 2-metóxi-5-(N-acetilamino) fenila, grupo 2-cloro-5-etoxicarbonil fenila, grupo 3,5,7-trietóxi-1- naftila, grupo 3,4,5,7-tetrametil-1- naftila, grupo 2,3,4,5-tetrametil-7-(N-pentaacetilamino)-1- naftila, grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetóxi-1- naftila, e grupo heptametóxi-1- naftila.

Exemplos do grupo ciano alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo um único grupo ciano. Exemplos específicos destes incluem um grupo ciano metila, grupo 2-ciano etila, grupo 1-ciano etila, grupo 3-cianopropila, grupo 4-

cianobutila, grupo 1,1-dimetil-2 ciano etila, grupo 5-cianopentila, grupo 6-cianoexila, grupo 1- ciano isopropila, e grupo 2-metil-3-cianopropila.

Exemplos do grupo alcanoil inferior amino alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3, preferivelmente 1, grupos amino que tem 1 a 2 grupos alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-(N-formilamino) etila, grupo 2-(N-acetilamino) etila, grupo 2-(N-propionilamino) etila, grupo 2-(N-butirilamino) etila, grupo 2-(N-isobutirilamino) etila, grupo 2-(N-pentanoilamino) etila, grupo 2-(N-terc-butil carbonilamino) etila, grupo 2-(N-hexanoilamino) etila, grupo N-acetilamino metila, grupo 1-(N-acetilamino) etila, grupo 3-(N-acetilamino)propila grupo, 4-(N-acetilamino)butila, grupo 5-(N-acetilamino)pentila, grupo 6-(N-acetilamino)hexila, grupo 1,1-dimetil-2-(N-acetilamino) etila, grupo 2-metil-3-(N-acetilamino)propila, e grupo 2 -(N,N-diacetilamino) etila.

Exemplos de um grupo alquil inferior amino substituído por halogênio incluem um grupo amino tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior substituídos por halogênio da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila substituído por halogênio reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono com 1 a 7 (preferivelmente 1 a 3) átomos de halogênio). Exemplos específicos destes incluem um grupo N-flúor metilamino, grupo N-diflúor metilamino, grupo N-triflúor metilamino, grupo N-clorometilamino, grupo N-diclorometilamino, grupo N-tricloro metilamino, grupo N-bromometilamino, grupo N-dibromo metilamino, grupo N-dicloroflúor metilamino, grupo N-2,2,2-triflúor etilamino, grupo N-pentaflúor etilamino, grupo N-2-cloro etilamino, grupo N-3,3,3-triflúorpropilamino, grupo N-heptaflúorpropilamino, grupo N-heptaflúor isopropilamino, grupo N-

3-cloropropilamino, grupo N-2-cloropropilamino, grupo N-3-bromopropilamino, grupo N-4,4,4-trifluorbutilamino, grupo N-4,4,4,3,3-pentafluorbutilamino, grupo N-4-clorobutilamino, grupo N-4-bromobutilamino, grupo N-2-clorobutilamino, grupo N-5,5,5-trifluorpentilamino, grupo N-5-cloropentilamino, grupo N-6,6,6-trifluorexilamino, grupo N-6-cloroexilamino, grupo N-(1,1-dimetil-2-cloroetil) amino, grupo N-(2-metil-3-fluorpropil) amino, e grupo N,N-di(fluormetil) amino.

Exemplos do grupo alquiltio inferior alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3 grupos alquiltio inferior cuja fração alquila é um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um 2-grupo metiltio etila, grupo 2-etiltio etila, grupo 2-n-propiltioetila, grupo 2-n-butiltio etila, grupo 2-terc-butiltio etila, grupo 2-n-pentiltio etila, grupo 2-n-exiltio etila, grupo metiltio metila, grupo 1-metiltio etila, grupo 3-metiltiopropila, grupo 4-metiltiobutila, grupo 5-metiltiopentila, grupo 6-metiltioexila, grupo 1,1-dimetil-2-metiltio etila, grupo 2-metil-3-metiltiopropila, grupo 2,2-dietiltio etila, e grupo 2,2,2-trietiltio etila.

Exemplos do grupo amidino que pode ter um grupo alquila inferior incluem um grupo amidino que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo amidino, grupo N- metil amidino, grupo N- etil amidino, grupo N- n-propil amidino, grupo N- n-butil amidino, grupo N- n-pentil amidino, grupo N-n-exil amidino, grupo N- isopropil amidino, grupo N- terc-butil amidino, grupo N,N-dimetil amidino, grupo N,N'-dimetil amidino, e grupo N-metil-N'-etil- amidino.

Exemplos do grupo amidino alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3 grupos amidino. Exemplos específicos destes incluem um grupo amidino metila, grupo 2-amidino etila, grupo 3-amidinopropila, grupo 4-amidinobutila, grupo 5-amidinopropila, grupo 6-amidinoexila, grupo 1-amidino etila, grupo 1,1-dimetil- 2-amidino etila, grupo 2-metil-3-amidinopropila, grupo 2,2-diamidino etila, e grupo 2,2,2-triamidino etila.

Exemplos do grupo alquenil inferior óxi incluem um grupo alquenil inferior óxi cuja fração alquenila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquenilóxi reto ou ramificado tendo 1 a 3 ligações duplas e 2 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo vinilóxi, grupo 1-propenilóxi, grupo 1-metil-1-propenilóxi, grupo 2-metil-1-propenilóxi, grupo 2-propenilóxi, grupo 2-butenilóxi, grupo 1-butenilóxi, grupo 3-butenilóxi, grupo 2-pentenilóxi, grupo 1-pentenilóxi, grupo 3-pentenilóxi, grupo 4-pentenilóxi, grupo 1,3-butadienilóxi, grupo 1, 3-pentadienilóxi, grupo 2-penten-4-inilóxi, grupo 2-hexenilóxi, grupo 1-hexenilóxi, grupo 5-hexenilóxi, grupo 3-hexenilóxi, grupo 4-hexenilóxi, grupo 3,3-dimetil-1-propenilóxi, grupo 2-etil-1-propenilóxi, grupo 1,3,5-hexatrienilóxi, grupo 1,3-hexadienilóxi, e grupo 1,4-hexadienilóxi.

Exemplos do grupo alquenil inferior óxi alquila inferior incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3 grupos alquenil inferior óxi cuja fração alquenilóxi inferior é um grupo alquenil inferior óxi da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquenila reto ou ramificado tendo 2 a 6 átomos de carbono e 1 a 3 ligações duplas). Exemplos específicos destes incluem um grupo vinilóxi metila, grupo 2-viniloxietila, grupo 2-(1-propenilóxi) etila,

grupo 2-(1-metil-1-propenilóxi) etila, grupo 2-(2-metil-1-propenilóxi) etila, grupo 2-(2-propenilóxi) etila, grupo 2-(2-butenilóxi) etila, grupo 2-(1-butenilóxi) etila, grupo 2-(3-butenilóxi) etila, grupo 2-(2-pentenilóxi) etila, grupo 2-(1-pentenilóxi) etila, grupo 2-(3-pentenilóxi) etila, grupo 2-(4-pentenilóxi) etila, grupo 2-(1,3-butadienilóxi) etila, grupo 2-(1,3-pentadienilóxi) etila, grupo 2-(2-penten-4-inilóxi) etila, grupo 2-(2-hexenilóxi) etila, grupo 2-(1-hexenilóxi) etila, grupo 2-(5-hexenilóxi) etila, grupo 2-(3-hexenilóxi) etila, grupo 2-(4-hexenilóxi) etila, grupo 2-(3,3-dimetil-1-propenilóxi) etila, grupo 2-(2-etil-1-propenilóxi) etila, grupo 2-(1,3,5-hexatrienilóxi) etila, grupo 2-(1,3-hexadienilóxi) etila, grupo 2-(1,4-hexadienilóxi) etila, grupo 3-viniloxipropila, grupo 4-viniloxibutila, grupo 5-viniloxipropila, grupo 6-viniloxiexila, grupo 1-viniloxietila, grupo 1,1-dimetil-2-viniloxietila, grupo 2-metil-3-viniloxipropila, grupo 2,2-diviniloxietila, e grupo 2,2,2-triviniloxietila.

Exemplos do grupo arilamino que pode ter um substituinte selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo alcóxi inferior, grupo alquila inferior substituído por halogênio, e grupo alcóxi inferior substituído por halogênio no grupo arila incluem

um grupo amino tendo 1 a 2 arila grupos da forma ilustrada anteriormente que pode ter 1 a 7, preferivelmente 1 a 5, mais preferivelmente 1 a 2 substituintes, no grupo arila, que são selecionado do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alquila substituído por halogênio da forma ilustrada

anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono com 1 a 7, preferivelmente 1 a 3 átomos de halogênio); e

grupo alcóxi inferior substituído por halogênio da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono com 1 a 7, preferivelmente 1 a 3 átomos de halogênio). Exemplos específicos destes incluem um grupo N- fenilamino, grupo N-2-naftilamino, grupo N-(2-metil fenil) amino, grupo N-(3-etil-1-naftil) amino, grupo N-(4-n-propil fenil) amino, grupo N-(2-n-butil-1-fenil) amino, grupo N-(3-n-pentil fenil) amino, grupo N-(4-n-hexil-1-naftil) amino, grupo N-(2-isobutil fenil) amino, grupo N-(3-terc-butil-1-naftil) amino, grupo N-(2-metoxifenil) amino, grupo N-(3-etóxi-1-naftil) amino, grupo N-(4-n-propoxifenil) amino, grupo N-(3-isopropóxi-1-naftil) amino, grupo N-(n-butoxifenil) amino, grupo N-(1-isobutóxi-2-naftil) amino, grupo N-(terc-butoxifenil) amino, grupo N-(5-sec-butóxi-1-naftil) amino, grupo N-(n-pentiloxifenil) amino, grupo N-(5-isopentilóxi-1-naftil) amino, grupo N-(1-neopentiloxifenil) amino, grupo N-(6-n-etilóxi-2-naftil) amino, grupo N-(isoetiloxifenil) amino, grupo N-(3-metil pentilóxi-1-naftil) amino, grupo N-(2-trifluormetil fenil) amino, grupo N-(4-trifluormetil fenil) amino, grupo N-(2-clorometil fenil) amino, grupo N-[3-(2-fluoretil)-1-naftil] amino, grupo N-[4-(3-bromopropil)fenil] amino, grupo N-[2-(4-clorobutil)-1-fenil] amino, grupo N-[3-(5-fluorpentil)fenil] amino, grupo N-[4-(6-bromoexil)-1-naftil] amino, grupo N-[2-(1,1-dimetil-2-cloroetil)fenil] amino, grupo N-[7-(2-metil-3-fluorpropil)-2-naftil] amino, grupo N-(2-clorometoxifenil) amino, grupo N-(4-trifluormetoxifenil) amino, grupo N-(3-(2-fluoretóxi)-1-naftil) amino, grupo N-[4-(3-bromopropóxi)fenil] amino, grupo N-[2-(4-clorobutóxi)-1-fenil] amino, grupo N-[3-(5-fluorpentilóxi)fenil] amino, grupo N-[4-(6-bromoetilóxi)-1-naftil] amino, grupo N-[2-(1,1-dimetil-2-cloroetóxi)fenil] amino, grupo N-[7-(2-metil-3-fluorpropóxi)-2-naftil] amino, grupo N-(2-clorometoxifenil) amino, grupo N-[3-(2-fluoretóxi)-1-naftil] amino, grupo N-

[4-(3-bromopropóxi)fenil] amino, grupo N-[2-(4-clorobutóxi)-1-fenil] amino, grupo N-[3-(5-fluorpentilóxi)fenil] amino, grupo N-[4-(6-bromoetilóxi)-1-naftil] amino, grupo N-[2-(1,1-dimetil-2-cloroetóxi)fenil] amino, grupo N-[7-(2-metil-3-fluorpropóxi)-2-naftil] amino, e grupo N,N-difenilamino.

Exemplos do grupo aril alquenila inferior incluem um grupo alquenila inferior da forma ilustrada anteriormente tendo um grupo arila da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquenila reto ou ramificado tendo 1 a 3 arila grupos e 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-fenil etenila, grupo 3-fenil-2-propenila, grupo 3-[(1-ou 2-)naftil]-2-propenila, grupo 4-[(2-, 3-, ou 4-)metil fenil]-2-butenila, grupo 4-[(2-, 3-, ou 4-)etil fenil]-3-butenila, grupo 4-[(2-, 3-, ou 4-)n-propil fenil]-1,3-butadienila, grupo 5-[(2-, 3-, ou 4-)n-butil fenil]-1,3,5-hexatrienila, grupo 5-[(2-, 3-, ou 4-)n-pentil fenil]-2,4-hexadienila, grupo 5-[(2-, 3-, ou 4-)n-exil fenil]-3-pentenila, grupo 3-[(2-, 3-, ou 4-)isobutil fenil]-2-propenila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)terc-butil fenil] fenila, grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)metil-1-naftil]-2-propenila, grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)metil-2-naftil]-2-butenila, grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)etil-1-naftil]-3-butenila, grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)etil-2-naftil]-1,3-butadienila, grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-propil-1-naftil]-1,3,5-hexatrienila, grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-propil-2-naftil]-2,4-hexadienila, grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-butil-1-naftil]-3-pentenila, grupo 3-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-butil-2-naftil]-2-propenila, grupo 2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-pentil-1-naftil]etenila, grupo 3-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-pentil-2-naftil]-2-propenila, grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-hexil-1-naftil]-2-butenila, grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-hexil-2-naftil]-3-butenila, grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)isobutil-1-naftil]-1,3-butadienila, grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)isobutil-2-naftil]-1,3,5-hexatrienila, grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)terc-butil-1-naftil]-2,4-hexadienila, grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)terc-butil-2-naftil]-1,3,5-

hexatrienila, grupo 5-[(2-, 3-, ou 4-)cloro fenila, grupo (2-, 3-, ou 4-)fluorfenil]-2,4-hexadienila, grupo 5-[(2-, 3-, ou 4-)bromofenil]-3-pentenila, grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)cloro-1-naftil]-2-propenila, grupo 2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)cloro-2-naftil]etenila, grupo 3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)flúor-1-naftil]-2-propenila, grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)flúor-2-naftil]-2-butenila, grupo 4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)bromo-1-naftil]-3-butenila, grupo 4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)bromo-2-naftil]-1,3-butadienila, grupo 5-[(2-, 3-, ou 4-)aminofenil]-1,3,5-hexatrienila, grupo 5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)amino-1-naftil]-2,4-hexadienila, grupo 5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)amino-2-naftil]-3-pentenila, grupo 3-(2,3-dimetil fenil)-2-propenila, grupo 2-(3,4-dimetil fenil)vinila, grupo 3-(2,4-dimetil fenil)-2-propenila, grupo 4-(2,5-dimetil fenil)-2-butenila, grupo 4-(2,6-dimetil fenil)-3-butenila, grupo 4-(2,4,6-trimetil fenil)-1,3-butadienila, grupo 5-(3,4,5-trimetil fenil)-1,3,5-hexatrienila, grupo 5-(2,3,4,5-tetraetil fenil)-2,4-hexadienila, grupo 5-(pentametil fenil)-3-pentenila, grupo 3-(2-metil naftil)-2-propenila, grupo 2-(2,3-dimetil naftil)etenila, grupo 3-(3,4-dimetil fenil)-2-propenila, grupo 4-(3,5,7-trietil naftil)-2-butenila, grupo 4-(3,4,5,7-tetrametil naftil)-3-butenila, grupo 4-(2,3,4,5,7-pentametil naftil)-1,3-butadienila, grupo 5-(2,3,4,5,6,7-hexaetil naftil)-1,3,5-hexatrienila, grupo 5-(heptametil naftil)-2,4-hexadienila, grupo 5-(2,3-diaminofenil)-3-pentenila, grupo 3-(2,4,6-triaminofenil)-2-propenila e grupo 2-(2-metil-5-cloronaftil)etenila.

Exemplos do grupo piridilamino que pode ter um grupo alquila inferior incluem um grupo piridilamino que pode ter 1 a 3, preferivelmente 1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), no grupo piridila e/ou grupo amino. Exemplos específicos destes incluem um grupo N-(2-, 3-, ou 4-) piridilamino, grupo N-3-metil- 2-piridilamino, grupo N-(4-metil-2-piridil) amino, grupo N-(5-metil-2-piridil) amino, grupo N-(6-metil-2-piridil) amino, grupo N-(2-metil-3-piridil) amino, grupo N-(4-metil-3-piridil)

amino, grupo N-(5-metil-3-piridil) amino, grupo N-(6-metil-3-piridil) amino, grupo N-(2-metil-4-piridil) amino, grupo N-(3-metil-4-piridil) amino, grupo N-(3-etil-2-piridil) amino, grupo N-(4-n-propil-2-piridil) amino, grupo N-(5-n-propil-2-piridil) amino, grupo N-(2-n-butil-3-piridil) amino, grupo N-(4-n-pentil-3-piridil) amino, grupo N-(5-n-hexil-3-piridil) amino, grupo N-(2-isopropil-4-piridil) amino, grupo N-(3-terc-butil-4-piridil) amino, grupo N-(3-metil-2-piridil)-N-metil- amino, e grupo N-(2,4-dietil-3-piridil)-N-metil-amino.

Exemplos do grupo aril alquila inferior (que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em átomo de halogênio, grupo alquila inferior, grupo alquila substituído por halogênio, grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, grupo alcóxi inferior, grupo carbamoíla, e grupo alcoxicarbonila inferior, como um substituinte, no grupo arila e/ou o grupo alquila inferior) incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 3 (preferivelmente 1) arila grupos da forma ilustrada anteriormente. Observe que, no grupo arila e/ou na fração alquila, pode haver 1 a 7, preferivelmente 1 a 5, mais preferivelmente, 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste em

um átomo de halogênio da forma ilustrada anteriormente;

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alquila inferior substituído por halogênio da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono substituído por 1 a 7 átomos de halogênio);

um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono substituído por 1 a 7 átomos de halogênio);

um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo carbamoíla; e

um grupo alcóxi inferior-carbonila da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcoxicarbonila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos do grupo aril alquila inferior (que pode ter um substituinte selecionado do grupo que consiste em um átomo de halogênio, grupo alquila inferior, grupo alquila inferior substituído por halogênio, grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, grupo alcóxi inferior, grupo carbamoíla e grupo alcoxicarbonila inferior, no grupo arila e/ou o grupo alquila inferior) incluem um grupo benzila, grupo 1-fenil etila, grupo 2-fenil etila, grupo 1-metil-1-fenil etila, grupo 1,1-dimetil-2-fenil etila, grupo 1,1-dimetil-3-fenil propila, grupo (2-, 3-, ou 4-)fluorbenzila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)fluorfenil] etila, grupo 1-[(2-, 3-, ou 4-)fluorfenil] etila, grupo 1-[(2-, 3-, ou 4-)fluorfenil]propila, grupo 2-[(2,6-ou 3,5-)difluorfenil] etila, grupo 1-(3,5-difluorfenil) etila, grupo 1-(3,5-difluorfenil)propila, grupo (2-, 3-, ou 4-)clorobenzila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)clorofenil] etila, grupo 2-(3,4-diclorofenil) etila, grupo 1-(3-clorofenil)butila, grupo 1-(4-clorofenil)butila, grupo (2-, 3-, ou 4-)trifluormetil fenil benzila, grupo 1-[(2-, 3-, ou 4-)trifluormetil fenil] etila, grupo 1-[(2-, 3-, ou 4-)trifluormetil fenil]propila, grupo (2-, 3-, ou 4-)metil benzila, grupo 2-[(2-3-, ou 4-)metil fenil] etila, grupo (2-, 3-, ou 4-)trifluormetoxibenzila, grupo 1-[(2-, 3-, ou 4-)trifluormetil fenil] etila, grupo (2-, 3-, ou 4-)metoxibenzila, grupo 2-[(2-, 3-, ou 4-)metil fenil] etila, grupo 1-[(2-, 3-, ou 4-)metoxifenil]propila, grupo (2-, 3-, ou 4-)etoxibenzila, grupo (3,4-ou 3,5-)dimetoxibenzila, grupo (3,4-ou 3,5-)di(n-butóxi)benzila, grupo 2-[(3,5-ou 3,4-)dimetoxifenil] etila, grupo 2-(2-etoxifenil) etila, grupo 1-(4-metoxifenil)butila, grupo 1-fenil-1-metoxicarbonil metila, grupo 1-carbamoil-2-fenil etila, grupo 1-

metoxicarbonil-2-fenil etila, grupo 2-metoxicarbonil-2-fenil etila, grupo 2-fenil-2-hidroxietila, grupo 2-(4-hidroxifenil)-1-metoxicarbonil etila, grupo 3-cloro-4-difluormetoxifenil metila, e grupo naftil metila.

Exemplos do grupo alquinila inferior incluem um grupo alquinila reto ou ramificado tendo 2 a 6 átomos de carbono. Exemplos específicos destes incluem um grupo etinila, grupo 2-propinila, grupo 2-butinila, grupo 3-butinila, grupo 1-metil-2-propinila, grupo 2-pentinila, e grupo 2-hexinila.

Exemplos do grupo arilóxi alquila inferior (no grupo arila, um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior; um grupo carbamoíla que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior; e um grupo pirrolidinila que pode ter um grupo oxo, pode estar presente, incluem um grupo aril alquila inferior (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) cuja fração arila e grupo alquila inferior são da forma ilustrada anteriormente. No grupo arila aqui, 1 a 5 (preferivelmente 1 a 2) grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente; um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente e um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente; e grupo oxo podem estar presentes como um substituinte(s). Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-[(2-, 3-ou 4-)metoxifenóxi] etila, grupo 2-[(2-, 3-ou 4-)carbamoíla fenóxi] etila, grupo 2-[(2-, 3-ou 4-)(N-metil-N-etoxicarbamoil)fenóxi] etila e grupo 2-[(2-, 3-ou 4-)(2-oxo-1-pirolidinil)fenóxi] etila.

Exemplos do grupo isoxazolidinila que pode ter um grupo oxo incluem um grupo isoxazolidinila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos oxo. Exemplos específicos destes incluem um grupo 3-oxoisooxazolidin-4-ou 5-ila e grupo 3,5-dioxoisoxazolidin-4-ila.

Exemplos do grupo diidroindenila incluem um grupo (1-, 2-, 4-ou 5-)-1, 2-diidroindenila.

Exemplos do grupo arilalcóxi inferior alquila inferior incluem um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior cuja fração arila, fração alcóxi inferior e fração do grupo alquila inferior são da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo benziloximetila, grupo 2-benziloxietila e grupo 2-benziloxibutila.

Exemplos do grupo azetidinila que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla incluem um grupo azetidinila que pode ter um 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos selecionados de um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente e um grupo aroíla da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-ou 3-azetinila, grupo 1-acetil-(2-ou 3-) azetidinila, grupo 1-butiril-(2-ou 3-) azetidinila e 1 grupo -benzoil-(2-ou 3-) azetidinila.

Exemplos do grupo azetidinil alquila inferior que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla incluem um grupo azetidinil alquila inferior que pode ter 1 a 3 (preferível 1) grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente e um grupo aroíla da forma ilustrada anteriormente e têm uma fração alquila inferior da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-ou 3-azetidinil metila, grupo 2-(2-ou 3-azetidinil) etila, grupo 1-acetil-(2-ou 3-)azetidinil metila, grupo 1-butiril-(2-ou 3-)azetidinil metila, grupo 1-benzoil-(2-ou 3-)azetidinil metila, grupo 2-[1-acetil-(2-ou 3-)azetidinil] etila, grupo 2-[1-butiril-(2-ou 3-)azetidinil] etila e grupo 2-[1-benzoil-(2-ou 3-)azetidinil] etila.

Exemplos do grupo tetrazolila incluem um grupo (1-ou 5-) tetrazolila.

Exemplos do grupo indolinila que pode ter um grupo oxo incluem um grupo indolinila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos oxo. Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-, 3-, 5-, 6-,7-ou 8-)indolinila, grupo 2-oxo-(1-, 3-, 5-, 6-, 7-ou 8-)indolinila e grupo 2,3-dioxo-(1-, 5-, 6-, 7-ou 8-)indolinila.

Exemplos do grupo triazolila incluem um grupo 1,2,4,-trizolila e um grupo 1,3,5,-trizolila.

Exemplos do grupo triazolila que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquiltio inferior incluem um grupo triazolila da forma ilustrada anteriormente que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1 a 2) grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente e um grupo alquiltio inferior da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-, 3-ou 5-)-1,2, 4-triazolila, grupo (1-, 2-ou 5-)-1,3,5- triazolila, grupo 1-metil-5-metiltio-1,2,4-triazol-3-ila e grupo 1-metil-5-metiltio-1,2,3-triazol-2-ila.

Exemplos do grupo imidazolila que pode ter um grupo carbamoíla incluem um grupo imidazolila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos carbamoíla. Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-, 2-, 4-ou 5-) imidazolila e um grupo 4-carbamoil-(1, 2-ou 5-) imidazolila.

Exemplos do grupo oxazolila que pode ter um grupo alquila inferior incluem um grupo oxazolila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo (2-, 3-ou 4-) oxazolila e um grupo 4-metil-(2-ou 3-) oxazolila.

Exemplos do grupo isotiazolila que pode ter um grupo alquila inferior incluem um grupo isotiazolila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo (3-, 4-ou 5-) isotiazolila e um grupo (3-

ou 4-)metil- 2-isotiazolila.

Exemplos do grupo diidrobenzotiazolila incluem um grupo (1-,2-,4-, 5-, 6-ou 7-)2, 3-diidrobenzotiazolila.

Exemplos do grupo diidrobenzotiazolila que pode ter um grupo oxo incluem um grupo diidrobenzotiazolila que pode ter um único grupo oxo. Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-, 2-, 5-, 6-, 7-ou 8-)2, 3-diidrobenzotiazolila e um grupo 2-oxo-(1-, 5-, 6-, 7-ou 8-)2, 3-diidrobenzotiazolila.

Exemplos do grupo tienila que pode ter um grupo alcoxicarbonila inferior incluem um grupo tienila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo (2-ou 3-) tienila e um grupo 3-metoxicarbonil- 2-tienila.

Exemplos do grupo oxazolil alquila inferior que pode ter um grupo alquila inferior incluem um grupo oxazolil alquila inferior da forma ilustrada anteriormente, cujo grupo alquila da forma ilustrada anteriormente, tendo 1 a 3 (mais preferivelmente 1 a 2) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente no anel oxazol. Exemplos específicos destes incluem um (2-, 4-ou 5-)oxazolil metila, grupo 2-(2-, 4-ou 5-)oxazolil metila, grupo [2-metil-(4-ou 5-)oxazolil] metila e grupo (2,5-dimetil-4-oxazolil) metila.

Exemplos do grupo amino alquila inferior que pode ter um grupo, no grupo amino, que é selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo alquila inferior substituído por halogênio, grupo alcoxicarbonila inferior, grupo alcanoíla inferior, arila, grupo aril alquila inferior, grupo aroíla, e grupo alquila substituído por amino (no grupo amino do grupo alquila substituído por amino, um grupo alquila inferior pode estar presente como um substituinte) incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 5, preferível 1 a 3, mais

preferivelmente 1, grupos amino. Observe que, no grupo amino, 1 a 2 substituintes pode estar presente que são selecionado do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alquila inferior substituído por halogênio da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono com 1 a 13, preferivelmente 1 a 7, mais preferivelmente 1 a 3 átomos de halogênio);

um grupo alcóxi inferior-carbonila da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcoxicarbonila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo arila da forma ilustrada anteriormente;

um grupo aril alquila inferior da forma ilustrada anteriormente;

um grupo aroíla da forma ilustrada anteriormente; e

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 5, preferivelmente 1 a 3, mais preferivelmente 1, grupos amino (1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) pode estar presente no grupo amino, como um substituinte(s)). Exemplos específicos do grupo amino alquila inferior que pode ter, no grupo amino, um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo alquila inferior substituído por halogênio, grupo alcoxicarbonila inferior, grupo alcanoíla inferior, arila, grupo aril alquila

inferior, grupo aroíla, e grupo alquila substituído por amino ((no grupo amino do grupo alquila substituído por amino, um grupo alquila inferior pode estar presente como um substituinte) incluem um grupo N-metilamino metila, grupo N-etilamino metila, grupo N-n-propilamino metila, grupo N,N-dimetilamino metila, grupo N,N-dietilamino metila, grupo N-metil-N-n-propilamino metila, grupo N-metil-N-etilamino metila, grupo N-(2,2,2-trifluoretil)amino metila, grupo N-metil-N-benzilamino metila, grupo N-fenilamino metila, grupo N-metil-N-fenilamino metila, grupo N-formilamino metila, grupo N-metil-N-acetilamino metila, grupo N-metil-N-propionilamino metila, grupo N-(2-(N,N-dietilamino)etil)amino metila, grupo N-metil-N-benzoilamino metila, grupo N-metilamino etila, grupo N-etilamino etila, grupo N-(2,2,2-trifluoretil)amino etila, grupo N,N-dimetilamino etila, grupo N,N-dietilamino etila, grupo N-metil-N-acetilamino etila, grupo N-metil-N-benzoilamino etila, grupo N-metil-N-propionilamino etila, grupo N-metil-N-benzilamino etila, e grupo N-metil-N-terc-butoxicarbonilamino etila.

Exemplos do grupo alquila inferior substituído por um grupo carbamoíla que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio incluem um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) e substituído por 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono); e

um grupo alquila inferior substituído por halogênio da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono e 1 a 13, preferivelmente 1 a 7, mais preferivelmente 1 a 3 átomos de halogênio). Exemplos específicos destes

incluem um grupo carbamoil metila, grupo 2-carbamoil etila, grupo 1-carbamoil etila, grupo 3-carbamoil propila, grupo 4-carbamoil butila, grupo 5-carbamoil pentila, grupo 6-carbamoil exila, grupo 1,1-dimetil-2-carbamoil etila, grupo 2-metil-3-carbamoil propila, grupo 1,2-dicarbamoil etila, grupo 2,2-dicarbamoil etila, grupo 1,2,3-tricarbamoil propila, grupo N-metil carbamoil metila, grupo N-etil carbamoil metila, grupo 2-(N-n-propilcarbamoil) etila, grupo 3-(N-n-butil carbamoil)propila, grupo 4-(N-isobutil carbamoil)butila, grupo 5-(N-terc-butil carbamoil)pentila, grupo 6-(N-pentil carbamoil)hexila, grupo N,N-dimetil carbamoil metila, grupo N,N-dietil carbamoil metila, grupo 2-(N-2-fluoretil carbamoil) etila, grupo 3-(N-2-cloroetil carbamoil)propila, grupo 4-(N-2-bromoetil carbamoil)butila, grupo 2-(N-2,2-dicloroetil carbamoil) etila, grupo N-2,2,2-trifluoretil carbamoil metila, e grupo N-heptafluorpropil carbamoil metila.

Exemplos do grupo tiocarbamoíla que pode ter um grupo alquila inferior incluem um grupo tiocarbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo tiocarbamoíla, grupo N-metil-tiocarbamoíla, grupo N-etil-tiocarbamoíla, grupo N-n-propil-tiocarbamoíla, grupo N-n-butil-tiocarbamoíla, grupo N-n-pentil-tiocarbamoíla, grupo N-n-hexil-tiocarbamoíla, grupo N-isobutil-tiocarbamoíla, grupo N-terc-butil-tiocarbamoíla, grupo N,N-dimetil-tiocarbamoíla, e grupo N-metil-N-etil-tiocarbamoíla.

Exemplos do grupo oxazolidinila que pode ter um grupo oxo incluem um grupo oxazolidinila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos oxo. Exemplos específicos destes incluem um grupo oxazolidin-3-ila, grupo oxazolidin-4-ila, grupo oxazolidin-5-ila, grupo 2-oxo-oxazolidin-4-ila, grupo 2-oxo-oxazolidin-3-ila, e grupo 2-oxo-oxazolidin-5-ila.

Exemplos do grupo imidazolidinila que pode ter um

substituinte selecionado do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior incluem um grupo imidazolidinila que pode ter 1 a 3, preferivelmente 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste em grupo oxo e um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo imidazolidin-1-ila, grupo imidazolidin-2-ila, grupo imidazolidin-4-ila, grupo 2-oxo-imidazolidin-1-ila, grupo 4-oxo-imidazolidin-1-ila, grupo 5-oxo-imidazolidin-1-ila, grupo 4-oxo-imidazolidin-2-ila, grupo 2-oxo-imidazolidin-4-ila, grupo 2-metil-imidazolidin-1-ila, grupo 4-etil-imidazolidin-1-ila, grupo 5-n-propil-imidazolidin-1-ila, grupo 4-n-butil-imidazolidin-2-ila, grupo 2-n-pentil-imidazolidin-4-ila, grupo 2-n-hexil-imidazolidin-1-ila, grupo 4-isobutil-imidazolidin-2-ila, grupo 2-terc-butil-imidazolidin-4-ila, grupo 2-oxo-3-metil-imidazolidin-1-ila, e grupo 2-oxo-3,4-dimetil-imidazolidin-1-ila.

Exemplos do grupo pirrolidinila que pode ter um grupo oxo incluem um grupo pirrolidinila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos oxo. Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-, 2-ou 3-) pirrolidinila, grupo (2-ou 3-)oxo-1- pirrolidinila, grupo (3-, 4-ou 5-)oxo- 2-pirrolidinila, e grupo (2-, 4-ou 5-)oxo-3-pirrolidinila.

Exemplos do grupo imidazolila incluem um grupo (1-,2-, 4-ou -5) imidazolila.

Exemplos do grupo isoxazolila incluem um grupo (3-, 4-ou 5-) isoxazolila.

Exemplos do grupo aril sulfonila incluem um grupo aril sulfonila cuja fração arila é fenila, bifenila, bifenila substituído, fenila substituído, naftila e naftila substituído, e que podem ter, na fração arila, 1 a 7, preferivelmente 1 a 5, mais preferivelmente 1 a 2 grupos alquila retos ou ramificados tendo 1 a 6 átomos de carbono. Exemplos do substituinte, tais como fenila, bifenila e naftila incluem um grupo alquila reto ou ramificado

tendo 1 a 6 átomos de carbono, um átomo de halogênio, um grupo amino e similares. Um a sete, preferivelmente 1 a 5, mais preferivelmente 1 a 2 substituintes de pelo menos um tipo destes podem estar presentes no anel fenila, bifenila, naftila e similares. Exemplos específicos do grupo aril sulfonila que pode ter um grupo alquila inferior no grupo arila incluem um grupo fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)bifenil sulfonila, (1-ou 2-)naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-) metil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-) etil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-) n-propil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-) n-butil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-) n-pentil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-exil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-) isobutil fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-) terc-butil fenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)metil-2-bi fenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)metil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)metil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)etil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)etil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)etil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-propil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-propil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-propil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-butil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-butil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-butil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-pentil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-pentil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-pentil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-hexil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-hexil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)n-hexil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)isobutil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)isobutil-3-bifenil

sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)isobutil-4-bifenil sulfonila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)terc-butil-2-bifenil sulfonila, grupo (2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)terc-butil-3-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, ou 6'-)terc-butil-4-bifenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)metil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)metil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)etil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)etil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-propil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-propil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-butil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-butil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-pentil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-pentil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-hexil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)n-hexil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)isobutil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)isobutil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)terc-butil-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)terc-butil-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)cloro fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)flúor fenil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)bromofenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)cloro-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)cloro-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)flúor-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)flúor-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)bromo-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)bromo-2-naftil sulfonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)aminofenil sulfonila, grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)amino-1-naftil sulfonila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)amino-2-naftil sulfonila, grupo 2,3-di metil fenil sulfonila, grupo 3,4-di metil fenil sulfonila, grupo 2,4-dimetil fenil sulfonila, grupo 2,5-dimetil fenil sulfonila, grupo 2,6-dimetil fenil sulfonila, grupo 2,4,6-trimetil fenil sulfonila, grupo 3,4,5-trimetil fenil sulfonila, grupo 2,3,4,5-tetraetil fenil sulfonila, grupo pentametil fenil

sulfonila, grupo 2-metil naftil sulfonila, grupo 2,3-dimetil naftil sulfonila, grupo 3,4-dimetil fenil sulfonila, grupo 3,5,7-trietil naftil sulfonila, grupo 3,4,5,7-tetrametil naftil sulfonila, grupo 2,3,4,5,7-pentametil naftil sulfonila, grupo 2,3,4,5,6,7-hexaetil naftil sulfonila, grupo heptametil naftil sulfonila, grupo 2,3-diamino fenil sulfonila, grupo 2,4,6-triaminofenil sulfonila, e grupo 2-metil-5-cloronaftil sulfonila.

Exemplos do grupo piperidila que pode ter um substituinte selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior; grupo alcanoíla inferior; grupo aril sulfonila; grupo oxo; grupo hidróxi e grupo amino que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo alcanoíla inferior, grupo alcoxicarbonila inferior e grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior incluem um grupo piperidila que pode ter 1 a 5, preferivelmente 1 a 3, mais preferivelmente 1 substituinte selecionado do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono); e

um grupo aril sulfonila da forma ilustrada anteriormente; um grupo oxo; um grupo hidróxi; e um grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente, grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente, grupo alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente e grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-) piperidila, grupo 1-metil-4-piperidila, grupo 2-etil-4-piperidila, grupo 3-n-propil-4-piperidila, grupo 4-isopropil-4-piperidila, grupo 2-n-butil-1-

piperidila, grupo 3-isobutil-1-piperidila, grupo 4-terc-butil-1-piperidila, grupo 1-sec-butil- 2-piperidila, grupo 2-n-pentil- 2-piperidila, grupo 3-(1-etil propil)-2-piperidila, grupo 4-iso-pentil-2-piperidila, grupo 5-neopentil-2-piperidila, grupo 6-n-hexil-2-piperidila, grupo 1-(1,2,2-trimetil propil)-grupo 3-piperidila, grupo 2-(3,3-dimetil butil)-3-piperidila, grupo 3-(2-etil butil)-3-piperidila, grupo 4-isoexil-3-piperidila, grupo 5-(3-metil pentil)-3-piperidila, grupo 6-formil-3-piperidila, grupo 1-acetil-4-piperidila, grupo 2-propionil-4-piperidila, grupo 3-butiril-4-piperidila, grupo 4-isobutiril-4-piperidila, grupo 2-pentanoil-1-piperidila, grupo 3-terc-butil carbonil-1-piperidila, grupo 4-hexanoil-1-piperidila, grupo 1-fenil sulfonil-2-piperidila, grupo 2-(2-bifenil sulfonil)-2-piperidila, grupo 3-(1-naftil sulfonil)-2-piperidila, grupo 1-tosil-4-piperidila, grupo 4-(4-etil fenil sulfonil)-2-piperidila, grupo 5-(2-n-propil fenil sulfonil)-2-piperidila, grupo 6-(3-n-butil fenil sulfonil)-2-piperidila, grupo 1-(4-n-pentil fenil sulfonil)-3-piperidila, grupo 2-(2-n-exil fenil sulfonil)-3-piperidila, grupo 3-(3-isobutil fenil sulfonil)-3-piperidila, grupo 4-(4-terc-butil fenil sulfonil)-3-piperidila, grupo 5-(2-clorofenil sulfonil)-3-piperidila, grupo 6-(4-fluorfenil sulfonil)-3-piperidila, grupo 1-(3-bromofenil sulfonil)-4-piperidila, grupo 2-(2-aminofenil sulfonil)-4-piperidila, grupo 3-(2,3-dimetil fenil sulfonil)-4-piperidila, grupo 4-(3,4,5-trimetil fenil sulfonil)-4-piperidila, grupo 2-(2,3-diaminofenil sulfonil)-1-piperidila, grupo 4-oxo-1-piperidila, grupo 2-oxo-3-piperidila, grupo 4-hidróxi-1-piperidila, grupo 2-hidróxi-3-piperidila, grupo 4-amino-1-piperidila, grupo 2-amino-4-piperidila, grupo 4-metilamino-1-piperidila, grupo 2-metilamino-4-piperidila, grupo 4-etilamino-1-piperidila, grupo 2-etilamino-4-piperidila, grupo 2-dimetilamino-4-piperidila, grupo 4-dietilamino-1-piperidila, grupo 4-formilamino-1-piperidila, grupo 4-acetilamino-1-piperidila, grupo 4-(N-metil-N-acetilamino)-1-piperidila, grupo 4-(N-metil-N-metoxicarbonilamino)-1-piperidila, grupo 4-(N-metil-N-terc-butoxicarbonilamino)-1-piperidila, grupo 4-[N-metil-N-(N-acetilamino)acetilamino]-1-grupo piperidila.

Exemplos do grupo piperidil carbonila que pode ter um substituinte selecionado do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior, grupo hidróxi, grupo hidróxi alquila inferior, grupo alcanoíla inferior, grupo carbóxi alquila inferior, grupo alquil inferior carbamoil alquila inferior, grupo carbamoíla, grupo alcóxi inferior, grupo carbóxi, grupo alcoxicarbonila inferior, grupo amino (em que 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo alcanoíla inferior, grupo alcoxicarbonila inferior e grupo aroíla pode estar presente), grupo piperidila (em que um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, grupo alcoxicarbonila inferior e grupo aroíla pode estar presente), grupo piperazinila (em que um grupo alquila inferior pode estar presente como um substituinte), 1,4-dioxa-8-azasprio[4.5]decila, grupo morfolinila, grupo hexaidro-1,4-diazepinila (em que um grupo alquila inferior pode estar presente como um substituinte), grupo piridila, grupo piridilóxi, grupo piridil alcóxi inferior, grupo tetraidroquinolila (em que um grupo oxo pode estar presente), grupo benzodioxolila, arila grupo alcóxi inferior (que pode ter no grupo arila um grupo selecionado do grupo que consiste em um átomo de halogênio, grupo alquila inferior, grupo alcóxi inferior e grupo alcóxi inferior substituído por halogênio), arila grupo (em que um grupo selecionado do grupo que consiste em um átomo de halogênio, grupo alcóxi inferior e grupo hidróxi pode estar presente), grupo arilóxi (que pode ter no grupo arila um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo ciano, átomo de halogênio, grupo alquila inferior, grupo alcóxi inferior e grupo alquila inferior substituído por halogênio), grupo aril alquila inferior (que pode ter no grupo arila um grupo selecionado do grupo que consiste em um átomo de halogênio, grupo alquila inferior, grupo alcóxi inferior e grupo alquila inferior substituído por halogênio) e grupo aroíla (que pode ter no grupo arila um grupo selecionado do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alcóxi inferior)

incluem

um grupo piperidil carbonila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) substituintes, no grupo piperidinila, selecionado do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo hidróxi;

um grupo hidróxi alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono e tendo 1 a 3 grupos hidróxi);

um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente;

um grupo carbóxi alquila inferior da forma ilustrada anteriormente tendo uma fração alquila inferior da forma ilustrada anteriormente;

um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono e substituído por um grupo carbamoíla tendo 1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente grupo alquila reto ou ramificados tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo carbamoíla;

um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo carbóxi;

um grupo alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcoxicarbonila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono),

um grupo amino (em que 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente,

um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente, grupo alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente e grupo aroíla da forma ilustrada anteriormente pode estar presente);

um grupo piperidila (em que 1 a 3 grupos (preferivelmente 1) selecionado do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente, grupo alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente e grupo aroíla da forma ilustrada anteriormente pode estar presente);

um grupo piperazinila (em que 1 a 3 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente grupo alquila reto ou ramificados tendo 1 a 6 átomos de carbono) podem estar presentes como um substituinte(s));

um grupo 1,4-dioxa-8-azasprio[4.5]decila;

um grupo morfolinila;

um grupo hexaidro-1,4-diazepinila (em que 1 a 3 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente grupo alquila reto ou ramificados tendo 1 a 6 átomos de carbono) podem estar presentes como um substituinte(s));

um grupo piridila;

um grupo piridilóxi;

um grupo piridil alcóxi inferior tendo uma fração alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente;

um grupo tetraidroquinolila (em que 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos oxo podem estar presentes);

um grupo benzodioxolil(preferivelmente benzo[1.3]dioxolila);

um grupo aril alcóxi inferior tendo uma fração arila e fração alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (que pode ter no grupo arila 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio da forma ilustrada anteriormente, grupo alquila inferior

da forma ilustrada anteriormente, grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente e grupo alcóxi inferior substituído por halogênio da forma ilustrada anteriormente);

um grupo arila da forma ilustrada anteriormente (que pode ter no grupo arila 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio da forma ilustrada anteriormente, grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente e grupo hidróxi);

um grupo arilóxi tendo uma fração arila da forma ilustrada anteriormente (que pode ter no grupo arila 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo ciano, átomo de halogênio, grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente, grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente e grupo alquila inferior substituído por halogênio da forma ilustrada anteriormente);

um grupo aril alquila inferior tendo uma fração arila e fração alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (que pode ter no grupo arila 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, grupo alquila inferior, grupo alcóxi inferior e grupo alquila inferior substituído por halogênio); e

um grupo aroíla da forma ilustrada anteriormente (que pode ter no grupo arila 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio da forma ilustrada anteriormente e um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente). Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-) piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)etil- 4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)metil-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)metil2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)metil3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)metil4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)hidróxi-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)hidróxi-2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)hidróxi-3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)hidróxi-4-piperidil

carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)hidroximetil-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)hidroximetil-2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)hidroximetil3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)hidroximetil4-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)(2-hidroxietil)4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-etil-carbamoíla metil)-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(N-etil-carbamoíla metil)2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(N-etil-carbamoíla metil)3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)N-etil-carbamoíla metil-4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)carbamoil-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)carbamoil-2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)carbamoil-3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)carbamoil4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)carbóxi-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)carboximetil-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)etoxicarbonil-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)metóxi-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)metóxi-2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)metóxi-3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)metóxi-4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)metoxicarbonil-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)metoxicarbonil-2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)metoxicarbonil-3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)metoxicarbonil4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)etoxicarbonil-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)etoxicarbonil-2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)etoxicarbonil-3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)etoxicarbonil-4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)acetilamino-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)acetilamino-2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)acetilamino-3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)acetilamino-4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)terc-butoxicarbonilamino-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)terc-butoxicarbonilamino-2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)terc-butoxicarbonilamino-3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou

4-)terc-butoxicarbonilamino-4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)butirilamino-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)benzoilamino-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-metil-N-acetilamino)-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-metil-N-butirilamino)-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-metil-N-terc-butoxicarbonilamino)-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(N-metil-N-benzoilamino)-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil)2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil]4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[1-acetil-(2-, 3-, ou 4-)piperidil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[1-butiril-(2-, 3-, ou 4-)piperidil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[1-terc-butoxicarbonil-(2-, 3-, ou 4-)piperidil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[1-benzoil-(2-, 3-, ou 4-)piperidil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1-piperazinil)-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[1-(3,4-dimetil piperazinil)]-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[1-(3,4-dimetil piperazinil)]2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[1-(3,4-dimetil piperazinil)]3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)[1-(3,4-dimetil piperazinil)]4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[1-(4-metil piperazinil)]-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 3-, ou 4-)[1-(4-metil piperazinil)]2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, ou 4-)[1-(4-metil piperazinil)]3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, ou 3-)[1-(4-metil piperazinil)]4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)morfolinil]-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)morfolinil]2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 4-, 5-, ou 6-)[(2-, 3-, ou 4-)morfolinil]3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, ou 3-)[(2-, 3-, ou 4-)morfolinil]4-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, ou 7-)(4-metil-hexaidro-1,4-diazepinil)-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(4-metil-hexaidro-1,4-diazepinil)2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-,

5-, ou 6-)(4-metil-hexaidro-1,4-diazepinil)3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)(4-metil-hexaidro-1,4-diazepinil)4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]dec-8-il)-1-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]dec-8-il)2-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]dec-8-il)3-piperidil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, ou 4-)(1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]dec-8-il)4-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 4-, ou 5-)benzo[1.3]dioxolil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[2-oxo-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)-1,2,3,4-tetraidroquinolil]-1-piperidil carbonila, grupo 4-[2-oxo-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)-1,2,3,4-tetraidroquinolil]-(2-ou 3-metil)-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)piridil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)piridilóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)piridil metóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)fluorbenzilóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)clorobenzilóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)bromobenzilóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)metil benzilóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)trifluormetoxibenzilóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3,4-diclorobenzilóxi)-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3,4-dimetoxibenzilóxi)-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-cloro-4-metoxibenzilóxi)-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)fluorfenóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)clorofenóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)cianofenóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)metoxifenóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)metil fenóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)trifluormetoxifenóxi]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)fenil-1-piperidil carbonila, grupo 4-hidróxi-(2-, 3-, ou 4-)fenil-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)clorofenil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-,

3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)metoxifenil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)hidroxifenóxi]-1-piperidil carbonila, grupo 4-hidróxi-(2-, 3-, ou 4-)fenil-1-piperidil carbonila, grupo 4-etoxicarbonil-(2-, 3-, ou 4-)fenil-1-piperidil carbonila, grupo 4-hidróxi-(2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)clorofenil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)benzil-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)clorobenzil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)metil benzil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)metoxibenzil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)trifluormetoxibenzil]-1-piperidil carbonila, grupo 4-hidróxi-(2-, 3-, ou 4-)benzil-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)clorobenzoil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)metoxibenzoil]-1-piperidil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)fluorbenzoil]-1-piperidil carbonila, e grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)trifluormetoxibenzil]-1- piperidil carbonila.

Exemplos do grupo pirrolidinil carbonila que pode ter um substituinte selecionado do grupo que consiste em um grupo hidróxi alquila inferior, grupo carbamoíla, grupo hidróxi, grupo amino (que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo alcanoíla inferior, e grupo aroíla nele) grupo morfolinil alquila inferior, grupo pirrolidinil alquila inferior, grupo piperidil alquila inferior, grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter um grupo alquila inferior nele como um substituinte), grupo amino alquila inferior (que pode ter um grupo alquila inferior nele como um substituinte) e grupo arilóxi (que pode ter no grupo arila um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio), grupo arilóxi alquila inferior (no grupo arila, um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio pode estar presente) e um grupo tetraidroquinolila (em que um grupo oxo pode estar presente) incluem um grupo pirrolidinil carbonila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) substituintes, no grupo pirrolidinila, que são selecionado do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente tendo 1 a 3 grupos hidróxi (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo carbamoíla;

um grupo hidróxi;

um grupo amino (que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente, um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente, e um grupo aroíla da forma ilustrada anteriormente);

um grupo morfolinil alquila inferior cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono;

um grupo pirrolidinil alquila inferior cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono;

um grupo piperidil alquila inferior cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono;

um grupo piperazinil alquila inferior cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono (1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) pode estar presente no grupo piperazinila, como um substituinte(s));

um grupo amino alquila inferior cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono (1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) pode estar presente no grupo

amino, como um substituinte(s)), grupo arilóxi tendo uma fração arila da forma ilustrada anteriormente (que pode ter no grupo arila, 1 a 3 (preferivelmente 1) grupo alcóxi inferior substituído por halogênios), grupo arilóxi alquila inferior tendo uma fração arila e fração alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (que pode ter no grupo arila, 1 a 3 (preferivelmente 1) grupo alcóxi inferior substituído por halogênios) e um grupo tetraidroquinolila (em que um único grupo oxo pode estar presente). Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil carbonila, grupo (2-ou 3-)hidroximetil-1-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)hidroximetil-2-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)hidroximetil-3-pirrolidinil carbonila, grupo (2-ou 3-)carbamoil-1-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)carbamoil-2-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)carbamoil-3-pirrolidinil carbonila, grupo (2-ou 3-)hidróxi-1-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)hidróxi-2-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)hidróxi-3-pirrolidinil carbonila, grupo (2-ou 3-)amino-1-pirrolidinil carbonila, grupo (2-ou 3-)acetamido-1-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)acetamido-2-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)acetamido-3-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)butirilamino-3-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)(N-metil-N-acetilamino)-3-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)(N-metil-N-butirilamino)-3-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)benzoilamino-3-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)(N-metil-N-benzoilamino)-3-pirrolidinil carbonila, grupo (2-ou 3-)[(2-, 3-, ou 4-)morfolinil metil]-1-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)[(2-, 3-, ou 4-)morfolinil metil]-2-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)[(2-, 3-, ou 4-)morfolinil metil]-3-pirrolidinil carbonila, grupo (2-ou 3-)[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil metil]-1-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil metil]]-2-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)[(1-, 2-, ou 3-)pirrolidinil metil]]-3-pirrolidinil carbonila,

grupo (2-ou 3-)[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil metil]]-1-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil metil]]-2-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)[(1-, 2-, 3-, ou 4-)piperidil metil)]-3-pirrolidinil carbonila, grupo (2-ou 3-)(4-metil-1-piperazinil metil)-1-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)(4-metil-1-piperazinil metil)-2-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)(4-metil-1-piperazinil metil)-3-pirrolidinil carbonila, grupo (2-ou 3-)N,N-dimetilaminometil-1-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)N,N-dimetilaminometil-2-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)N,N-dimetilaminometil-3-pirrolidinil carbonila, grupo (2-ou 3-)N,N-dietilaminometil-1-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)N,N-dietilaminometil-2-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)N,N-dietilaminometil-3-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)(4-trifluormetoxifenoximetil)-3-pirrolidinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, ou 5-)(4-trifluormetoxifenóxi)-3-pirrolidinil carbonila, e grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)(2-óxi-1,2,3,4-tetraidroquinolil)- 3-pirrolidinil carbonila.

Exemplos de um grupo piperazinil carbonila que pode ter um substituinte selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, grupo alcanoíla inferior, grupo hidróxi alquila inferior, grupo alcóxi inferior alquila inferior, grupo alcoxicarbonila inferior, grupo amino alquila inferior (um grupo alquila inferior pode estar presente no grupo amino, como um substituinte), grupo piperidil alquila inferior (um grupo alquila inferior pode estar presente no grupo piperidinila, como um substituinte), grupo morfolinil alquila inferior, grupo pirrolidinil alquila inferior, grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior, grupo tetraidrofuril alquila inferior, grupo piridil alquila inferior (um grupo fenila pode estar presente no grupo alquila inferior como um substituinte), grupo imidazolil alquila inferior, grupo furil alquila inferior, grupo pirrolidinil carbonil alquila inferior, grupo piperidila que pode ter um grupo alquila inferior como um substituinte, grupo

piridil(um substituinte selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo ciano, e grupo alquila inferior substituído por halogênio pode estar presente no grupo piridila, como um substituinte), tieno[2,3-c]grupo piridila arila grupo (em que um grupo selecionado do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alquila inferior pode estar presente), grupo aroíla, grupo furil alquila inferior, arila grupo alcoxicarbonila inferior e grupo oxo, incluem um grupo piperazinil carbonila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) substituintes, no grupo piperazinila, que são selecionado do grupo que consiste em

um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ da forma ilustrada anteriormente;

um grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcanoíla reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo hidróxi alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono com 1 a 3 grupos hidróxi);

um grupo alcóxi inferior alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono e 1 a 3 grupos alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono));

um grupo alcoxicarbonila inferior da forma ilustrada anteriormente(preferivelmente um grupo alcoxicarbonila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo amino alquila inferior cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto

ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono (1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) pode estar presente no grupo amino, as substituinte(s));

um grupo piperidil alquila inferior cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono (1 a 3 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) pode estar presente no grupo piperidinila como um substituinte(s));

um grupo morfolinil alquila inferior cuja fração alquila é um da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono;

um grupo pirrolidinil alquila inferior cuja fração alquila é um da forma ilustrada anteriormente preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono;

um grupo 1,3 dioxolanil alquila inferior cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono;

um grupo tetraidrofuril alquila inferior cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono;

um grupo piridil alquila inferior cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono (1 a 3 grupos fenila podem estar presentes na alquila, grupo como um substituinte(s));

um grupo imidazolil alquila inferior, cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono;

um grupo furil alquila inferior, cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono;

um grupo pirrolidinil carbonil alquila inferior, cuja fração alquila inferior é uma da forma ilustrada anteriormente, preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono;

um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono);

um grupo piridila (1 a 3 grupos (preferivelmente 1) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono), grupo ciano, e grupo alquila inferior substituído por halogênio da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono substituído por 1 a 7 átomos de halogênio) pode estar presente no grupo piridil); um grupo tieno[2,3-c] piridila; grupo arila da forma ilustrada anteriormente (que pode ter no grupo arila 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alquila inferior), grupo aroíla da forma ilustrada anteriormente, grupo furil alquila inferior tendo uma fração alquila inferior da forma ilustrada anteriormente, arila grupo alcóxi inferior carbonila tendo uma fração arila e fração alcóxi inferior carbonila da forma ilustrada anteriormente e grupo oxo. Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-ou 2-)piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)metil-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)metil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)etil-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)etil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-propil-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)n-propil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-butil-1-piperazinil

carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)n-butil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(1-etil-n-propil)]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[(1-etil-n-propil)]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)isopropil-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)isopropil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)terc-butil-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)terc-butil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)n-hexil-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)n-hexil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)ciclopentil-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)ciclopentil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)cicloeptil-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)cicloeptil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)acetil-1-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)butiril-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)acetil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(2-hidroxietil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(2-hidroxietil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(2-metoxietil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(2-metoxietil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-metoxipropil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(3-metoxipropil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(4-metoxibutil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(4-metoxibutil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)etoxicarbonil-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)etoxicarbonil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)terc-butoxicarbonil-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)terc-butoxicarbonil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)metoxicarbonil-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)metoxicarbonil-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[3-(N,N-dimetilamino)propil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[3-(N,N-dimetilamino)propil]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[2-(N,N-dimetilamino)etil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(2-(N,N-dimetilamino)etil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-,

ou 4-)(2-(1-piperidil)etil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(2-(1-piperidil)etil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(1-metil-3-piperidil)metil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[(1-metil-3-piperidil)metil]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(1-metil-4-piperidil)metil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[(1-metil-4-piperidil)metil]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[2-(4-morfolinil)etil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[2-(4-morfolinil)etil]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[2-(1-pirrolidinil)etil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[2-(1-pirrolidinil)etil]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[2-(1,3-dioxolanil)metil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[2-(1,3-dioxolanil)metil]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-){2-[2-(1,3-dioxolanil)]etil}-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-){2-[2-(1,3-dioxolanil)]etil}-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(2-tetraidrofuril metil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(2-tetraidrofuril metil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(2-piridil metil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(2-piridil metil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-piridil metil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(3-piridil metil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(4-piridil metil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(4-piridil metil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[2-(4-piridil)etil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[2-(4-piridil)etil]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[2-(2-piridil)etil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[2-(2-piridil)etil]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[2-fenil-2-(4-piridil)etil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[2-fenil-2-(4-piridil)etil]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[2-(1-imidazolil)etil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[2-(1-imidazolil)etil]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-furil metil)-1-

piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(3-furil metil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1-pirrolidinil carbonil metil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(1-pirrolidinil carbonil metil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(1-metil-4-piperidil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(1-metil-4-piperidil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)piridil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(2-, 3-, ou 4-piridil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-ciano-2-piridil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(3-ciano-2-piridil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-){4-metil-2-piridil}-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(4-metil-2-piridil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-metil-2-piridil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(3-metil-2-piridil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)(3-trifluormetil-2-piridil)-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)(3-trifluormetil-2-piridil)-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)tieno[2,3-c]piridil]-1-piperazinil carbonila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)[(2-, 3-, 4-, 5-, ou 6-)tieno[2,3-c]piridil]-2-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)fenil-1-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)clorofenil]-1-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-, 3-, ou 4-)metil fenil]-1-piperazinil carbonila, grupo 3-oxo-(2-ou 4-)fenil-1-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)benzolil-1-piperazinil carbonila, grupo (2-, 3-, ou 4-)[(2-ou 3-)furil carbonil]-1-piperazinil carbonila, e grupo (2-, 3-, ou 4-)benziloxicarbonil-1- piperazinil carbonila.

Exemplo de um grupo hexaidroazepinil carbonila incluem um grupo (1-, 2-, 3-ou 4-) hexaidroazepinil carbonila.

Exemplo de um grupo hexaidro-1,4-diazepinil carbonila que pode ter um substituinte selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo piridila incluem um grupo hexaidro-1,4-diazepinil carbonila que pode ter 1 a 3, preferivelmente 1, substituintes selecionados do

grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) e um grupo piridila. Exemplos específicos destes incluem um grupo (hexaidro-1,4-diazepin-(1-,2-, 5-ou 6-)il)carbonila, grupo (4-metil-hexaidro-1,4-diazepin-1-il)carbonila e grupo (4-(4-piridil)-metil-hexaidro-1,4-diazepin-1-il)carbonila.

Exemplo de um grupo diidropirrolil carbonila incluem um grupo 2, 3-diidropirrolil carbonila e um grupo 2, 5- diidropirrolil carbonila.

Exemplos do grupo diidropirrolil carbonila que pode ter um grupo alquila inferior incluem um grupo diidropirrolil carbonila da forma ilustrada anteriormente que pode ter 1 a 4, preferivelmente 1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-, 2-ou 3-)(2,5-diidropirrolil carbonila), grupo 2,5-dimetil-1-(2,5-diidropirrolil carbonila), e grupo 2,5-dimetil-1-(2,3-diidropirrolil carbonil).

Exemplos do grupo tiomorfolinil carbonila incluem um grupo (2-, 3-ou 4-) tiomorfolinil carbonila.

Exemplos do grupo morfolinil carbonila que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, e grupo piperidil alquila inferior, e arila grupo incluem um grupo morfolinil carbonila que pode ter 1 a 5 grupos, mais preferivelmente 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) (em que 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos piperidila podem estar presentes como substituinte(s)) um grupo arila da forma descrita anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo (2-, 3-ou 4-)morfolinil carbonila, grupo 2,6-dimetil- 4-morfolinil carbonila, grupo 2-(1-piperidil metil)- 4-morfolinil carbonila, e grupo 2-fenil- 4-

morfolinil carbonila.

Exemplos do grupo tiazolidinil carbonila incluem um grupo (2-, 3-, 4-ou 5-) tiazolidinil carbonila.

Exemplos do grupo tiazolidinil carbonila que pode ter um grupo arila que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo ciano incluem um grupo tiazolidinil carbonila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos arila que podem ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo ciano da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo (2-, 3-, 4-ou 5-)tiazolidinil carbonila, grupo (2-, 4-ou 5-)[(2-, 3-ou 4-)metoxifenil]- 3-tiazolidinil carbonila e grupo (2-, 4-ou 5-)[(2-, 3-ou 4-)cianofenil]- 3-tiazolidinil carbonila.

Exemplos do grupo azabiciclo[3.2.2]nonil carbonila incluem um grupo 1-azabiciclo[3.2.2]non-(2-, 3-, 5-, ou 6-)il carbonila, grupo 2-azabiciclo[3.2.2]non-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-ou 7-)il carbonila, grupo 3-azabiciclo[3.2.2]non-(1-, 2-, 3-, ou 6-)il carbonila e grupo 6-azabiciclo[3.2.2]non-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-ou 9-)il carbonila.

Exemplos do grupo azabiciclo[3.2.1]octil carbonila que pode ter um grupo arilóxi substituído ou não substituído por halogênio incluem um grupo azabiciclo[3.2.1]octil carbonila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos arila substituídos por halogênio da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo arila que pode ser substituído por 1 a 3, preferivelmente 1 átomo de halogênio), ou um grupo azabiciclo[3.2.1]octil carbonila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos arila não substituídos da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo 1-azabiciclo[3.2.1]oct-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)il carbonila, grupo 2-azabiciclo[3.2.1]oct-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)il carbonila, grupo 3-azabiciclo[3.2.1]oct-(1-, 2-, 3-, 6-, ou 8-)il carbonila, grupo 6-

azabiciclo[3.2.1]oct-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, ou 8-)il carbonila, grupo 8-azabiciclo[3.2.1]oct-(1-, 2-, 3-, 6-, ou 8-)il carbonila, grupo 3-(fenilóxi)-1-azabiciclo[3.2.1]oct-2-il carbonila, grupo 3-(2-bifenilóxi)-1-azabiciclo[3.2.1]oct-3-il carbonila, grupo 3-(1-naftilóxi)-1-azabiciclo[3.2.1]oct-4-il carbonila, grupo 3-(3-metil fenilóxi)-1-azabiciclo[3.2.1]oct-5-il carbonila, grupo 3-(4-etil fenilóxi)-1-azabiciclo[3.2.1]oct-6-il carbonila, grupo 3-(2-n-propil fenilóxi)-1-azabiciclo[3.2.1]oct-7-il carbonila, grupo 3-(3-n-butil fenilóxi)-1-azabiciclo[3.2.1]oct-8-il carbonila, grupo 3-(4-n-pentil fenilóxi)-2-azabiciclo[3.2.1]oct-1-il carbonila, grupo 3-(2-n-exil fenilóxi)-2-azabiciclo[3.2.1]oct-2-il carbonila, grupo 3-(3-isobutil fenilóxi)-2-azabiciclo[3.2.1]oct-3-il carbonila, grupo 3-(4-terc-butil fenilóxi)-2-azabiciclo[3.2.1]oct-4-il carbonila, grupo 3-(2-clorofenilóxi)-2-azabiciclo[3.2.1]oct-5-il carbonila, grupo 3-(3-fluorfenilóxi)-8-aza-biciclo[3.2.1]oct-8-il carbonila, grupo 3-(3-bromofenilóxi)-2-azabiciclo[3.2.1]oct-6-il carbonila, grupo 3-(2-aminofenilóxi)-2-azabiciclo[3.2.1]oct-7-il carbonila, grupo 3-(2,3-dimetil fenilóxi)-2-azabiciclo[3.2.1]oct-8-il carbonila, grupo 3-(3,4,5-trimetil fenilóxi)-8-azabiciclo[3.2.1]oct-1-il carbonila e grupo 3-(2,3-diaminofenilóxi)-8-azabiciclo[3.2.1]oct-2-il carbonila.

Exemplos do grupo indolinil carbonila incluem um grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, ou 7-) indolinil carbonila.

Exemplos do grupo tetraidropirido[3.4-b]indolil carbonila incluem um grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-ou 9-)(2-, 3-, 4-, 9-tetraidropirido[3.4-b]indolil carbonila).

Exemplos do grupo piperazinil alquila inferior que pode ter um grupo alquila inferior no grupo piperazinila incluem um grupo piperazinil alquila inferior cuja fração alquila inferior é um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou

ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) e 1 a 7, preferivelmente 1 a 5, mais preferivelmente 1, grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) pode estar presente no grupo piperazinila. Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-ou 2-)piperazinil metila, grupo 2-[(1-ou 2-)piperazinil]etila, grupo 1-[(1-ou 2-)piperazinil]etila, grupo 3-[(1-ou 2-)piperazinil]propila, grupo 4-[(1-ou 2-)piperazinil]butila, grupo 5-[(1-ou 2-)piperazinil]pentila, grupo 6-[(1-ou 2-)piperazinil]hexila, grupo 1,1-dimetil-2-[(1-ou 2-)piperazinil]etila, grupo 2-metil-3-[(1-ou 2-)piperazinil]propila, grupo 4-metil-1-piperazinil metila, grupo 2-(4-metil-2-piperazinil)etila, grupo 3-(2-etil-1-piperazinil)propila, grupo 4-(3-n-propil-1-piperazinil)butila, grupo 5-(4-n-butil-1-piperazinil)pentila, grupo 6-(1-n-pentil-2-piperazinil)hexila, grupo 2-n-hexil-2-piperazinil metila, grupo 2-(3-isobutil-2-piperazinil)etila, e grupo 3-(4-terc-butil-2-piperazinil)propila.

Exemplos do grupo morfolinil carbonil alquila inferior incluem um grupo morfolinil carbonil alquila inferior cuja fração alquila inferior é um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono). Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-morfolinil carbonil metila, grupo 3-morfolinil carbonil metila, grupo 4-morfolinil carbonil metila, grupo 2-(2-morfolinil carbonil)etila, grupo 2-(3-morfolinil carbonil)etila, grupo 2-(4-morfolinil carbonil)etila, grupo 1-(2-morfolinil carbonil)etila, grupo 1-(3-morfolinil carbonil)etila, grupo 1-(4-morfolinil carbonil)etila, grupo 3-(2-morfolinil carbonil)propila, grupo 3-(3-morfolinil carbonil)propila, grupo 3-(4-morfolinil carbonil)propila, grupo 4-(2-morfolinil carbonil)butila, grupo 4-(3-morfolinil carbonil)butila, grupo 4-(4-morfolinil carbonil)butila, grupo 5-(2-morfolinil carbonil)pentila, grupo 5-(3-morfolinil carbonil)pentila, grupo 5-(4-morfolinil carbonil)pentila, grupo 6-(2-morfolinil carbonil)hexila, grupo 6-(3-morfolinil carbonil)hexila, grupo 6-

(4-morfolinil carbonil)hexila, grupo 3-metil-3-(2-morfolinil carbonil)propila, grupo 3-metil-3-(3-morfolinil carbonil)propila, grupo 3-metil-3-(4-morfolinil carbonil)propila, grupo 1,1-dimetil-2-(2-morfolinil carbonil)etila, grupo 1,1-dimetil-2-(3-morfolinil carbonil)etila, e grupo 1,1-dimetil-2-(4-morfolinil carbonil) etila.

Exemplos do grupo piperazinil carbonil alquila inferior que pode ter um grupo alquila inferior no grupo piperazinila incluem um grupo piperazinil carbonil alquila inferior cuja fração alquila inferior é um grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) e que pode ter 1 a 7, preferivelmente 1 a 5, mais preferivelmente 1, grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) no grupo piperazinila. Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-ou 2-)piperazinil carbonil metila, grupo 2-[(1-ou 2-)piperazinil carbonil]etila, grupo 1-[(1-ou 2-)piperazinil carbonil]etila, grupo 3-[(1-ou 2-)piperazinil carbonil]propila, grupo 4-[(1-ou 2-)piperazinil carbonil]butila, grupo 5-[(1-ou 2-)piperazinil carbonil]pentila, grupo 6-[(1-ou 2-)piperazinil carbonil]hexila, grupo 1,1-dimetil-2-[1-ou 2-)piperazinil carbonil]etila, grupo 2-metil-3-[(1-ou 2-)piperazinil carbonil]propila, grupo 4-metil-1-piperazinil carbonil metila, grupo 2-(4-metil-2-piperazinil carbonil)etila, grupo 3-(2-etil-1-piperazinil carbonil)propila, grupo 4-(3-n-propil-1-piperazinil carbonil)butila, grupo 5-(4-n-butil-1-piperazinil carbonil)pentila, grupo 6-(1-n-pentil-2-piperazinil carbonil)hexila, grupo 2-n-hexil-2-piperazinil carbonil metila, grupo 2-(3-isobutil-2-piperazinil carbonil)etila, e grupo 3-(4-terc-butil-2-piperazinil carbonil)propila.

Exemplos do grupo amino alcóxi inferior (no grupo amino, um grupo alquila inferior pode estar presente) incluem um grupo alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente (preferivelmente um grupo alcóxi reto ou

ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono) tendo 1 a 5 (preferivelmente 1) grupos amino que podem ter 1 a 2 grupos alquila inferior da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo aminometóxi, grupo 2-amino etóxi, grupo 1-aminoetóxi, grupo 3-aminopropóxi, grupo 4-aminobutóxi, grupo 5-aminopentóxi, grupo 6-aminoetilóxi, grupo 1,1-dimetil-2-aminoetóxi, grupo N,N-dimetilaminometóxi, grupo N-metil-N-etilaminometóxi, grupo N-metilaminometóxi, grupo 2-(N-metilamino)etóxi, grupo 2-(N,N-dimetilamino)etóxi, grupo 2-(N,N-dietilamino)etóxi, grupo 2-(N,N-diisopropilamino)etóxi e grupo 3-(N,N-dimetilamino)propóxi.

Exemplos do grupo alcóxi inferior alcóxi inferior incluem um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior tendo uma fração alcóxi inferior da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo metóxi metóxi, grupo 2-metoxietóxi, grupo 1-etoxietóxi, grupo 2-etoxietóxi, grupo 2-isobutoxietóxi, grupo 2,2-dimetoxietoxi e grupo 2-metóxi-1-metil etóxi.

Exemplos do grupo piperazinila que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo oxo, grupo alquila inferior, grupo alcanoíla inferior e grupo alcóxi inferior carbonila incluem um grupo piperazinila que pode ter um grupo 1 a 3 (1 a 2) grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, grupo alquila inferior da forma ilustrada anteriormente, grupo alcanoíla inferior da forma ilustrada anteriormente e grupo alcóxi inferior carbonila da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo (1-ou 2-)piperazinila, grupo (2-, 3-ou 4-)metil-1-piperazinila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-ou 6-)metil-2-piperazinila, grupo (2-, 3-ou 4-)etil-1-piperazinila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-ou 6-)etil-2-piperazinila, grupo (2-, 3-ou 4-)n-propil-1-piperazinila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-ou 6-)n-propil-2-piperazinila, grupo (2-, 3-ou 4-)formil-1-piperazinila, grupo (2-, 3-ou 4-)acetil-1-piperazinila, grupo (2-, 3-ou 4-)propionil-1-piperazinila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-ou 6-)propionil-2-piperazinila, grupo (2-,

3-ou 4-)butiril-1-piperazinila, grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-ou 6-)butiril-2-piperazinila, grupo (2-, 3-ou 4-)metoxicarbonil-1-piperazinila, grupo (2-, 3-ou 4-)etoxicarbonil-1-piperazinila, grupo (2-, 3-ou 4-)terc-butoxicarbonil-1-piperazinila, grupo (2-ou 3-)oxo -1-piperazinila, grupo 2-oxo-(3-, 4-,5-ou 6-)acetil-1-piperazinila, grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5-ou 6-)butiril-1-piperazinila, grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5-ou 6-)metoxicarbonil-1- piperazinila e grupo 2-oxo-(3-, 4-, 5-ou 6-)metoxicarbonil-1- piperazinila.

Exemplos do grupo 1,3,8-triazaspiro[4.5]decanil carbonila que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo arila incluem um grupo 1,3,8-triazaspiro[4.5]decanil carbonila que pode ter 1 a 3 (1 a 2) grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo arila da forma ilustrada anteriormente. Exemplos específicos destes incluem um grupo 1,3,8-triazaspiro[4.5]decanil-(1, 2, 3, 4 ou 8-)il carbonila, grupo 1-fenil-1,3,8-triazaspiro[4.5]decanil-8-il carbonila e grupo 1-fenil-4-oxo-1,3,8-triazaspiro[4.5]decanil-8-il carbonila.

Exemplos do grupo tetraidropiridila incluem um grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-ou 6-)-1,2,3,4-tetraidropiridila e grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-ou 6-)-1,2,3,6-tetraidropiridila.

Exemplos do grupo tetraidropiridil carbonila que pode ter um grupo piridila incluem um grupo tetraidropiridil carbonila da forma ilustrada anteriormente que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos piridila. Exemplos específicos destes incluem um grupo (2-, 3-ou -4)piridil-1,2,3,6-tetraidropiridil-1-il carbonila.

Exemplos do grupo imidazolidinil carbonila que pode ter um grupo tioxo incluem um grupo imidazolidinil carbonila que pode ter 1 a 2 (preferivelmente 1) grupos tioxo. Exemplos específicos destes incluem um grupo 2-tioxo-1- imidazolidinil carbonila.

Exemplos do grupo tetraidronaftila incluem um grupo (1-ou 2-)-1,2,3, 4-tetraidronaftila.

Exemplos do grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, átomo de oxigênio e átomo de enxofre incluem um grupo heteromonocíclico representado por (1) a (9) a seguir.

(1) grupo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 membros (preferivelmente 5 a 6) tendo 1 a 4 (preferivelmente 1 a 2) átomos de nitrogênio (por exemplo, grupo pirrolidinila, grupo imidazolidinila, grupo piperidila, grupo hexaidropirimidinila, piperazinila, grupo azepanila e grupo azocanila);

(2) um grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 membros (preferivelmente 5 a 6) tendo 1 a 4 (preferivelmente 1 a 3) átomos de nitrogênio, por exemplo, um pirrolila, grupo diidropirrolila grupo, tais como grupo 1H-2,5-diidropirrolila, grupo imidazolila (tal como grupo 1H-imidazolila), grupo diidroimidazolila (tal como grupo 1H-2,3-diidroimidazolila), grupo triazolila (tais como grupo 4H-1,2,4-trizaolila, grupo 1H-1,2,3-trizaolila e grupo 2H-1,2,3-trizaolila), grupo diidrotriazolila (tal como grupo 1H-4,5-diidro-1,2, 4-triazolila), grupo pirazolila, grupo piridila, grupo diidropiridila (tal como grupo 1,2-diidropiridila), grupo pirimidinila, grupo diidropirimidinila (tal como grupo 1,6-diidropirimidinila), grupo pirazinila, grupo diidropirazinila (tal como 1,2-diidropirazinila), grupo piridazinila e grupo tetrazolila (tais como grupo 1H- tetrazolila e grupo 2H-tetrazolila);

(3) um grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 membros (preferivelmente 5 a 6) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) átomos de oxigênio e 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) átomos de nitrogênio, por exemplo, um grupo oxazolila, grupo isoxazolila, grupo oxadiazolila (tais como grupo 1,2,4-oxadiazolila, grupo 1,3,4-oxadiazolila e grupo 1,2,5-oxadiazolila) e grupo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 membros (preferivelmente 5 a 6) tendo 1 a 2 (preferivelmente 1) átomos de oxigênio e 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2)

átomos de nitrogênio, por exemplo um grupo oxazolidinila, grupo isoxazolidinila e grupo morfolinila;

(4) um grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 membros (preferivelmente 5) tendo 1 a 2 átomos de enxofre e 1 a 3 átomos de nitrogênio, por exemplo, um grupo tiazolila, grupo diidrotiazolila (tal como grupo 2,3-diidrotiazolila), grupo isotiazolila, grupo tiadiazolila (tais como, grupo 1,2, 3-tiadiazolila, grupo 1,2, 4-tiadiazolila, grupo 1,3, 4-tiadiazolila, e grupo 1,2,5- tiadiazolila) e grupo diidrotiazinila.

(5) grupo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 membros (preferivelmente 5 a 6) tendo 1 a 2 átomos de enxofre e 1 a 3 átomos de nitrogênio, por exemplo, um grupo tiazolidinila;

(6) grupo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 membros (preferivelmente 5 a 6) tendo 1 a 2 átomo de oxigênio, por exemplo, um grupo tetraidrofurila e um grupo tetraidropiranila;

(7) um grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 membros (preferivelmente 5 a 6) tendo 1 a 2 átomos de oxigênio, por exemplo, um grupo piranila (tal como grupo 2H- piranila);

(8) grupo heteromonocíclico saturado de 3 a 8 membros (preferivelmente 5 a 6) tendo 1 a 2 átomos de enxofre, por exemplo, um grupo tetraidrotiofurila e um grupo tetraidrotiopiranila; e

(9) um grupo heteromonocíclico insaturado de 3 a 8 membros (preferivelmente 5 a 6) tendo 1 a 2 átomos de enxofre, por exemplo, um grupo tienila e um grupo tiopiranila (tal como 2H-tiopiranila).

Destes, pode-se mencionar preferivelmente um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo um 1 a 2 heteroátomos selecionados de um átomo de nitrogênio, átomo de oxigênio e átomo de enxofre e selecionado do grupo que consiste em um grupo pirrolidinila, grupo piperidila, grupo pirazolila, grupo piridila, grupo pirimidinila, grupo pirazinila, grupo isoxazolila, grupo tiazolila, grupo piranila e grupo tienila; e

adicionalmente preferivelmente um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo um 1 a 2 átomos de nitrogênio e selecionado do grupo um grupo pirrolidinila, grupo piperidila, grupo pirazolila, grupo piridila, grupo pirimidinila e grupo tiazolila.

Exemplos do grupo tetraidroquinoxalinila incluem um grupo (1-, 2-, 5-ou 6-)-1,2,3,4-tetraidroquinoxalinila e grupo (1-, 2-, 5-ou 6-)-5,6,7,8-tetraidroquinoxalinila.

Exemplos do grupo tetraidroquinazolinila incluem um grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-ou 8-)-1,2,3,4-tetraidroquinazolinila e grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-ou 8-)-5,6,7,8-tetraidroquinazolinila.

Exemplos do grupo diidroquinazolinila incluem um grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-ou 8-)-3,4-diidroquinazolinila e grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-ou 8-)-1,2-diidroquinazolinila.

Exemplos do grupo diidrobenzimidazolila incluem um grupo (1-, 2-, 4-ou 5-)-2,3-diidro-1H-benzimidazolila.

Exemplos do grupo tetraidrobenzazepinila incluem um grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-ou 9-)-2,3,4,5-tetraidro-1H-benzo[b]azepinila e grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-ou 9-)-2,3,4,5-tetraidro-1H-benzo[c]azepinila.

Exemplos do grupo tetraidrobenzodiazepinila incluem um grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-ou 9-)-2,3,4,5-tetraidro-1H-benzo[b][1.4]diazepinila e grupo (1-, 2-, 3-, 4-,5-, 6-, 7-, 8-ou 9-)-2,3,4,5-tetraidro-1H-benzo[e][1.4]diazepinila.

Exemplos do grupo hexaidrobenzazocinila incluem um grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9-, ou 10-)-1,2,3,4,5,6-tetraidrobenzo[b]azocinila e grupo (1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9-ou 10-)-1,2,3,4,5,6-hexaidrobenzo[c]azocinila.

Exemplos do grupo diidrobenzoxazinila incluem um grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-ou 8-)-3,4-diidro-2H-benzo[b][1.4]oxazinila e grupo (1-, 2-, 4-

, 5-, 6-, 7-ou 8-)-2,4-diidro-1H-benzo[d][1.3]oxazinila.

Exemplos do grupo diidrobenzoxazolila incluem um grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-ou 7-)-2, 3-diidrobenzoxazolila.

Exemplos do grupo benzisoxazolila incluem um grupo (3-, 4-, 5-, 6-ou 7-)-benzo[d]- isoxazolila e grupo (3-, 4-, 5-, 6-ou 7-)-benzo[c]-isoxazolila.

Exemplos do grupo benzoxadiazolila incluem um grupo (4-ou 5-)-benzo[c][1.2.5]oxadiazolila.

Exemplos do grupo tetraidrobenzoxazepinila incluem um grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-ou 9-)-2,3,4,5-tetraidrobenzo[b][1.4]oxazepinila, grupo (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-ou 9-)-1,3,4,5-tetraidrobenzo[e][1.3]oxazepinila e grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-ou 9-)-2,3,4,5-tetraidrobenzo[f][1.4]oxazepinila.

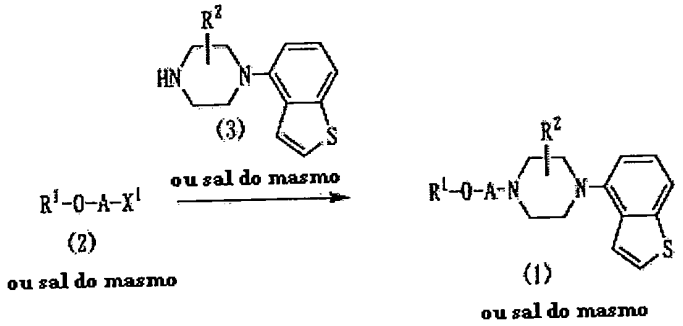
Exemplos do grupo diidrobenzotiazinila incluem um grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-ou 8-)-3,4-diidro-2H-benzo[b][1.4]tiazinila e grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-ou 8-)-3,4-diidro-2H-benzo[e][1.3]tiazinila.

Exemplos do grupo benzoxatiolila incluem um grupo (2-, 4-, 5-, 6-ou 7-)-benzo[d][1.3]oxatiolila, grupo (3-, 4-, 5-, 6-ou 7-)-3H-benzo[c][1.2]oxatiolila e grupo (3-, 4-, 5-, 6-ou 7-)-3H-benzo[d][1.2]oxatiolila.

Exemplos do grupo diidrobenzofurila incluem um grupo (2-, 3-, 4-, 5-, 6-ou 7-)-2, 3-diidrobenzofurila.

Um composto heterocíclico (daqui em diante referido como um composto (1)) representado pela fórmula geral (1) pode ser produzido por vários tipos de métodos, por exemplo, um método apresentado na seguinte fórmula de reação-1 ou fórmula de reação 2.

[Fórmula 4]




em que $R^1$, $R^2$ e A são os mesmos definidos anteriormente; e $X^1$ é um átomo de halogênio ou um grupo que medeia a mesma reação de substituição que em um átomo de halogênio.

Exemplos do grupo que medeia a mesma reação de substituição que em um átomo de halogênio incluem um grupo alcanossulfonilóxi inferior, grupo aril sulfonilóxi e grupo aralquil sulfonilóxi.

Um átomo de halogênio representado por $X^1$ na fórmula geral (2) é um átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo e átomo de iodo.

Exemplos específicos do grupo alcanossulfonilóxi inferior representado por $X^1$ incluem um grupo alcanossulfonilóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono, tais como um grupo metanossulfonilóxi etanossulfonilóxi, grupo isopropanosulfonilóxi, grupo n-propanosulfonilóxi, grupo n-butanossulfonilóxi, grupo terc-butanossulfonilóxi, grupo n-pentanossulfonilóxi e grupo n-hexanossulfonilóxi.

Exemplos específicos do grupo aril sulfonilóxi representado por $X^1$ incluem um grupo fenil sulfonilóxi e grupo naftil sulfonilóxi que podem ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono, um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono, um grupo nitro, e um átomo de halogênio, no anel fenila. Exemplos específicos do grupo fenil sulfonilóxi que pode ter um substituinte incluem um grupo fenil sulfonilóxi, grupo 4-metil fenil sulfonilóxi, grupo 2-metil fenil sulfonilóxi, grupo 4-nitrofenil sulfonilóxi, grupo 4-metoxifenil sulfonilóxi, grupo 2-nitrofenil sulfonilóxi e grupo 3-clorofenil sulfonilóxi. Exemplos específicos do grupo

naftil sulfonilóxi incluem grupo α-naftil sulfonilóxi e grupo β-naftil sulfonilóxi.

Exemplos do grupo aralquil sulfonilóxi representado por $X^1$ incluem um grupo alquilsulfonilóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono e substituído por um grupo fenila; e

um grupo alquilsulfonilóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono e substituído por um grupo naftila; ambos os quais podem ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono, um grupo alcóxi reto ou ramificado tendo 1 a 6 átomos de carbono, um grupo nitro e um átomo de halogênio, no anel fenila.

Exemplos específicos do grupo alquil sulfonilóxi substituído por um grupo fenila da forma mencionada anteriormente incluem um grupo benzil sulfonilóxi, grupo 2-fenila etil sulfonilóxi, grupo 4-fenil butil sulfonilóxi, grupo 2-metil benzil sulfonilóxi, grupo 4-metoxibenzil sulfonilóxi, grupo 4-nitrobenzil sulfonilóxi e grupo 3-clorobenzil sulfonilóxi. Exemplos específicos do grupo alquil sulfonilóxi substituído por um grupo naftila incluem um grupo α-naftil metil sulfonilóxi e grupo β-naftil metil sulfonilóxi.

O composto (1) pode ser produzido reagindo um composto (daqui em diante referido como um composto (2)) representado pela fórmula geral (2) e um composto (daqui em diante referido como um composto (3)) representado pela fórmula geral (3).

Esta reação é, em geral, realizada em um solvente convencional que pode não afetar negativamente a reação, tal como água; um solvente a base de álcool, tais como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoretanol, e etileno glicol; um solvente a base de cetona, tais como acetona e metil etil cetona; um solvente a base de éter, tais como tetraidrofurano, dioxano, éter dietílico, e diglima; um solvente a base de éster,

tais como acetato de metila e acetato de etila; um solvente polar não protônico, tais como acetonitrila, N,N-dimetil formamida, e sulfóxido de dimetila; um solvente a base de hidrocarboneto halogenado, tais como cloreto de metileno e cloreto de etileno; ou outros solventes orgânicos. Além do mais, a reação pode ser realizada em uma mistura de solução destes solventes convencionais. A reação é, em geral, realizada na presença de uma base inorgânica, tais como um metal alcalino (por exemplo, sódio e potássio), um hidrogeno carbonato de metal alcalino (por exemplo, hidrogeno carbonato de lítio, hidrogeno carbonato de sódio, e hidrogeno carbonato de potássio), hidróxido de metal alcalino (por exemplo, hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, e hidróxido de césio), carbonato de metal alcalino (por exemplo, carbonato de lítio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, e carbonato de césio), alcóxido inferior de metal alcalino (por exemplo, metóxido de sódio e etóxido de sódio), e um hidreto (por exemplo, hidreto de sódio e hidreto de potássio); ou na presença de uma base orgânica, tais como um trialquil amina (por exemplo, trimetil amina, trietil amina, N-etil diisopropil amina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilanilina, N-metil morfolina, 1,5-diazabiciclo[4.3.0]non-5-eno (DBN), 1,4-diazabiciclo[2.2.2]octano (DABCO), e 1,8-diazabiciclo[5.4.0]undeceno-7 (DBU). Quando estas bases tomam a forma líquida elas podem ser usadas como solventes.

Estes compostos básicos podem ser usados sozinhos ou em uma mistura de dois tipos ou mais.

Um composto básico pode ser usado em uma quantidade molar, isto é, em geral, 0,5 a 10 vezes, preferivelmente 0,5 a 6 vezes maior que do composto (2).

A reação mencionada anteriormente pode ser realizada, se necessário, com a adição de um iodeto de metal alcalino que serve como um acelerador, tais como iodeto de potássio e iodeto de sódio.

A razão de um composto (2) para um composto (3) usada na fórmula de reação-1 pode ser pelo menos cerca de 0,5 vezes mol, preferivelmente cerca de 0,5-5 vezes por mol.

A temperatura de reação é não é particularmente limitada e pode ser, em geral, realizada em condições de resfriamento ou aquecimento e preferivelmente realizada em uma temperatura próxima à temperatura ambiente a cerca de 150 °C por 1 a 30 horas.

O composto (2) que serve como um material de partida para um composto de acordo com a presente invenção inclui um composto inédito e pode ser produzido por vários métodos, por exemplo, um método representados pela seguinte fórmula de reação-3.

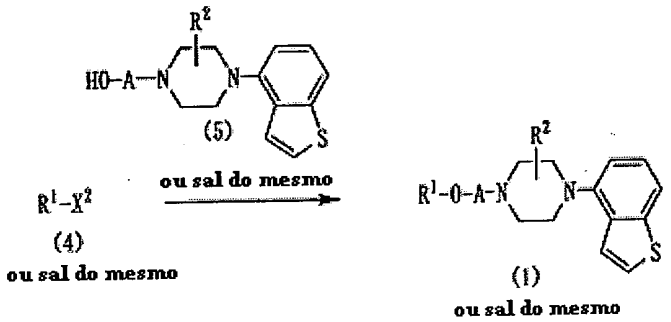
O composto (3) que serve como um material de partida para um composto de acordo com a presente invenção é um composto conhecido ou um composto que pode ser facilmente produzido a partir de um composto conhecido.

Um sal de um composto (2) em vez do composto (2) e um sal de um composto (3) em vez do composto (3) podem ser usados. Os sais de compostos (2) e (3) incluem sais de adição de ácido. Estes sais de adição de ácido podem ser preparados reagindo um ácido farmaceuticamente aceitável com um composto (2) ou (3). Exemplos do ácido aqui usado incluem ácidos inorgânicos, tais como ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido clorídrico, ácido fosfórico, e ácido bromídrico; ácidos sulfônicos, tais como ácido p-toluenossulfônico, ácido metanossulfônico e ácido etanossulfônico; e ácidos orgânicos, tais como ácido acético, ácido oxálico, ácido maléico, ácido fumárico, ácido málico, ácido tartárico, ácido cítrico, ácido succínico, e ácido benzóico.

Dos compostos (2), um composto tendo um grupo ácido pode facilmente produzir um sal reagindo com um composto básico farmaceuticamente aceitável. Exemplos de um composto básico como este

incluem hidróxidos metálicos, tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de lítio, e hidróxido de cálcio; carbonatos ou bicarbonatos de metal alcalino, tais como carbonato de sódio, hidrogeno carbonato de sódio, hidrogeno carbonato de potássio; e alcolatos de metal alcalino, tais como metilato de sódio ate e etilato de potássio.

[Fórmula 5]




em que $R^1$, $R^2$ e A são os mesmos definidos anteriormente; e $X^2$ é um grupo hidróxi, átomo de halogênio ou um grupo que medeia a mesma reação de substituição que em um átomo de halogênio.

Exemplos do átomo de halogênio representados por $X^2$ e o grupo que medeia a mesma reação de substituição que em um átomo de halogênio com relação à fórmula geral (4) são os mesmos mencionados anteriormente.

O composto (1) pode ser produzido reagindo um composto (daqui em diante referido como um composto (4)) representado pela fórmula geral (4) e um composto (daqui em diante referido como um "composto (5)") representado pela fórmula geral (5).

A reação pode ser realizada em condições similares às da fórmula de reação-1.

No caso de um composto (4) em que $X^2$ é um grupo hidróxi, a reação pode ser realizada em um solvente apropriado na presença de um agente de condensação apropriado.

Esta reação é, em geral, realizada em um solvente

convencional que pode não afetar negativamente a reação, tal como água; um solvente a base de álcool, tais como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoretanol, e etileno glicol; um solvente a base de cetona, tais como acetona e metil etil cetona; um solvente a base de éter, tais como tetraidrofurano, dioxano, éter dietílico, e diglima; um solvente a base de éster, tais como acetato de metila e acetato de etila; um solvente polar não protônico, tais como acetonitrila, N,N-dimetil formamida, e sulfóxido de dimetila; um solvente a base de hidrocarboneto halogenado, tais como cloreto de metileno e cloreto de etileno; ou outros solventes orgânicos. Além do mais, como um solvente a ser aqui usado, uma mistura de solução destes solventes convencionais pode ser mencionada.

Como o agente de condensação, uma mistura de um azocarboxilato, tais como dietil azodicarboxilato e um composto de fosfina, tal como trifenil fosfina pode ser mencionado.

A quantidade do agente de condensação aqui usado é, em geral, pelo menos equimolar, preferivelmente equimolar a duas vezes mais que a de um composto (4).

A razão de um composto (4) para um composto (5) usada na fórmula de reação-2 pode ser, em geral, pelo menos equimol preferivelmente cerca de 2 vezes por mol.

A temperatura de reação não é particularmente limitada e pode, em geral, ser realizada em condições de resfriamento ou aquecimento, e preferivelmente realizada em uma temperatura de 0 °C a cerca de 150 °C por 1 a 10 horas.

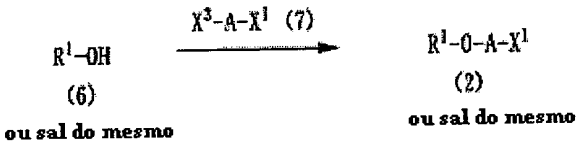
O composto (4) que serve como um material de partida para um composto de acordo com a presente invenção é um composto conhecido ou um composto que pode ser facilmente produzido a partir de um composto conhecido.

O composto (5) que serve como um material de partida para

um composto de acordo com a presente invenção inclui um composto inédito e um composto que pode ser produzido por vários métodos, por exemplo, um método representado pela seguinte fórmula de reação-4 ou -5.

Um sal de um composto (4) em vez do composto (4) e um sal de um composto (5) em vez do composto (5) pode ser usado. Como um sal de um composto (4) preferível, o mesmo sal apresentado em um composto (2) pode ser mencionado. Como um sal de um composto (5) preferível, o mesmo sal apresentado em um composto (3) pode ser mencionado.

[Fórmula 6]




em que $R^1$, $X^1$ e A são os mesmos definidos anteriormente; e $X^3$ é um átomo de halogênio ou um grupo que medeia a mesma reação de substituição que em um átomo de halogênio.

Exemplos do átomo de halogênio representado por $X^3$ e o grupo que medeia a mesma reação de substituição que em um átomo de halogênio com relação à fórmula geral (7) são os mesmos mencionados anteriormente.

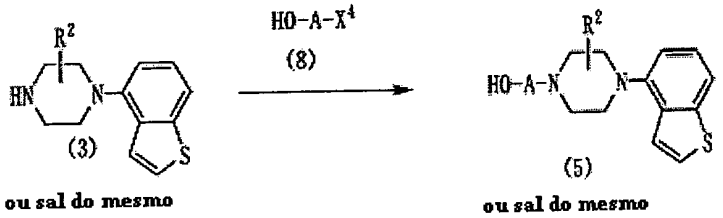
O composto (2) pode ser produzido reagindo um composto (daqui em diante referido como um composto (6)) representado pela fórmula geral (6) e um composto (daqui em diante referido como um composto (7)) representado pela fórmula geral (7).

A reação pode ser realizada em condições similares às da fórmula de reação-1.

Os compostos (6) e (7) que servem como materiais de partida para um composto de acordo com a presente invenção são compostos conhecidos ou compostos que podem facilmente ser produzidos a partir de compostos conhecidos.

Em vez de um composto (6), um sal do composto (6) pode ser usado. Como um sal de um composto (6) preferível, o mesmo sal apresentado em um composto (2) pode ser mencionado.

[Fórmula 7]




em que $R^2$ e A são os mesmos definidos anteriormente; e $X^4$ é um átomo de halogênio ou um grupo que medeia a mesma reação de substituição que em um átomo de halogênio.

Exemplos do átomo de halogênio representado por $X^4$ e o grupo que medeia a mesma reação de substituição que em um átomo de halogênio com relação à fórmula geral (8) são os mesmos mencionados anteriormente.

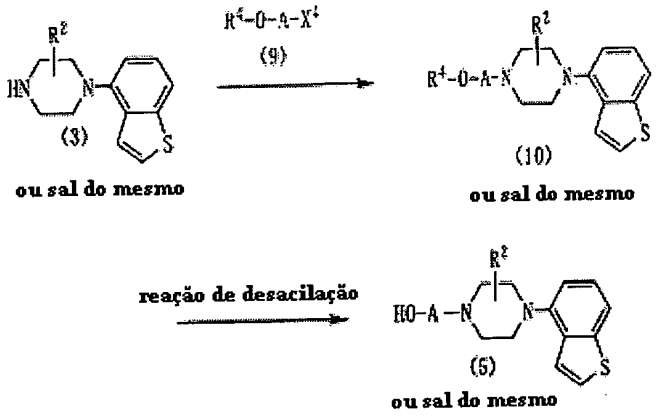
O composto (5) pode ser produzido reagindo um composto (3) e um composto (daqui em diante referido como um composto (8)) representado pela fórmula geral (8).

A reação pode ser realizada em condições similares às da fórmula de reação-1.

O composto (8) que serve como um material de partida para um composto de acordo com a presente invenção é um composto conhecido ou um composto que pode ser facilmente produzido a partir de um composto conhecido.

Em vez de um composto (3), um sal de o composto (3) pode ser usado. Como um sal de um composto (3) preferível, os mesmos sais anteriores podem ser mencionados.

[Fórmula 8]




em que $R^2$ e A são os mesmos definidos anteriormente; $R^4$ é um grupo alcanoíla inferior; e $X^4$ é um átomo de halogênio ou um grupo que medeia a mesma reação de substituição que em um átomo de halogênio.

Exemplos do grupo alcanoíla inferior representados por $R^4$ nas fórmulas gerais (9) e (10) são os mesmos mencionados anteriormente.

Além do mais, exemplos do átomo de halogênio representado por $X^4$ e o grupo que medeia a mesma reação de substituição que em um átomo de halogênio com relação à fórmula geral (9) são os mesmos mencionados anteriormente.

Um composto (daqui em diante referido como um composto (10)) representado pela fórmula geral (10) pode ser produzido reagindo um composto (3) e um composto (9).

A reação pode ser realizada em condições similares às da fórmula de reação-1.

O composto (9) que serve como um material de partida para um composto de acordo com a presente invenção é um composto conhecido ou um composto que pode ser facilmente produzido a partir de um composto conhecido.

Em vez de um composto (3), um sal de o composto (3) pode ser usado. Como um preferível sal de um composto (3), os mesmos sais anteriores podem ser mencionados.

Subseqüentemente, o composto (10) é submetido a uma reação

para remover um grupo acila para produzir um composto (5).

Como um método preferível da reação, uma reação convencional, tal como hidrólise pode ser mencionada. A reação de hidrólise pode ser preferivelmente realizada na presença de uma base ou um ácido incluindo ácido de Lewis. Exemplos da base preferível incluem sais inorgânicos, tais como um metal alcalino (por exemplo, sódio e potássio), um hidrogeno carbonato de metal alcalino (por exemplo, hidrogeno carbonato de lítio, hidrogeno carbonato de sódio, e hidrogeno carbonato de potássio), um hidróxido de metal alcalino (por exemplo, hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, e hidróxido de césio), um carbonato de metal alcalino (por exemplo, carbonato de lítio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, e carbonato de césio), um alcóxido inferior de metal alcalino (por exemplo, metóxido de sódio e etóxido de sódio), e hidretos (por exemplo, hidreto de sódio e hidreto de potássio); e bases orgânicas, tais como um trialquil amina (por exemplo, trimetil amina, trietil amina, e N-etil diisopropil amina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilanilina, N-metil morfolina, DBN, DABCO, e DBU. Como um ácido preferível, pode-se mencionar ácidos orgânicos (tais como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiônico, ácido tricloroacético, ácido trifluoracético) e ácidos inorgânicos (tais como ácido clorídrico, ácido bromídrico, ácido sulfúrico, cloreto de hidrogênio, e brometo de hidrogênio). A reação de remoção usando um ácido de Lewis, tal como um ácido trialoacético (por exemplo, ácido tricloroacético e ácido trifluoracético) pode ser preferivelmente realizada na presença de um agente de aprisionamento de cátion (por exemplo, anisol e fenol).

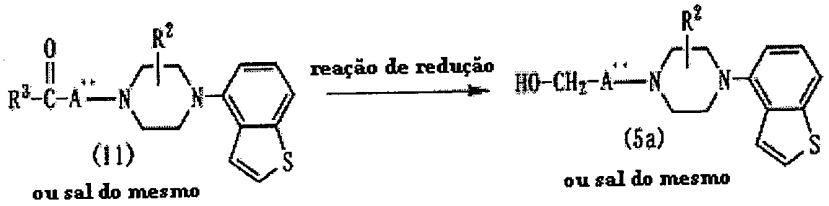
Esta reação é, em geral, realizada em um solvente convencional que pode não afetar negativamente a reação, tal como água; um solvente a base de álcool, tais como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoretanol, e etileno glicol; um solvente a base de cetona, tais como

acetona e metil etil cetona; um solvente a base de éter, tais como tetraidrofurano, dioxano, éter dietílico, e diglima; um solvente a base de éster, tais como acetato de metila e acetato de etila; um solvente polar não protônico, tais como acetonitrila, N,N-dimetil formamida, e sulfóxido de dimetila; um solvente a base de hidrocarboneto halogenado, tais como cloreto de metileno e cloreto de etileno; ou outros solventes orgânicos. Além do mais, a reação pode ser realizada em uma mistura de solução destes solventes convencionais. Destes, etanol é preferível. A temperatura de reação não é particularmente limitada e pode, em geral, ser realizada em condições de resfriamento ou aquecimento, e preferivelmente realizada próximo à temperatura ambiente até próximo ao ponto de ebulição do solvente a ser usado por 0,5 a 75 horas.

Em vez de um composto (10), um sal de o composto (10) pode ser usado. Como um sal de um composto (10) preferível, o mesmo sal apresentado em um composto (3) pode ser mencionado.

Além do mais, um composto (daqui em diante referido como um composto (5a)) onde A do composto (5) representa $-CH_2A''$ -onde A" representa um grupo alquileno C1 a C5 pode ser produzido por um método representado pela seguinte fórmula de reação-6.

[Fórmula 9]




em que $R^2$ é o mesmo definido anteriormente; e $R^3$ é um grupo alcóxi inferior. A" representa um grupo alquileno C1 a C5. O grupo alcóxi inferior representado por $R^3$ na fórmula geral (11) é o mesmo definido anteriormente.

Exemplos do grupo alquileno C1 a C5 representado por A" nas fórmulas gerais (11) e (5a) incluem um grupo alquileno reto ou ramificado

tendo 1 a 5 átomos de carbono, tais como metileno, etileno, metil metileno, trimetileno, tetrametileno, 1-metil trimetileno, 2-metil trimetileno, 3-metil tetrametileno, pentametileno, e 2,2-dimetil trimetileno.

O composto (5a) pode ser produzido submetendo um composto (daqui em diante referido como um composto (11)) representado pela fórmula geral (11) a uma reação de redução.

A reação pode ser realizada pelo método apresentado no exemplo referência 6 ou um método similar deste. A reação também pode ser realizada por um método convencional usando um agente de redução.

Como um agente de redução preferível, pode-se mencionar um hidreto (tais como hidreto de alumínio e lítio, boroidreto de sódio, boroidreto de lítio, diborano, e cianoboroidreto de sódio).

Esta reação é, em geral, realizada em um solvente convencional que pode não afetar negativamente a reação, tais como um solvente a base de álcool, tais como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoretanol, e etileno glicol; um solvente a base de cetona, tais como acetona e metil etil cetona; um solvente a base de éter, tais como tetraidrofurano, dioxano, éter dietílico, e diglima; um solvente a base de éster, tais como acetato de metila e acetato de etila; um solvente polar não protônico, tais como acetonitrila, N,N-dimetil formamida, e sulfóxido de dimetila; um solvente a base de hidrocarboneto halogenado, tais como cloreto de metileno e cloreto de etileno; ou outros solventes orgânicos. Além do mais, a reação pode ser realizada em uma mistura de solução destes solventes convencionais. A temperatura de reação não é particularmente limitada e pode, em geral, ser realizada em condições de resfriamento ou aquecimento, e preferivelmente realizada próximo à temperatura ambiente até próximo do ponto de ebulição do solvente a ser usado por 0,5 a 75 horas.

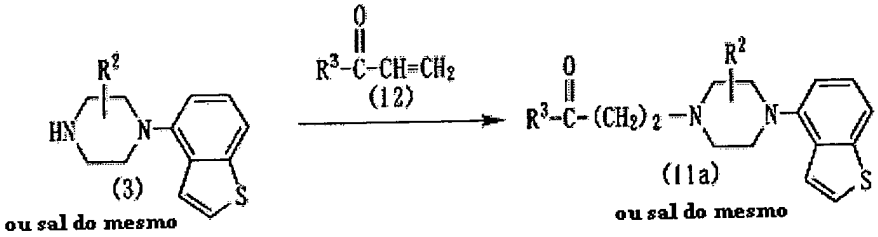
O composto (11) que serve como um material de partida para um composto de acordo com a presente invenção é um composto conhecido

ou um composto que pode ser facilmente produzido a partir de um composto conhecido.

Em vez de um composto (11), um sal de o composto (11) pode ser usado. Como um preferível sal de um composto (11), o mesmo sal apresentado em um composto (2) pode ser mencionado.

Além do mais, um composto (daqui em diante referido como um composto (11a)) onde A" do composto (11) representa "-$(CH_2)_2$-" pode ser produzido por um método representado pela seguinte fórmula de reação-7.

[Fórmula 10]




onde $R^2$ e $R^3$ são os mesmos definidos anteriormente.

O composto (11a) pode ser produzido reagindo um composto (3) e um composto (daqui em diante referido como um composto (12)) representado pela fórmula geral (12).

A reação pode ser realizada pelo método apresentado no exemplo referência 5 ou um método similar deste. Esta reação é, em geral, realizada em um solvente convencional que pode não afetar negativamente a reação, tais como água, um solvente a base de álcool, tais como metanol, etanol, isopropanol, n-butanol, trifluoretanol, e etileno glicol; um solvente a base de cetona, tais como acetona e metil etil cetona; um solvente a base de éter, tais como tetraidrofurano, dioxano, éter dietílico, e diglima; um solvente a base de éster, tais como acetato de metila e acetato de etila; um solvente polar não protônico, tais como acetonitrila, N,N-dimetil formamida, e sulfóxido de dimetila; um solvente a base de hidrocarboneto halogenado, tais como cloreto de metileno e cloreto de etileno; ou outros solventes orgânicos. Além do mais, a reação pode ser realizada em uma mistura de solução destes

solventes convencionais. A temperatura de reação não é particularmente limitada e pode, em geral, ser realizada em condições de resfriamento ou aquecimento, e preferivelmente realizada próximo à temperatura ambiente até próximo do ponto de ebulição do solvente a ser usado por 0,5 a 75 horas.

O composto (12) que serve como um material de partida para um composto de acordo com a presente invenção é um composto conhecido ou um composto que pode ser facilmente produzido a partir de um composto conhecido.

Um sal de um composto (3) em vez do composto (3) e um sal de um composto (12) em vez do composto (12) pode ser usado. Como um sal de um composto (3) preferível, o mesmo sal apresentado anteriormente pode ser mencionado. Como um sal de um composto (12) preferível, o mesmo sal apresentado em um composto (2) pode ser mencionado.

O composto alvo obtido por cada uma das fórmulas anteriores de reação pode formar um sal adequado. Tais sais adequados incluíram sais preferíveis de composto (1) exemplificados a seguir.

Os sais preferíveis do composto (1) são sais farmacologicamente aceitáveis e exemplos incluem sais metálicos, tais como sais de metal alcalino (por exemplo, sal de sódio, sal de potássio, etc.), sais de metal alcalino terroso (por exemplo, sal de cálcio, sal de magnésio, etc.), sais de bases inorgânicas, tais como sal de amônio, carbonatos de metal alcalino (por exemplo, carbonato de lítio, carbonato de potássio, carbonato de sódio, carbonato de césio, etc.), hidrogeno carbonatos de metal alcalino (por exemplo, hidrogeno carbonato de lítio, hidrogeno carbonato de sódio, potássio bicarbonato, etc.), hidróxido de metal alcalinos (por exemplo, hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de césio, etc.); por exemplo, sais de base orgânicas, tais como trialquil(inferior) amina (por exemplo, trimetil amina, trietil amina, N-etil diisopropil amina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilanilina,

N-(inferior)alquil-morfolina (por exemplo, N-metil morfolina), 1,5-diazabiciclo[4.3.0]noneno-5 (DBN), 1,8-diazabiciclo[5.4.0]undeceno-7 (DBU), 1,4-diazabiciclo[2.2.2] octano (DABCO); sais de ácidos inorgânicos, tais como cloridrato, bromidrato, iodidrato, sulfato, nitrato, fosfato; sais de ácidos orgânicos, tais como formato, acetato, propionato, oxalato, malonato, succinato, fumarato, maleato, lactato, malato, citrato, tartrato, carbonato, picrato, metanossulfonato, etanossulfonato, p-toluenossulfonato, glutamato.

Além do mais, compostos na forma em que solvato (por exemplo, hidrato, etanolato, etc.) foi adicionado aos compostos de partida e composto alvo apresentados em cada uma das fórmulas de reação são incluídos em cada uma das fórmulas gerais. Como um solvato preferível, hidrato pode ser mencionado.

Cada um dos compostos alvo obtidos por cada uma das fórmulas gerais pode ser isolado e purificado a partir da mistura de reação, por exemplo, submetendo a mistura de reação à operação de isolamento, tais como filtração, concentração e extração depois do resfriamento para separar um produto de reação bruto depois da operação de purificação convencional, tais como cromatografia em coluna ou recristalização.

O composto representado pela fórmula geral (1) da presente invenção naturalmente engloba isômeros, tais como isômero geométrico, estereoisômero e enanciômero.

Um composto e um sal do mesmo representado pela fórmula geral (1) podem ser usados na forma de preparação farmacêutica geral. A preparação pode ser preparada pelo uso de um diluente ou um excipiente, tais como uma carga, agente de extensão, aglutinante, umectante, desintegrante, agente tensoativo, e lubrificante. Como uma preparação farmacêutica, várias formas podem ser selecionadas dependendo do propósito terapêutico. Formas típicas deste incluem um comprimido, pílula, pó, líquido, suspensão, emulsão, grânulo, encapsulado, supositório, e injeção (líquido, suspensão).

Na formação de um comprimido, uma ampla variedade de tipos de veículos convencionalmente conhecidos na técnica pode ser usada. Exemplos do veículo que pode ser usado incluem um excipiente, tais como lactose, sacarose, cloreto de sódio, glicose, uréia, amido, carbonato de cálcio, caolim, celulose cristalina, e silicato; um aglutinante, tais como água, etanol, propanol, xarope simples, solução de glicose, solução de amido, solução de gelatina, carboximetil celulose, goma-laca, metil celulose, fosfato de potássio, e polivinil pirrolidona; um desintegrante, tais como amido seco, alginato de sódio, ágar em pó, laminado em pó, hidrogeno carbonato de sódio, carbonato de cálcio, éster do ácido graxo polioxietileno sorbitano, lauril sulfato de sódio, monoglicerídeo de ácido esteárico, amido, e lactose; um supressor de desintegração, tais como sacarose, estearina, manteiga de cacau, e óleo hidrogenado; um sorbefaciente, tais como base de amônio quaternário e lauril sulfato de sódio; um umectante, tais como glicerina e amido; um agente de adsorção, tais como amido, lactose, caolim, bentonita, e sílica coloidal; e um lubrificante, tais como talco refinado, estearato, ácido bórico em pó, e polietileno glicol. Além do mais, se necessário, um comprimido pode ser revestido com um filme geral. Exemplos de um comprimido revestido como este incluem um comprimido revestido com açúcar, comprimido encapsulado com gelatina, comprimido com revestimento entérico, comprimido revestido com filme ou comprimido com camada dupla, e comprimido com múltiplas camadas.

Na formação de um pílula, uma ampla variedade de tipos de veículos convencionalmente conhecidos na técnica pode ser usada. Exemplos do veículo que pode ser usado incluem um excipiente, tais como glicose, lactose, amido, manteiga de cacau, óleo vegetal endurecido, caolim e talco; um aglutinante, tais como goma arábica em pó, tragacanto em pó, gelatina e etanol; e um desintegrante, tal como laminaran e ágar.

Na formação de um supositório, uma ampla variedade de tipos

de veículos convencionalmente conhecidos na técnica pode ser usada. Exemplos do veículo que pode ser usado incluem polietileno glicol, manteiga de cacau, álcool superior, ésteres de um álcool superior, gelatina, e glicerídeio semi-sintético.

Uma cápsula é normalmente preparada misturando um composto ingrediente ativo com um veículo da forma ilustrada anteriormente de acordo com um método convencional e carregando a mistura em uma cápsula de gelatina dura ou uma cápsula macia.

No preparo de uma injeção, um agente líquido, emulsão e suspensão são preferivelmente esterilizados e isotônicos com o sangue. Quando eles são preparados em uma injeção, qualquer diluente pode ser usado desde que ele seja convencionalmente usado como um diluente na técnica. Exemplos do diluente que pode ser usado incluem água, álcool etílico, macrogol, propileno glicol, álcool isoestearílico etoxilado, álcool isoestearílico polietoxilado, ésteres do ácido graxo polioxietileno sorbitano.

Observe que, neste caso, uma preparação farmacêutica pode conter um sal, glicose ou glicerina em uma quantidade suficiente para preparar uma solução isotônica. Alternativamente, um agente solubilizante auxiliar geral, tampão, de disparo podem ser adicionados. Além do mais, um agente de pigmento, conservante, aroma, sabor, adoçante e outras substâncias medicinais podem ser adicionados a uma preparação farmacêutica, se necessário.

A quantidade de um composto da fórmula geral (1) e um sal do mesmo para estar contida em uma preparação farmacêutica de acordo com a presente invenção não é particularmente limitada e apropriadamente selecionada da ampla faixa; entretanto, em geral, cerca de 1 a 70 % em peso, preferivelmente cerca de 1 a 30 % em peso em uma composição da preparação.

Um método de administrar uma preparação farmacêutica de

acordo com a presente invenção não é limitado e administrado por um método de acordo com a forma de uma preparação, a idade, sexo e outras condições de um paciente, e severidade de uma doença. Por exemplo, no caso de um comprimido, pílula, agente líquido, suspensão, emulsão, grânulo e cápsula, ele é peroralmente administrado. Além do mais, no caso de um injeção, ela é intravenosamente administrada por si só ou misturando com um reabastecedor geral, tais como glicose e aminoácidos, e, se necessário, ela é somente administrada intramuscular, intracutânea, subcutânea ou intraperitonealmente. No caso de um supositório, ele é administrado no reto.

A dose de uma preparação farmacêutica de acordo com a presente invenção é apropriadamente selecionada dependendo do regime de dosagem (direção de uso), idade, sexo e outras condições de um paciente, e severidade de uma doença, etc.; entretanto, a dose de um composto ingrediente ativo pode ser, em geral, e preferivelmente estabelecida em cerca de 0,1 a 10 mg/peso (kg) por dia. Deseja-se que um composto ingrediente ativo esteja contido na faixa de cerca de 1 a 200 mg por unidade de dosagem de uma preparação.

[Vantagens da Invenção]

Um composto de acordo com a presente invenção tem um efeito agonista parcial do receptor D2, efeito antagonista do receptor 5-HT2A e efeito inibitório da absorção da serotonina.

O efeito agonista parcial do receptor D2 refere-se a uma ação que desacelera neurotransmissão dopaminérgica (DA) quando ele é melhorado, embora acelere a neurotransmissão dopaminérgica (DA) quando ele é diminuído. Desta maneira, o agonista parcial do receptor D2 age como um estabilizante do sistema de dopamina, que estabiliza neurotransmissão DA em um estado normal. Em virtude deste efeito, o composto da presente invenção produz um excelente efeito de melhora clínica nos sintomas causados por neurotransmissão DA anormal (aceleração ou desaceleração)

sem desenvolver efeitos colaterais. Como excelente efeito de melhora clínica pode-se mencionar efeitos de melhora de sintomas positivos e negativos, falha cognitiva e sintoma depressivo (ver Michio Toru, Psychiatry, Vol. 46, página 855-864 (2004); Tetsuro Kikuchi e Hirose Takeshi, Brain Science, vol. 25, página 579-583 (2004); e Harrison, T. S. e Perry, C.M.: Medicamentos 64: 1715-1736, 2004).

O efeito antagonista do receptor 5-HT2A refere-se a uma ação que reduz os efeitos colaterais extrapiramidais e desenvolve uma resposta clínica superior e mais especificamente efetivamente trabalha para melhorar sintomas negativos, falha cognitiva, sintoma depressivo, e insônia (ver Jun Ishigooka e Ken Inada: Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology, vol. 4, página 1653-1664 (2001); Mitsukuni Murasaki: Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology, vol. 1, página 5-22 (1998), e Meltzer, H. Y. et al.: Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1159-1172, 2003).

O efeito inibitório da absorção da serotonina é, por exemplo, efetivo na melhoria de sintomas depressivos (ver Mitsukuni Murasaki: Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology, vol. 1, página 5-22 (1998)).

O composto da presente invenção é excelente em todos estes três efeitos ou significativamente excelente em um ou dois efeitos destes.

Além do mais, alguns dos compostos de acordo com a presente invenção têm um efeito antagonista do receptor α1 além dos efeitos mencionados anteriormente. O efeito antagonista do receptor α1 é efetivo na melhora dos sintomas positivos de esquizofrenia (ver Svensson, T. H.: Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1145-1158, 2003)

Desta forma, um composto da presente invenção tem um amplo espectro de tratamento para esquizofrenia e outros distúrbios do sistema nervoso central e possui uma resposta clínica superior.

Desta maneira, um composto da presente invenção é

extremamente efetivo para melhorar vários tipos de distúrbios do sistema nervoso central, tais como esquizofrenia; esquizofrenia refratória, intratável ou crônica; perturbação emocional; distúrbio psicótica; distúrbio de humor; distúrbio bipolar (por exemplo, distúrbio bipolar tipo I e distúrbio bipolar tipo II); depressão, depressão endógena, depressão maior; depressão de melancolia e refratória; distúrbio distímico; distúrbio ciclotímico; distúrbio de ansiedade (por exemplo, ataque de pânico, distúrbio de pânico, agorafobia, fobia social, distúrbio obsessivo-compulsivo, distúrbio de estresse pós traumático, distúrbio de ansiedade generalizada, e distúrbio de estresse agudo); distúrbio somatoforme (por exemplo, histeria, distúrbio de somatização, distúrbio de conversão, distúrbio de dor, e hipocondríase), distúrbio factioso; distúrbio dissociativo; distúrbio sexual (por exemplo, disfunção sexual, distúrbio de desejo sexual, distúrbio de excitação sexual, e disfunção erétil); distúrbio alimentar (por exemplo, anorexia nervosa e bulimia nervosa); distúrbio do sono; distúrbio do ajuste; distúrbio relacionada à substância (por exemplo, abuso de álcool; intoxicação por álcool; abstinência de medicamento, intoxicação por estimulante, e narcotismo); anhedonia (por exemplo, anhedonia iatrogênica, anhedonia de uma causa psíquica ou mental, anhedonia associada a depressão, e anhedonia associada a esquizofrenia); delírio; falha cognitiva; falha cognitiva associada o mal de Alzheimer, mal de Parkinson e outros distúrbios neurodegenerativos; falha cognitiva causada pelo mal de Alzheimer; mal de Parkinson e doenças neurodegenerativas associadas; falha cognitiva de esquizofrenia; falha cognitiva causada por esquizofrenia refratória, intratável ou crônica; vômito; doença do movimento; obesidade; enxaqueca; dor (cabeça); retardo mental; distúrbio de autismo (autismo); distúrbio de Tourette; distúrbio de cacoete; distúrbio de déficit de atenção/hiperatividade; distúrbio de conduta; e síndrome de Down.

Além do mais, um composto da presente invenção tem poucos efeitos colaterais, e excelente tolerabilidade e segurança.

Os compostos de partida usados em cada uma das fórmulas anteriores de reação podem ser sal adequado, o composto alvo obtido para cada uma das reações pode formar um sal adequado. Tais sais adequados incluíram sais preferíveis do composto (1) exemplificado a seguir.

Os sais preferíveis do composto (1) são sais farmacologicamente aceitáveis e exemplos incluem sais metálicos, tais como sais de metal alcalino (por exemplo, sal de sódio, sal de potássio, etc.), sais de metal alcalino terroso (por exemplo, sal de cálcio, sal de magnésio, etc.), sais de bases inorgânicas, tais como sal de amônio, carbonatos de metal alcalino (por exemplo, carbonato de lítio, carbonato de potássio, carbonato de sódio, carbonato de césio, etc.), hidrogeno carbonato de metal alcalinos (por exemplo, hidrogeno carbonato de lítio, hidrogeno carbonato de sódio, potássio bicarbonato, etc.), hidróxido de metal alcalinos (por exemplo, hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de césio, etc.); por exemplo, sais de base orgânicas, tais como trialquil(inferior) amina (por exemplo, trimetil amina, trietil amina, N-etil diisopropil amina), piridina, quinolina, piperidina, imidazol, picolina, dimetilaminopiridina, dimetilanilina, N-(alquil)inferior-morfolina (por exemplo, N-metil morfolina), 1,5-diazabiciclo[4.3.0]noneno-5 (DBN), 1,8-diazabiciclo[5.4.0]undeceno-7 (DBU), 1,4-diazabiciclo[2.2.2] octano (DABCO); sais de ácidos inorgânicos, tais como cloridrato, bromidrato, iodidrato, sulfato, nitrato, fosfato; sais de ácidos orgânicos, tais como formato, acetato, propionato, oxalato, malonato, succinato, fumarato, maleato, lactato, malato, citrato, tartrato, carbonato, picrato, metanossulfonato, etanossulfonato, p-toluenossulfonato, glutamato.

Além do mais, compostos na forma em que solvato (por exemplo, hidrato, etanolato, etc.) foram adicionados aos compostos de partida e composto alvo apresentado em cada uma das fórmulas de reação estão incluídos em cada uma das fórmulas gerais. Como um solvato preferível, hidrato pode ser mencionado.

Cada um dos compostos alvo obtidos por cada uma das fórmulas gerais pode ser isolado e purificado a partir da mistura de reação, por exemplo, submetendo a mistura de reação à operação de isolamento, tais como filtração, concentração e extração depois do resfriamento para separar um produto de reação bruto depois da operação de purificação convencional, tais como cromatografia em coluna ou recristalização.

O composto representado pela fórmula geral (1) da presente invenção naturalmente engloba isômeros, tais como isômero geométrico, estereoisômero e enanciômero.

O composto da fórmula geral (1) e um sal do mesmo podem ser usados em uma forma comum de preparação farmacêutica. A preparação farmacêutica é preparada usando diluente ou excipiente normalmente usados, tais como carga, agente de extensão, aglutinante, umectante, agente de desintegração, agente tensoativo e lubrificante. Como para esta preparação farmacêutica, várias formas podem ser selecionadas dependendo do propósito do tratamento, e exemplos típicos incluem um comprimido, pílula, pó, solução, suspensão, emulsão, grânulo, cápsula, supositório, e injeção (solução, suspensão).

Para modelar na forma de comprimido, vários materiais convencionalmente bem conhecidos como veículo na técnica podem ser amplamente usados. Como exemplos, excipiente, tais como lactose, sacarose, cloreto de sódio, glicose, uréia, amido, carbonato de cálcio, caolim, celulose cristalina, silicato; aglutinante, tais como água, etanol, propanol, xarope simples, solução de glicose, amido líquido, solução de gelatina, carboximetil celulose, goma-laca, metil celulose, fosfato de potássio, polivinil pirrolidona; agente de desintegração, tais como amido seco, alginato de sódio, agar pó, laminaran pó, hidrogeno carbonato de sódio, carbonato de cálcio, éster do ácido graxo polioxietileno sorbitano, lauril sulfato de sódio, monoglicerídeo de ácido esteárico, amido, lactose; agente de prevenção de desintegração, tais

como sacarose, estearina, manteiga de cacau, óleo hidrogenado; sorbefaciente, tais como base de amônio quaternário, lauril sulfato de sódio; agente umidificante, tais como glicerina, amido; agente absorvente, tais como amido, lactose, caolim, bentonita, sílica coloidal; lubrificante, tais como talco purificado, estearato, borato em pó, polietileno glicol podem ser usados, por exemplo. Além do mais, o comprimido pode ser um comprimido fornecido com revestimento convencional conforme necessário, por exemplo, comprimido revestido com açúcar, comprimido encapsulado com gelatina, comprimido de revestimento entérico, comprimido revestido com filme ou comprimido duplo, comprimido de múltiplas camadas.

Para modelar na forma de pílula, vários materiais convencionalmente bem conhecido como veículo na técnica podem ser amplamente usados. Como exemplos, excipiente, tais como glicose, lactose, amido, manteiga de cacau, óleo vegetal hidrogenado, caolim, talco; aglutinante, tais como goma arábica em pó, tragacanto em pó, gelatina, etanol; agente de desintegração, tais como laminaran, ágar podem ser usados, por exemplo.

Para modelar na forma de supositório, vários materiais convencionalmente bem conhecidos como veículo podem ser amplamente usados. Exemplos destes incluem polietileno glicol, manteiga de cacau, álcool superior, ésteres de álcool superior, gelatina, glicerídeo semi-sintetizado, por exemplo.

Uma cápsula é normalmente preparada de acordo com um método convencional misturando compostos ingrediente ativos com vários veículos exemplificados anteriormente e carregando-os em uma cápsula de gelatina dura, uma cápsula macia ou similares.

Quando preparada como injeção líquida, prefere-se que a solução, emulsão e suspensão sejam esterilizadas e isotônicas para o sangue e para formação nestes modos, qualquer um dos convencionalmente usados na

técnica como diluente podem ser usados, e, por exemplo, água, álcool etílico, macrogol, propileno glicol, álcool isoestearílico etoxilado, álcool isoestearílico polietoxilado, éster do ácido graxo polioxietileno sorbitano, etc. podem ser usados.

A preparação farmacêutica pode conter sal comum, glicose ou glicerina em uma quantidade suficiente para preparar uma solução isotônica neste caso, e solubilizante convencional, tampão, agente de disparo também podem ser adicionados. Pigmento, conservante, aromático, sabor, adoçante e outros produtos farmacêuticos podem estar adicionalmente contidos conforme necessário.

A quantidade de um composto da fórmula geral (1) ou um sal do mesmo contida na preparação farmacêutica da presente invenção não é particularmente limitada, mas normalmente cerca de 1 a 70 % em peso na composição da preparação é adequada e preferivelmente cerca de 1 a 30 % em peso.

Não existe limitação em particular na maneira de administração da preparação farmacêutica da presente invenção e pode ser administrada por um método de acordo com a forma específica da preparação, idade, sexo e o outras condições de um paciente, severidade da doença, etc. Por exemplo, no caso de comprimido, pílula, solução, suspensão, emulsão, grânulo e cápsula, ela é oralmente administrada. No caso de injeção, ela é intravenosamente administrada sozinha ou em uma mistura com fluido de substituição convencional, tais como glicose e aminoácidos, e se necessário, e a preparação sozinha também pode ser administrada intramuscular, intracutânea, subcutânea ou interperitonealmente. Ela é administrada no reto no caso de supositório.

A dose aplicada da preparação farmacêutica da presente invenção é apropriadamente selecionada de acordo com o regime de dosagem, idade, sexo e as outras condições de um paciente, severidade da doença, etc.,

mas é adequado que a quantidade do composto ingrediente ativo seja normalmente cerca de 0,1 a 10 mg por 1 kg de peso corporal por dia. Além do mais, deseja-se que o composto ingrediente ativo esteja contido na preparação de uma forma de unidade de dosagem na faixa de cerca de 1 a 200 mg.

O composto da presente invenção tem efeito agonista parcial do receptor D2, efeito antagonista do receptor 5-HT2A e efeito inibitório da absorção da serotonina (ou efeito inibitório da absorção da serotonina).

O efeito agonista parcial do receptor D2 suprime a neurotransmissão dopaminérgica (DA) quando ele é melhorado e acelera a neurotransmissão DA quando ele é diminuído e assim tem uma função de estabilizar a neurotransmissão DA para um estado normal (estabilizante do sistema de dopamina). De acordo com esta função, excelentes efeitos de melhora clínica nas condições baseadas na neurotransmissão anormal DA (melhora e diminuição), por exemplo, melhor efeito nos sintomas positivos e negativos, melhor efeito na falha cognitiva, melhor efeito no sintoma depressivo, etc. são desenvolvidos sem desenvolver efeitos colaterais (Ver Michio Toru: Seishin-Igaku (Psychiatry), Vol. 46, pp. 855-864 (2004), Tetsuro Kikuchi e Tsuyoshi Hirose: Nou-no-Kagaku (Brain Science), Vol. 25, pp. 579-583 (2003) e Harrison, T.S. e Perry, C.M.: Medicamentos 64: 1715-1736, 2004).

O efeito antagonista do receptor 5-HT2A reduz os efeitos colaterais extrapiramidais, desenvolve efeitos clínicos superiores, e é efetivo na melhora de sintomas negativos, melhora na falha cognitiva, melhora na condição de depressão, melhora da insônia, por exemplo (Ver Jun Ishigooka e Ken Inada: Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology), Vol. 4, pp. 1653-1664 (2001), Mitsukuni Murasaki: Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology), Vol. 1, pp. 5-22 (1998), Puller, I.A. et al., Eur. J. Pharmacol., 407:39-46, 2000, e Meltzer, H.Y. et al, Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry

27: 1159-1172, 2003).

O efeito inibitório da absorção da serotonina (ou efeito inibitório da reabsorção da serotonina) é efetivo para melhorar sintomas depressivos, por exemplo (Ver Mitsukuni Murasaki: Rinsho-Seishin-Yakuri (Japanese Journal of Clinical Psychopharmacology), Vol. 1, pp. 5-22 (1998)).

Os compostos da presente invenção são excelentes em todos estes três efeitos, ou acentuadamente excelentes em um ou dois destes efeitos.

Além do mais, alguns dos compostos da presente invenção têm efeito antagonista do receptor α1 além dos efeitos descritos anteriormente. O efeito antagonista do receptor α1 é efetivo para melhorar sintomas positivos da esquizofrenia (Ver Svensson, T.H.: Prog. Neuro-Psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1145-1158, 2003).

Desta forma, os compostos da presente invenção têm um amplo espectro de tratamento e excelente efeito clínico na esquizofrenia e outros distúrbios do sistema nervoso central.

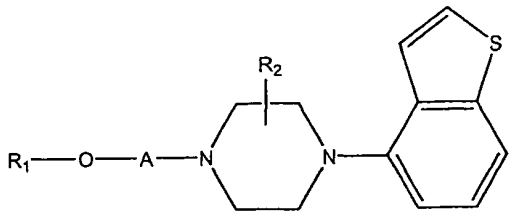
Desta maneira, os compostos da presente invenção são extremamente efetivos para o tratamento ou prevenção de outros distúrbios do sistema nervoso central incluindo o grupo que consiste em esquizofrenia; esquizofrenia refratória, intratável ou crônica; perturbação emocional; distúrbio psicótico; distúrbio de humor; distúrbio bipolar (por exemplo, distúrbio bipolar tipo I e distúrbio bipolar tipo II); depressão; depressão endógena; depressão maior; depressão de melancolia e refratória; distúrbio distímico; distúrbio ciclotímico; distúrbio de ansiedade (por exemplo, ataque de pânico, distúrbio de pânico, agorafobia, fobia social, distúrbio obsessivo-compulsivo, distúrbio de estresse pós traumático, distúrbio de ansiedade generalizada, distúrbio de estresse agudo, etc.); distúrbio somatoforme (por exemplo, histeria, distúrbio de somatização, distúrbio de conversão, distúrbio de dor, hipocondríase, etc.); distúrbio factioso; distúrbio dissociativo; distúrbio sexual (por exemplo, disfunção sexual, distúrbio de desejo sexual,

distúrbio de excitação sexual, disfunção erétil, etc.); distúrbio alimentar (por exemplo, anorexia nervosa, bulimia nervosa, etc.); distúrbio do sono; distúrbio do ajuste; distúrbio relacionada à substância (por exemplo, abuso de álcool, intoxicação por álcool, abstinência de medicamento, intoxicação por estimulante, narcotismo, etc.); anhedonia (por exemplo, anhedonia iatrogênica, anhedonia de uma causa psíquica ou mental, anhedonia associada a depressão, anhedonia associada a esquizofrenia, etc.); delírio; falha cognitiva; falha cognitiva associada o mal de Alzheimer, mal de Parkinson, e outras distúrbios neurodegenerativos; falha cognitiva causada pelo mal de Alzheimer, mal de Parkinson e doenças neurodegenerativas associadas; falha cognitiva de esquizofrenia; falha cognitiva causada por esquizofrenia refratória, intratável ou crônica; vômito; doença do movimento; obesidade; enxaqueca; dor (cabeça); retardo mental; distúrbio de autismo (autismo); distúrbio de Tourette; distúrbio de cacoete; distúrbio de déficit de atenção/hiperatividade; distúrbio de conduta; e síndrome de Down.

Além do mais, os compostos da presente invenção têm pouco ou nenhum efeito colateral e eles são excelentes em segurança e tolerabilidade.

Um exemplo preferível de um composto desejado (1) é como se segue:

[Fórmula 1]




(1)

onde $R^2$ representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila inferior;

A representa um grupo alquileno inferior ou grupo alquenileno inferior (preferivelmente um grupo alquileno inferior); e

$R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (IV) a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ (mais preferivelmente um grupo cicloexila);

(II) um grupo aromático selecionado de um grupo fenila, grupo naftila, grupo diidroindenila e grupo tetraidronaftila (mais preferivelmente um grupo fenila);

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, átomo de oxigênio e átomo de enxofre e selecionado do grupo que consiste em um grupo pirrolidinila, grupo imidazolidinila, grupo piperidila, grupo hexaidro pirimidinila, piperazinila, grupo azepanila, grupo azocanila, grupo pirrolila, grupo diidropirrolila, grupo imidazolila, grupo diidroimidazolila, grupo triazolila, grupo diidrotriazolila, grupo pirazolila, piridila, grupo diidropiridila, grupo pirimidinila, grupo diidropirimidinila, grupo pirazinila, grupo diidropirazinila, grupo piridazinila, grupo tetrazolila, grupo oxazolila, grupo isoxazolila, grupo oxadiazolila, grupo oxazolidinila, grupo isoxazolidinila, grupo morfolinila, grupo tiazolila, grupo diidrotiazolila, grupo isotiazolila, grupo tiadiazolila, diidrotiazinila, grupo tiazolidinila, grupo tetraidrofurila, grupo tetraidropiranila, grupo piranila, grupo tetraidrotiofurila, grupo tetraidrotio piranila, grupo tienila e grupo tiopiranila (mais preferivelmente, um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, um átomo de oxigênio e um átomo de enxofre e selecionado do grupo que consiste em um grupo pirrolidinila, um grupo piperidila, um grupo pirazolila, um grupo piridila, um grupo pirimidinila, um grupo pirazinila, um grupo isoxazolila, um grupo tiazolila, um grupo piranila e um grupo tienila; e mais preferivelmente, um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico

tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado do grupo que consiste em um grupo pirrolidinila, um grupo piperidila, um grupo pirazolila, um grupo piridila, um grupo pirimidinila e um grupo tiazolila; e

(IV) um grupo heterocíclico fundido a benzeno que tem 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, átomo de oxigênio e átomo de enxofre e que é selecionado do grupo que consiste em (1) um grupo tetraidroquinoxalinila, (2) um grupo tetraidroquinazolinila, (3) um grupo diidroquinazolinila, (4) um grupo indolinila, (5) um grupo indolila, (6) um grupo isoindolinila, (7) um grupo benzimidazolila, (8) um grupo diidrobenzimidazolila, (9) um grupo tetraidrobenzazepinila, (10) um grupo tetraidrobenzodiazepinila, (11) um grupo hexaidrobenzazocinila, (12) um grupo diidrobenzoxazinila, (13) um grupo diidrobenzoxazolila, (14) um grupo benzisoxazolila, (15) um grupo benzoxadiazolila, (16) um grupo tetraidrobenzoxazepinila, (17) um grupo diidrobenzotiazinila, (18) um grupo benzotiazolila, (19) um grupo benzoxatiolila, (20) um grupo cromenila, (21) um grupo diidrobenzofurila, (22) um grupo carbazolila, (23) um grupo dibenzofurila e (24) um grupo quinoxalinila

em que, no grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, o grupo aromático e o grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 (mais preferivelmente 1 a 3) grupos selecionados do grupo que consiste nos grupo (1) a (66) a seguir pode estar presente como um substituinte:

(1) um grupo alquila inferior,

(2) um grupo alquenila inferior,

(3) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(5) um grupo fenóxi,

(6) um grupo alquiltio inferior,

(7) um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio,

(8) um grupo hidróxi,

(9) um grupo fenil alcóxi inferior,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(11) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(12) um átomo de halogênio,

(13) um grupo ciano,

(14) um grupo fenila arila,

(15) um grupo nitro,

(16) um grupo amino,

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alquil inferior carbamoíla, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonil inferior amino alcanoíla inferior como um substituinte(s) (mais preferivelmente um grupo N-alquil inferior amino, grupo N,N-dialquil inferior amino, grupo N- alcanoil inferior amino, N-alcóxi carbonila inferior grupo amino, grupo N-alquil inferior sulfonilamino, grupo N-alquil inferior-N- alcanoil inferior amino, grupo N-alquil inferior-N-alcóxi carbonil inferior amino, grupo N-[carbamoil] amino, grupo N-[N-alquil inferior carbamoil] amino, grupo N-[N,N-dialquil inferiorcarbamoil] amino, grupo N-[amino alcanoil inferior]amino, grupo N-[N- alcanoil inferior amino] alcanoil inferior]amino, ou grupo N-[[N-alcóxi carbonil inferior amino] grupo alcanoil inferior ] amino),

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(19) um grupo fenil sulfonila que pode ter um grupo alquila inferior no grupo fenila (mais preferivelmente um grupo alquil inferior fenil sulfonila),

(20) um grupo carbóxi,

(21) um grupo alcoxicarbonila inferior,

(22) um grupo carbóxi alquila inferior,

(23) um grupo alcoxicarbonila inferior alquila inferior,

(24) um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(25) um grupo carbóxi alquenila inferior,

(26) um grupo alcoxicarbonila inferior alquenila inferior,

(27) um grupo carbamoil alquenila inferior que pode ter como um substituinte(s) 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por 1 a 3 átomos de halogênio (mais preferivelmente um grupo carbamoil alquenila inferior, um grupo N- alquil inferior carbamoil alquenila inferior, um grupo N,N-dialquil inferior carbamoil alquenila inferior ou um grupo N-[alquil inferior substituído por 1 a 3 átomos de halogênio] carbamoil alquenila inferior),

(28) um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste nos grupo (i) a (lxxviii) a seguir como um substituinte(s):

(i) um grupo alquila inferior,

(ii) um grupo alcóxi inferior,

(iii) um grupo hidróxi alquila inferior,

(iv) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(v) um grupo fenilóxi alquila inferior,

(vi) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(vii) um grupo amino alquila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo benzoíla e um grupo carbamoíla (mais preferivelmente um grupo N,N-dialquil inferior amino alquila inferior, um grupo N- alcanoil inferior amino alquila inferior, um grupo N-alquil inferior-N- alcanoil inferior amino alquila inferior, um grupo N-alquil inferior-N-benzoil amino alquila inferior, ou um grupo N-carbamoil amino alquila

inferior)

(viii) um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ que pode ter 1 a 3 grupos (preferivelmente 1 a 2 grupos, e mais preferivelmente 1 grupo) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo fenil alcóxi inferior como um substituinte,

(ix) um grupo alquila inferior substituído por cicloalquila $C_3$-$C_8$,

(x) um grupo alquenila inferior,

(xi) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos (preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo fenila que pode ter um único grupo alquila inferior e um grupo fenila que pode ter um único grupo alcóxi inferior como um substituinte(s) (mais preferivelmente um grupo carbamoil alquila inferior, um grupo dicarbamoil alquila inferior, um grupo N- alquil inferior carbamoil alquila inferior, um grupo N,N-dialquil inferior carbamoil alquila inferior, um grupo N-[alquil inferior fenil] carbamoil alquila inferior, ou um grupo N-[alcóxi inferior fenil] carbamoil alquila inferior),

(xii) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos alcoxicarbonila inferiores,

(xiii) um grupo furil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo furila),

(xiv) um grupo tetraidrofuril alquila inferior,

(xv) um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior,

(xvi) um grupo tetraidropiranil alquila inferior,

(xvii) um grupo pirrolil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirrolila),

(xviii) um grupo diidropirazolil alquila inferior que pode ter um único grupo oxo,

(xix) um grupo pirazolil alquila inferior (que pode ter 1 a 3

grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirazolila),

(xx) um grupo imidazolil alquila inferior,

(xxi) um grupo piridil alquila inferior,

(xxii) um grupo pirazinil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior como um substituinte no grupo pirazinila),

(xxiii) um grupo pirrolidinil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirrolidinila),

(xxiv) um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos (preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo benzoíla e um grupo alcanoíla inferior como um substituinte(s) no grupo piperidinila),

(xxv) um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo piperazinila),

(xxvi) um grupo morfolinil alquila inferior,

(xxvii) um grupo tienil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupo alquila inferior como um substituinte(s) no grupo tienila),

(xxviii) um grupo tiazolil alquila inferior,

(xxix) um grupo diidrobenzofuril alquila inferior,

(xxx) um grupo benzopiranil alquila inferior (que pode ter um único grupo oxo como um substituinte no grupo benzopiranila),

(xxxi) um grupo benzimidazolil alquila inferior,

(xxxii) um grupo indolil alquila inferior que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior),

(xxxiii) um grupo imidazolil alquila inferior que tem 1 a 3 substituintes (preferivelmente 1 substituinte) selecionados do grupo que

consiste em um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior,

(xxxiv) um grupo piridila que pode ter 1 a 3 grupos (preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquiltio inferior alquila inferior como um substituinte(s),

(xxxv) um grupo pirrolidinila que pode ter 1 a 3 grupos (preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla como um substituinte,

(xxxvi) um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 grupos (preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla que pode ter 1 a 3 grupos (preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um átomo de halogênio no grupo fenila,

(xxxvii) um grupo tetraidrofurila que pode ter um único grupo oxo,

(xxxviii) um grupo hexaidroazepinila que pode ter um único grupo oxo,

(xxxix) um grupo pirazolila que pode ter 1 a 3 grupos (preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo fenila e um grupo furila como um substituinte,

(xl) um grupo tiazolila,

(xli) um grupo tiadiazolila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior,

(xlii) um grupo isoxazolila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos alquila inferior,

(xliii) um grupo indazolila,

(xliv) um grupo indolila,

(xlv) um grupo tetraidrobenzotiazolila,

(xlvi) um grupo tetraidroquinolila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um átomo de halogênio e um grupo oxo como um substituinte,

(xlvii) um grupo quinolila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior,

(xlviii) um grupo benzodioxolil alquila inferior,

(xlix) um grupo fenila ou grupo naftila que pode ter 1 a 3 grupos como um substituinte(s), selecionado do grupo que consiste em

um átomo de halogênio; um grupo alquila inferior; um grupo alcóxi inferior; um grupo alquila inferior substituído por halogênio; um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio; um grupo alquenila inferior; um grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo alquila inferior e um grupo arila; um grupo sulfamoíla; um grupo alquiltio inferior; um grupo alcanoíla inferior; um grupo alcoxicarbonila inferior; um grupo pirrolila; um grupo alquinila inferior; um grupo ciano; um grupo nitro; um grupo fenilóxi; um grupo fenil alcóxi inferior; um grupo hidróxi; um grupo hidróxi alquila inferior; um grupo carbamoíla que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo fenila; um grupo pirazolila; um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo; um grupo oxazolila; um grupo imidazolila que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1 a 2) grupos alquila inferior; um grupo diidrofurila que pode ter um único grupo oxo; um grupo tiazolidinil alquila inferior que pode ter dois grupos oxo; um grupo imidazolil alcanoíla inferior e um grupo piperidinil carbonila,

(l) um grupo ciano alquila inferior,

(li) um grupo diidroquinolila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1 a 2) grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo oxo,

(lii) um grupo alquil inferior amino substituído por halogênio,

(liii) um grupo alquiltio inferior alquila inferior,

(liv) um grupo amidino que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior,

(lv) um grupo amidino alquila inferior,

(lvi) um grupo alquenil inferioróxi alquila inferior,

(lvii) um grupo fenilamino que pode ter 1 a 3 substituintes (mais preferivelmente 1 substituinte) selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio no grupo fenila,

(lviii) um grupo fenil alquenila inferior,

(lix) um grupo piridilamino que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1 a 2) grupos alquila inferior (mais preferivelmente grupo N-alquil inferior-N-[alquil inferior piridil] amino),

(lx) um grupo fenil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 a 2 grupos) selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior, um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior como um substituinte no grupo fenila e/ou o grupo alquila inferior),

(lxi) um grupo alquinila inferior,

(lxii) um grupo fenilóxi alquila inferior (que pode ter como um substituinte(s) no grupo fenila 1 a 3 grupos (preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior, um grupo N-alcóxi inferior-N-alquil inferior carbamoíla e um grupo oxo pirrolidinila),

(lxiii) um grupo isoxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(lxiv) um grupo diidroindenila,

(lxv) um grupo fenil alcóxi inferior alquila inferior,

(lxvi) um grupo tetraidropiranila,

(lxvii) um grupo azetidinila que pode ter 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla,

(lxviii) um grupo azetidinil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla,

(lxix) um grupo tetrazolila,

(lxx) um grupo indolinila que pode ter um único grupo oxo,

(lxxi) um grupo triazolila que pode ter 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 a 2 grupos) selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquiltio inferior,

(lxxii) um grupo imidazolila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupos carbamoíla,

(lxxiii) um grupo oxazolila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupos alquila inferior,

(lxxiv) um grupo isotiazolila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupos alquila inferior,

(lxxv) um grupo benzimidazolila,

(lxxvi) um grupo diidrobenzotiazolila que pode ter um único grupo oxo,

(lxxvii) um grupo tienila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupos alcoxicarbonila inferiores, e

(lxxviii) um grupo oxazolil alquila inferior que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1 a 2) grupos alquila inferior

(29) um grupo amino alquila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo fenila, um grupo fenil alquila inferior, um grupo benzoíla e um grupo alquila substituído por amino (que pode ter 1 a 2 (mais preferivelmente 2) grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo amino) no grupo amino,

(30) um grupo alquila inferior substituído por um único grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(31) um grupo tiocarbamoíla que pode ter 1 a 2 (mais preferivelmente 1) grupos alquila inferior,

(32) um grupo sulfamoíla,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um único grupo oxo (mais preferivelmente um grupo oxazolidinila substituído por um único grupo oxo),

(34) um grupo imidazolidinila que pode ter 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(36) um grupo imidazolila,

(37) um grupo triazolila,

(38) um grupo isoxazolila,

(39) um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1 a 2, e ainda mais preferivelmente 1) substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquil inferior fenil sulfonila, um grupo oxo, um grupo hidróxi, e grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo

que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior (mais preferivelmente um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1 a 2, e ainda mais preferivelmente 1) substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquil inferior fenil sulfonila, um grupo oxo, um grupo hidróxi, um grupo amino, um grupo N-alquil inferior amino, um grupo N,N-dialquil inferior amino, um grupo N- alcanoil inferior amino, um N-alquil inferior-N-alcóxi carbonila inferior grupo amino, um grupo N-alquil inferior- N- alcanoil inferior amino, e um grupo N- alcanoíla inferior amino alcanoil inferior amino),

(40) um grupo piperidil carbonila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1 a 2) substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo carbóxi alquila inferior, um grupo alquil inferior carbamoil alquila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alcóxi inferior, um grupo carbóxi, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino (em que 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo benzoíla podem estar presentes), um grupo piperidila (em que 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo benzoíla podem estar presentes), um grupo piperazinila (em que 1 a 3 (mais preferivelmente 1 a 2) grupos alquila inferior podem estar presentes como um substituinte), um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decila, um grupo morfolinila, um grupo hexaidro-1,4-diazepinila (em que um único grupo alquila inferior pode estar presente como um substituinte), grupo piridila, grupo piridilóxi, grupo piridil alcóxi inferior, grupo tetraidroquinolila (em que um único grupo oxo pode estar presente),

grupo benzodioxolila, grupo fenil alcóxi inferior (que pode ter 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 a 2 grupos) selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio no grupo fenila), grupo fenila (em que 1 a 3 grupos (preferivelmente 1 a 2 grupos) selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alcóxi inferior e um grupo hidróxi pode estar presente), um grupo fenilóxi (que pode ter no grupo fenila 1 a 3 grupos (preferivelmente 1 a 2 grupos) selecionados do grupo que consiste em um grupo ciano, um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio), um grupo fenil alquila inferior (que pode ter no grupo fenila 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 a 2 grupos) selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio), e um grupo benzoíla (que pode ter no grupo fenila 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 a 2 grupos) selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alcóxi inferior),

(41) um grupo pirrolidinil carbonila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupos como um substituinte, selecionados do grupo que consiste em um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo hidróxi, um grupo amino (que pode ter no grupo amino 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla), grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior, um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter um único grupo alquila inferior como um substituinte no grupo piperazinila), um grupo amino alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte no grupo amino), grupo fenilóxi (que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupo alcóxi inferior substituído por halogênios no grupo fenila), um grupo

fenilóxi alquila inferior (que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupo alcóxi inferior substituído por halogênios no grupo fenila) e um grupo tetraidroquinolila (em que um grupo oxo pode estar presente),

(42) um grupo piperazinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 a 2 grupos), como um substituinte, selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, um grupo alcanoíla inferior, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte no grupo amino), grupo piperidil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 (mais preferivelmente 1) grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo piperidinila), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior, um grupo tetraidrofuril alquila inferior, um grupo piridil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 (mais preferivelmente 1) grupos fenila como um substituinte(s) no grupo alquila inferior), um grupo imidazolil alquila inferior, um grupo furil alquila inferior, um grupo pirrolidinil carbonil alquila inferior, um grupo piperidila que pode ter 1 a 2 (mais preferivelmente 1) grupos alquila inferior como um substituinte(s), um grupo piridila (que pode ter no grupo piridila 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo ciano e um grupo alquila inferior substituído por halogênio como um substituinte), um grupo tieno[2,3-b] piridila, um grupo fenila (em que 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alquila inferior pode estar presente), um grupo benzoíla, um furil carbonila, um grupo fenil alcoxicarbonila inferior e um grupo oxo,

(43) um grupo hexaidroazepinil carbonila,

(44) um grupo hexaidro-1,4-diazepinil carbonila que pode ter 1 a 3 substituintes (mais preferivelmente 1 substituinte) selecionados do grupo

que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo piridila,

(45) um grupo diidropirrolil carbonila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1 a 2) grupos alquila inferior,

(46) um grupo tiomorfolinil carbonila,

(47) um grupo morfolinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior e um grupo fenila,

(48) um grupo tiazolidinil carbonila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupos fenila que pode ter 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 grupo) selecionados do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo ciano,

(49) um grupo azabiciclo[3.2.2]nonil carbonila,

(50) um grupo 8-azabiciclo[3.2.1]octil carbonila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupos fenilóxi substituídos ou não substituídos por halogênio,

(51) um grupo indolinil carbonila,

(52) um grupo tetraidroquinolil carbonila,

(53) um grupo tetraidropirido[3.4-b]indolil carbonila,

(54) um grupo morfolinil alquila inferior,

(55) um grupo piperazinil alquila inferior que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupos alquila inferior no grupo piperazinila,

(56) um grupo morfolinil carbonil alquila inferior,

(57) um grupo piperazinil carbonil alquila inferior que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupos alquila inferior no grupo piperazinila,

(58) um grupo oxo,

(59) um grupo amino alcóxi inferior (que pode ter 1 a 2 (mais preferivelmente 2) grupos alquila inferior no grupo amino),

(60) um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior,

(61) um grupo piperazinila que pode ter 1 a 3 grupos (mais

preferivelmente 1 a 2 grupos) selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior (mais preferivelmente, um grupo piperazinila substituído por um único grupo oxo, um grupo piperazinila substituído por um único grupo alquila inferior, um grupo piperazinila substituído por um único grupo alcanoíla inferior, um grupo piperazinila substituído por um único grupo oxo e um único grupo alcanoíla inferior, e um grupo piperazinila substituído por um único grupo oxo e um único grupo alcóxi inferior carbonila),

(62) um grupo morfolinila,

(63) um grupo 1,3,8-triazaspiro[4.5]decanil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos (mais preferivelmente 1 a 2 grupos) selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo fenila,

(64) um grupo tetraidropiridil carbonila que pode ter 1 a 3 (mais preferivelmente 1) grupos piridila,

(65) um grupo imidazolidinil carbonila que pode ter um grupo tioxo, e

(66) um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4.5]decanila.

Na fórmula geral (1), $R^1$ é preferivelmente um grupo cicloexila, grupo fenila, grupo pirrolidinila, grupo piperidila, grupo pirazolila, grupo piridila, grupo pirimidinila, ou grupo tiazolila. O anel de cada um dos grupos é preferivelmente substituído por 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em:

(1) um grupo alquila inferior,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcóxi inferior carbonila, um grupo alquilsulfonila inferior, um

grupo carbamoíla, um grupo alquil inferior carbamoíla, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonil inferior amino alcanoíla inferior como um substituinte(s),

(21) um grupo alcoxicarbonila inferior,

(28) um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste nos grupo (i), (ii), (iv), (xii) e (xxi) a seguir:

(i) um grupo alquila inferior,

(ii) um grupo alcóxi inferior,

(iv) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(xii) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos alquil inferior carbonila,

(xxi) um grupo piridil alquila inferior,

(29) um grupo amino alquila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo fenila, um grupo fenil alquila inferior, um grupo benzoíla e um grupo alquila substituído por amino (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo amino) no grupo amino,

(30) um grupo alquila inferior substituído por um único grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(34) um grupo imidazolidinila que pode ter 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(36) um grupo imidazolila,

(39) um grupo piperidila que pode ter um único substituinte selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquil inferior fenil sulfonila, um grupo oxo, um grupo hidróxi, um grupo amino, um grupo N-alquil inferior amino, um grupo N-N di-alquil inferior amino, um grupo N- alcanoil inferior amino, um grupo N-alquil inferior-N-alcóxi carbonila inferior amino, um grupo N-alquil inferior- N- alcanoil inferior amino, e um grupo N- alcanoíla inferior amino alcanoil inferior amino,

(61) um grupo piperazinila que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcóxi inferior carbonila, e

(62) um grupo morfolinila.

EXEMPLO

Daqui em diante, a presente invenção se tornará ainda mais clara com referência aos exemplos de referência, exemplos e exemplos experimentais farmacológicos e exemplos de preparação.

Exemplo referência 1

Síntese de cloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina

Uma mistura que consiste em 14,4 g de 4-bromobenzo[b]tiofeno, 29,8 g de anidreto de piperazina, 9,3 g de t-butóxido de sódio, 0,65 g de (R)-(+)-2,2'-bis(difenil fosfina)-1,1'-binaftila (BINAP), 0,63 g de tris (dibenzilindenoacetona) dipaládio (0) e 250 mL de tolueno foi refluxada com aquecimento por uma hora em uma atmosfera de nitrogênio. Água foi vertida na solução de reação, que foi então extraída com acetato de etila, lavada com água e seca sobre sulfato de magnésio. O solvente foi evaporado em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: metanol: 25 % amônia

aquosa = 100:10:1), para obter 9,5 g de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina na forma de óleo amarelo.

Então, 3,7 mL de ácido clorídrico concentrado foram adicionados a uma solução de metanol de 9,5 g de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina, e o solvente foi evaporado em baixa pressão. Acetato de etila foi adicionado ao resíduo obtido e cristais precipitados foram obtidos por filtração. Recristalização foi realizada a partir de metanol para obter 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina cloridrato de na forma de cristais tipo agulha incolores.

Ponto de fusão 276-280 °C

RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δ ppm: 3,25-3,35 (8H, m), 6,94 (1H, d, J=7,6Hz), 7,30 (1H, dd, J=7,8Hz, J=7,8Hz), 7,51 (1H, d, J=5.5Hz), 7,68 (1H, d, J=8,1Hz), 7,73 (1H, d, J=5.5Hz), 9,35 (2H, brs).

Exemplo referência 2

Síntese de 4-benzo[b]tiofen-4-il-3-metil piperazin-1-carboxilato de terc-butila

O composto título foi obtido usando 3-metil piperazin-1-carboxilato de terc-butila e 4-bromobenzo[b]tiofeno da mesma maneira que no exemplo referência 1.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,85-1,95 (3H, m, 1,50 (9H, s, 2,8-2,9 (1H, m), 3,15-3,35 (2H, m), 3,4-3,5 (1H, m), 3,5-3,65 (1H, m), 3,65-3,7 (1H, m), 3,7-3,9 (1H, m), 6,98 (1H, d, J = 7,5Hz), 7,29 (1H, dd, J = 8Hz, J=8Hz), 7,38 (1H, d, J = 5.5Hz), 7,61 (1H, d, J = 8Hz).

Exemplo referência 3

Síntese de Dicloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-2-metil piperazina

Ácido trifluoracético (6 mL) foi adicionado a uma solução de 1,22 g (3,7 mmol) de 4-benzo[b]tiofen-4-il-3-metil piperazin-1-carboxilato de terc-butila em uma solução de diclorometano (12 mL) e a mistura foi agitada

em temperatura ambiente por uma hora. A mistura de reação foi concentrada em baixa pressão, e uma solução de carbonato de potássio aquosa 5 % foi adicionada ao resíduo e a mistura resultante foi extraída com diclorometano. A solução de extração com diclorometano foi seca sobre sulfato de magnésio e daí em diante concentrada em baixa pressão. Ao resíduo obtido, ácido clorídrico concentrado (0,6 mL) e metanol (10 mL) foram adicionados e a mistura resultante foi concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi submetido a recristalização a partir de acetonitrila para obter Dicloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-2-metil piperazina (0,98 g) na forma de um pó marrom claro.

RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 0,92 (3H, d, J = 6,5Hz), 2,8-3,6 (6H, m), 3,6-4,0 (1H, m), 5,3-6,8 (1H, m), 7,20 (1H, br), 7,38 (1H, dd, J = 8Hz, J=8Hz), 7,5-8,0 (3H, m), 9,4-10,1 (2H, m).

Exemplo referência 4

Síntese de Dicloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-3-metil piperazina

O composto título foi obtido usando 2-metil piperazina e 4-bromobenzo[b]tiofeno da mesma maneira que no exemplo referência 1,

RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,34 (3H, d, J = 6,5Hz), 2,85-2,95 (1H, m), 3,05-3,15 (1H, m), 3,2-3,6 (6H, m), 6,97 (1H, d, J = 7,5Hz), 7,31 (1H, dd, J = 8Hz, J = 8Hz), 7,54 (1H, d, J = 5,5Hz), 7,69 (1H, d, J = 8Hz), 7,75 (1H, d, J = 5,5Hz), 9,2-9,3 (1H, m), 9,64 (1H, br).

Exemplo referência 5

Síntese de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propionato de etila

5,05 g (19,8 mmol) de cloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina foram adicionados a uma solução aquosa de hidróxido de sódio, e a mistura foi extraída com diclorometano. A solução de extração foi seca sobre sulfato de magnésio e concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido

foi dissolvido em 50 mL de etanol e acrilato de etila (2,44 mL, 21,8 mmol) foi adicionado a este, e então a mistura de reação foi refluxada com aquecimento for 4 horas. A solução de reação foi resfriada para temperatura ambiente e concentrada em baixa pressão. Éter diisopropílico foi adicionado ao resíduo e material insolúvel precipitado foi obtido por filtração, lavado com éter diisopropílico, e seco para obter 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propionato de etila (5,26 g) na forma de um pó branco.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,28 (3H, t, J=7,0Hz), 2,50-2,63 (2H, m), 2,67-2,87 (6H, m), 3,11-3,24 (4H, m), 4,17 (2H, q, J=7,0Hz), 6,89 (1H, d, J=7,8Hz), 7,27 (1H, t, J=7,8Hz), 7,37-7,42 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=7,8Hz).

Exemplo referência 6

Síntese de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propan-1-ol

Hidreto de alumínio e lítio (1,18 g, 24,8 mmol) foi adicionado a uma solução de 5,26 g (16,5 mmol) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propionato de etila em uma solução de tetraidrofurano (THF) (55 mL) mediante resfriamento em gelo, e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 4 horas. À solução de reação, água (1,2 mL), solução de hidróxido de sódio aquosa 15 % (1,2 mL), e água (3,6 mL) foram adicionados nesta ordem e a mistura foi agitada em temperatura ambiente. Material insolúvel foi removido por filtração, e o filtrado foi concentrado em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 3:2 → acetato de etila) e concentrado até secura em baixa pressão para obter 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propan-1-ol (0,23 g) na forma de um pó branco.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,75-1,85 (2H, m), 2,74 (2H, t, J=5,8 Hz), 2,75-2,85 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3,85 (2H, t, J=5,3 Hz), 5,19 (1H, brs), 6,88 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,27 (1H, dd, J=7,9 Hz, J=7,8 Hz), 7,39 (2H, s), 7,56 (1H, d, J=8,0 Hz).

Exemplo referência 7

Síntese de acetato de 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butila

1,0 g (3,9 mmol) de cloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina foi suspenso em 20 mL de dimetil formamida (DMF), e carbonato de potássio (1,3 g, 9,4 mmol) e acetato de 4-bromobutila (0,7 mL, 4,8 mmol) foram adicionados a ele. A mistura de reação foi agitada a 80 °C por 6 horas, resfriada para temperatura ambiente, e água foi adicionada a ela, e extraída com acetato de etila. A fase orgânica foi lavada com água, seca sobre sódio sulfato, e concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: metanol = 30:1), e concentrado até secura em baixa pressão para obter acetato de 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butila (0,72 g) na forma de um óleo amarelo claro.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,60-1,73 (4H, m), 2,07 (3H, s), 2,47 (2H, t, J=7,2Hz), 2,60-2,72 (4H, m), 3,17-3,22 (4H, m), 4,11 (2H, t, J=6,3Hz), 6,90 (1H, d, J=7,6Hz), 7,27 (1H, dd, J=7,6Hz, J=8,0Hz), 7,37-7,42 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0Hz).

Exemplo referência 8

Síntese de 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butan-1-ol

Carbonato de potássio (3,87 g, 28 mmol) foi adicionado a uma solução de 7,76 g (23,3 mmol) de acetato de 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butila em solução de metanol 90 % (150 mL). A mistura de solução foi agitada em temperatura ambiente por 2 horas. Água foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com diclorometano. A solução de extração foi seca sobre sódio sulfato e concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 2:1 → 1:1), e concentrado em baixa pressão para obter 4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butan-1-ol (6,65 g) na forma de um óleo incolor.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,60-1,74 (4H, m), 2,50-2,55 (2H, m), 2,70-2,80 (4H, m), 3,20-3,30 (4H, m), 3,60-3,63 (2H, m), 6,2 (1H, brs), 6,90 (1H, d, J=7,6Hz), 7,27 (1H, dd, J=7,6Hz, J=8,0Hz), 7,39 (1H, s), 7,56 (1H, d, J=8,0Hz).

Exemplo referência 9

Síntese de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-(3-cloropropil)piperazina

3,56 g (12,9 mmol) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propan-1-ol foram suspensos em 30 mL de diclorometano, e tetracloreto de carbono (30 mL) e trifenil fosfina (4,06 g, 15,5 mmol) foram adicionados a ele. A mistura foi refluxada com aquecimento por 3 horas. A solução de reação foi resfriada para temperatura ambiente, então metanol e diclorometano foram adicionados a ela para homogeneizar a mistura. Sílica gel (30 g) foi adicionada à solução, e o solvente foi evaporado em baixa pressão. O resíduo obtido foi carregado em coluna de sílica gel (300 g) e extraído com uma mistura de solvente de n-hexano: acetato de etila = 2:1. A solução de extração foi concentrada em baixa pressão para obter 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-(3-cloropropil)piperazina (2,36 g) na forma de um óleo incolor.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,60 (2H, t, J=7,2 Hz), 2,65-2,75 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3,65 (2H, t, J=6,6 Hz), 6,89 (1H, dd, J=7,6 Hz, J=0,7 Hz), 7,27 (1H, dd, J=7,9 Hz, J=7,8 Hz), 7,38 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,41 (1H, d, J=5,7 Hz), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz).

Exemplo referência 10

Síntese de 4-hidroxitiofeno-2-carboxilato de metila

Cloreto de tionila (1,6 mL) foi adicionado gota-a-gota a uma solução de metanol (20 mL) de ácido 4-hidroxitiofeno-2-carboxílico (1,1 g, 7,6 mmol) mediante resfriamento em gelo. A mistura de solução foi refluxada com aquecimento por 5 horas. A solução de reação foi resfriada para temperatura ambiente, vertida em água gelada e extraída com acetato de etila.

A solução de extração com acetato de etila foi seca sobre sulfato de magnésio e concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 4:1) e concentrado/seco em baixa pressão para obter 4-hidroxitiofeno-2-carboxilato de metila (0,7 g) na forma de um pó branco.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 3,90 (3H, s), 5,50-6,60 (1H, br), 6,64 (1H, d, J=1,9 Hz), 7,43 (1H, d, J=1,8 Hz).

Exemplo referência 11

Síntese de 6-hidroxipirimidina-4-carboxilato de etila

O composto título foi obtido usando ácido 6-hidroxipirimidina-4-carboxílico da mesma maneira que no exemplo referência 10,

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,29 (3H, t, J=7,0Hz), 4,29 (2H, q, J=7,0Hz), 6,87 (1H, d, J=1,0Hz), 8,27 (1H, d, J=1,0Hz), 10,54 (1H, br).

Exemplo referência 12

Síntese de 5-hidróxi-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metila

Uma solução de éter dietílico (35 mL) de acetileno dicarboxilato de dimetila (5,0 g, 35 mmol) foi resfriada com um meio de congelamento (sal & gelo). A esta solução, uma solução de éter dietílico (15 mL) de metil hidrazina (0,63 mL, 35 mmol) foi adicionado gota-a-gota mantendo ao mesmo tempo a temperatura em 0 °C ou menos. Depois de completa a adição gota-a-gota, a solução foi agitada a 0 °C por uma hora. O material insolúvel precipitado foi obtido por filtração e lavado com éter dietílico. A torta do filtro foi aquecida para 130 °C por 30 minutos e resfriada para temperatura ambiente. Metanol foi adicionado à torta, que foi concentrada em baixa pressão. Acetato de etila foi adicionado ao resíduo obtido e o resíduo foi concentrado em baixa pressão. Acetato de etila foi adicionado ao resíduo e o material insolúvel precipitado foi obtido por

filtração, lavado com acetato de etila, e seco para obter 5-hidróxi-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metila (3,26 g) na forma de um pó amarelo claro.

RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 3,58 (3H, s), 3,73 (3H, s), 5,77 (1H, s), 11,41 (1H, br).

Exemplo referência 13

Síntese de 6-cloro-N-(2,2,2-trifluoretil)nicotinamida

Trietil amina (1,03 mL, 7,4 mmol) e cloroformiato de isobutila (0,76 mL, 5,5 mmol) foram adicionados a uma solução de acetonitrila (12 mL) de ácido 6-cloronicotínico (0,58 g, 3,6 mmol) mediante resfriamento em gelo e a mistura foi agitada a 0 °C por 30 minutos. À mistura de solução, 2,2,2-trifluoretil amina (0,88 mL, 11,2 mmol) foi adicionado e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 10 minutos. Água foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com acetato de etila. A solução de extração com acetato de etila foi seca sobre sulfato de magnésio, e concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 5:1 → 1:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e éter diisopropílico e n-hexano foram adicionados. O material insolúvel precipitado foi obtido por filtração e seco para obter 6-cloro-N-(2,2,2-trifluoretil)nicotinamida (0,58 g) na forma de um pó amarelo claro.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 4,15 (2H, dq, J=6,5Hz, 9,0Hz), 6,35 (1H, br), 7,46 (1H, dd, J=0,7Hz, J=8,5Hz), 8,11 (1H, dd, J=2,5Hz, J=8,5Hz), 8,77 (1H, dd, J=0,7Hz, J=2,5Hz).

Exemplo referência 14

Síntese de N-(2,2,2-trifluoretil)-4-cloropiridina-2-carboxamida

1-hidroxibenzotriazol (0,53 g, 3,5 mmol), cloridrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etil carbodiimida (WSC) (0,67 g, 3,5 mmol) e 2,2,2-trifluoretil amina (0,51 ml. 6,35 mmol) foram adicionados a uma solução de diclorometano (5 mL) de ácido 4-cloropiridina-2-carboxílico (0,5 g, 3,17

mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por uma hora. Água foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com acetato de etila. A solução de extração com acetato de etila foi seca sobre sulfato de magnésio e concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 11:1 → 5:1). O produto purificado foi concentrado até secura em baixa pressão para obter N-(2,2,2-trifluoretil)-4-cloropiridina-2-carboxamida (435 mg) na forma de um pó branco.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 4,13 (2H, dq, J=6,8Hz, 9,0Hz), 7,49 (1H, dd, J=2,1Hz, J=5,3Hz), 8,22 (1H, dd, J=0,4Hz, J=2,1Hz), 8,30 (1H, br), 8,49 (1H, dd, J=0,4Hz, J=5,3Hz).

Exemplo referência 15

Síntese de 2-clorotiazol-4-carboxamida

1-hidroxibenzotriazol (0,56 g, 3,7 mmol), cloridrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etil carbodiimida (WSC) (0,7 g, 3,7 mmol) e amônia aquosa (28 %, 0,5 mL)) foram adicionados a uma solução de diclorometano (10 mL) de ácido 2-clorotiazol-4-carboxílico (0,5 g, 3,06 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 46 horas. Água foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com acetato de etila. A solução de extração com acetato de etila foi seca sobre sulfato de magnésio e concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 3:5 → acetato de etila). O produto purificado foi concentrado até secura em baixa pressão para obter 2-clorotiazol-4-carboxamida (475 mg) na forma de um pó branco.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 5,70 (1H, br), 7,01 (1H, br), 8,06 (1H, s).

Exemplo referência 16

Síntese de N-metil-2-clorotiazol-5-carboxamida

O composto título foi obtido usando ácido 2-clorotiazol-5-

carboxílico da mesma maneira que no exemplo referência 13,

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 3,00 (3H, d, J=4,9Hz), 5,92 (1H, br), 7,84(1H, br).

Exemplo referência 17

Síntese de 6-metóxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona

Carbono em paládio 5 % (1,5 g) foi adicionado a uma solução de etanol (250 mL) de 2-(4-metóxi-2-nitrofenóxi)-2-metil propionato de etila (14,6 g, 51,6 mmol) para realizar redução catalítica em temperatura ambiente. O catalisador foi removido por filtração e o filtrado foi concentrado em baixa pressão. Água foi adicionada ao resíduo obtido, que foi então extraído com acetato de etila. A solução de extração foi seca sobre sulfato de magnésio, e concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 9:1). O produto purificado foi concentrado até secura em baixa pressão para obter 6-metóxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona (7,0 g) na forma de um pó branco.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,53 (6H, s), 3,78 (3H, s), 6,40 (1H, d, J=2,8Hz), 6,52 (1H, dd, J=2,8Hz, J=8,8Hz), 6,88 (1H, d, J=8,7Hz), 8,66 (1H, brs).

Exemplo referência 18

Síntese de 6-hidróxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona

Uma solução de diclorometano (36 mL) de tribrometo de boro 2 M foi adicionada gota-a-gota a uma solução de diclorometano de 6-metóxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona (5,0 g, 26 mmol) mediante resfriamento em gelo e a mistura foi agitada durante toda a noite. Água foi adicionada à solução de reação para decompor os reagente presentes excessivamente. A solução de reação foi lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio e concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 2:1). O

produto purificado foi concentrado até secura em baixa pressão para obter 6-hidróxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona (4,02 g) na forma de um pó branco.

RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,34 (6H, s), 6,25-6,40 (2H, m), 6,70 (1H, d, J=8,5 Hz), 9,09 (1H, s), 10,41 (1H, brs).

Exemplo referência 19

Síntese de 6-hidróxi-2-metil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona

O composto título foi obtido usando 6-metóxi-2-metil-4H-benzo[1,4]oxazin-3-ona da mesma maneira que no exemplo referência 18. Pó branco

RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,34 (3H, d, J=6,8 Hz), 4,46 (1H, q, J=6,8 Hz), 6,23-6,27 (1H, m), 6,33 (1H, d, J=2,7 Hz), 6,70 (1H, d, J=8,6 Hz), 9,11 (1H, s), 10,44 (1H, brs).

Exemplo referência 20

Síntese de 4-(4-metoxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina

Cloreto de p-toluenossulfonila (4,39 g, 23 mmol) foi adicionado a uma solução de piridina (30 mL) de 4-(4-metoxifenil)piperidina (4,0 g, 21 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente durante toda a noite. Água foi adicionada à mistura de solução, que foi então extraída com acetato de etila. A fase orgânica foi lavada com ácido clorídrico e água, seca sobre sulfato de magnésio e concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 1:1). O produto purificado foi concentrado até secura em baixa pressão para obter 4-(4-metoxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina (4,8 g) na forma de um pó branco.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,60-1,90 (4H, m), 2,30-2,40 (3H, m), 2,46 (3H, s), 3,78 (3H, s), 3,90-3,95 (2H, m), 6,84 (2H, dd, J=1,9, J=6,8 Hz), 7,07 (2H, dd, J=1,9, J=6,8 Hz), 7,35 (2H, d, J=8,2 Hz), 7,68 (2H, d, J=8,2 Hz).

Exemplo referência 21

Síntese de 4-(4-hidroxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina

O composto título foi obtido usando 4-(4-metoxifenil)-1-(tolueno-4-sulfonil)piperidina da mesma maneira que no exemplo referência 18. Pó marrom

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,60-1,90 (4H, m), 2,30-2,50 (3H, m), 2,45 (3H, s), 3,90-3,95 (2H, m), 6,67 (1H, brs), 6,80 (2H, dd, J=1,9, J=6,8 Hz), 7,02 (2H, dd, J=1,8, J=6,9 Hz), 7,35 (2H, d, J=8,1 Hz), 7,68 (2H, d, J=8,1 Hz).

Exemplo referência 22

Síntese de 4-bromo-2-hidroximetil-6-metoxifenol

Boroidreto de sódio (0,28 g, 6,9 mmol) foi adicionado a uma solução de THF (30 mL) de 5-bromo-2-hidróxi-3-metoxibenzaldeído (3,2 g 13,8 mmol) mediante resfriamento em gelo e a mistura foi agitada a 0 °C por 2 horas. Ácido acético foi adicionado à solução de reação para ajustar o pH a 3, ácido clorídrico 10 % foi adicionado à mistura de reação, que foi então extraída com acetato de etila. O material extraído foi seco sobre sulfato de magnésio e concentrado em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 5:1 → 1:1) e concentrado até secura em baixa pressão para obter 4-bromo-2-hidroximetil-6-metoxifenol (3,23 g) na forma de um óleo amarelo claro.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 3,88 (3H, s), 4,71 (2H, s), 6,94 (1H, d, J=2,0Hz), 7,03 (1H, d, J=2,0Hz).

Exemplo referência 23

Síntese de 5-bromo-3-metóxi-2-metoximetoxibenzaldeído

Etil diisopropil amina (3,01 mL, 17,1 mmol) e cloreto de metoximetila (1,5 mL, 15,7 mmol) foram adicionados a uma solução de diclorometano (30 mL) de 5-bromo-2-hidróxi-3-metoxibenzaldeído (3,3 g, 14,3 mmol) mediante resfriamento em gelo, e a mistura foi agitada em

temperatura ambiente por 2 horas. A solução de reação foi lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio, e concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 3:1 → 11:9). O produto purificado foi concentrado até secura em baixa pressão para obter 5-bromo-3-metóxi-2-metoximetoxibenzaldeído (4,2 g) na forma de um sólido amarelo claro.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 3,56 (3H, s), 3,89 (3H, s), 5,21 (2H, s), 7,23 (1H, d, J=2,5Hz), 7,56 (1H, d, J=2,5Hz), 10,39 (1H, s).

Exemplo referência 24

Síntese de 3-metóxi-2-metoximetóxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldeído

2-oxazolidinona (0,38 g, 4,36 mmol), dipaládio tris(dibenzilindenoacetona) (0,17 g, 0,18 mmol), 9,9-dimetil-4,5-bis(difenil fosfina)xanteno (XANTPHOS)(0,32 g, 0,55 mmol) e carbonato de césio (1,66 g, 5,1 mmol) foram adicionados a uma solução de dioxano (20 mL) de 5-bromo-3-metóxi-2-metoximetoxibenzaldeído (1,0 g, 3,6 mmol) e a mistura foi agitada a 100 °C por 24 horas em uma atmosfera de argônio. A solução de reação foi resfriada para temperatura ambiente e acetato de etila foi adicionado a ela. A mistura foi filtrada por celite. O filtrado foi lavado com água, seco sobre sulfato de magnésio e concentrado em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 4:1 → 1:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão. Acetato de etila e éter diisopropílico foram adicionados ao resíduo. O material insolúvel então purificado foi obtido por filtração e seco para obter 3-metóxi-2-metoximetóxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldeído (0,5 g) na forma de um pó branco.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 3,57 (3H, s), 3,93 (3H, s), 4,06-4,12 (2H, m), 4,48-4,54 (2H, m), 5,21 (2H, s), 6,96 (1H, d, J=2,5Hz), 8,18 (1H, d, J=2,5Hz), 10,45(1H, s).

Exemplo referência 25

Síntese de 3-(3-metóxi-4-metoximetóxi-5-metil fenil)oxazolidin-2-ona

3-metóxi-2-metoximetóxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldeído (0,5 g, 1,79 mmol) foi dissolvido em uma mistura de solvente de ácido acético (5 mL) e etanol (5 mL) e carbono em paládio 10 % (0,05 g) foi adicionado a ele para realizar redução catalítica em 1 atm a 50 °C por 4 horas. A mistura de reação foi resfriada para temperatura ambiente e filtrada por celite. O filtrado foi concentrado em baixa pressão. O resíduo foi dissolvido em ácido acético (10 mL) e carbono em paládio 10 % (0,05 g) foi adicionado a ele para realizar redução catalítica a 1 atm a 50 °C por 6 horas. O solvente foi removido em baixa pressão para obter 3-(3-metóxi-4-metoximetóxi-5-metil fenil)oxazolidin-2-ona como um produto bruto, que foi submetido à próxima reação como tal.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,32 (3H, s), 3,56 (3H, s), 3,85 (3H, s), 3,98-4,06 (2H, m), 4,43-4,50 (2H, m), 5,05 (2H, s), 6,61 (1H, d, J=2,3Hz), 7,36 (1H, d, J=2,3Hz).

Exemplo referência 26

Síntese de 3-(4-hidróxi-3-metóxi-5-metil fenil)oxazolidin-2-ona

Ácido clorídrico 10 % (5 mL) foi adicionado a uma solução de metanol (5 mL) de 3-(3-metóxi-4-metoximetóxi-5-metil fenil)oxazolidin-2-ona (0,48 g, 1,79 mmol) e a mistura foi agitada a 50 °C por 10 minutos. Água foi adicionada à solução de reação, que foi extraída com acetato de etila. O material extraído foi seca sobre sulfato de magnésio, e daí em diante concentrado até secura em baixa pressão para obter 3-(4-hidróxi-3-metóxi-5-metil fenil)oxazolidin-2-ona (434 mg) na forma de um pó amarelo claro.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,26 (3H, s), 3,90 (3H, s), 4,02 (2H, dd, J=7,0Hz, J=8,5Hz), 4,46 (2H, dd, J=7,0Hz, J=8,5Hz), 5,55 (1H, br), 6,56

(1H, d, J=2,5Hz), 7,31 (1H, d, J=2,5Hz).

Exemplo referência 27

Síntese de 1-(8-metóxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,3]dioxin-6-il)pirrolidin-2-ona

O composto título foi obtido usando 6-bromo-8-metóxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,3]dioxina e 2-pirrolidona da mesma maneira que no exemplo referência 25.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,59 (6H, s), 2,09-2,21 (2H, m), 2,60 (2H, t, J=8,3Hz), 3,82 (2H, t, J=7,0Hz), 3,88 (3H, s), 4,83 (2H, s), 6,67 (1H, d, J=2,5Hz), 7,24 (1H, d, J=2,5Hz).

Exemplo referência 28

Síntese de 1-(4-hidróxi-3-hidroximetil-5-metoxifenil)pirrolidin-2-ona

Ácido clorídrico 10 % (4 mL) foi adicionado to uma solução de THF (7 mL) de 1-(8-metóxi-2,2-dimetil-4H-benzo[1,3]dioxin-6-il)pirrolidin-2-ona (0,36 g, 1,3 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 17 horas. Água foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com diclorometano. O material extraído foi seca sobre sulfato de magnésio, concentrado em baixa pressão e purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: metanol: = 300: 1 → 30:1). O produto purificado foi concentrado até secura em baixa pressão para obter 1-(4-hidróxi-3-hidroximetil-5-metoxifenil)pirrolidin-2-ona (0,31 g) na forma de um pó marrom claro.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,05-2,28 (3H, m), 2,26 (2H, t, J=7,5Hz), 3,84 (2H, t, J=7,0Hz), 3,91 (3H, s), 4,74 (2H, s), 5,90 (1H, br), 6,78 (1H, d, J=2,5Hz), 7,52 (1H, d, J=2,5Hz).

Exemplo referência 29

Síntese de 3-metóxi-2-metoximetóxi-5-(2-oxopirrolidin-1-il)benzaldeído

O composto título foi obtido usando 5-bromo-3-metóxi-2-metoximetoxibenzaldeído e 2-pirrolidona da mesma maneira que no exemplo referência 25.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,11-2,24 (2H, m), 2,63 (2H, t, J=8,3Hz), 3,56 (3H, s), 3,89 (2H, t, J=7,0Hz), 3,92 (3H, s), 5,21 (2H, s), 7,08 (1H, d, J=2,5Hz), 8,28 (1H, d, J=2,5Hz), 10,46 (1H, s).

Exemplo referência 30

Síntese de 1-(4-hidróxi-3-metóxi-5-metil fenil)pirrolidin-2-ona

3-metóxi-2-metoximetóxi-5-(2-oxopirrolidin-1-il)benzaldeído (0,72 g, 2,56 mmol) foi dissolvido em uma mistura de solvente de ácido acético (5 mL) e etanol (7 mL) e carbono em paládio 10 % (70 mg) foi adicionado a ele para realizar redução catalítica a 50 °C por 10 horas. A solução de reação foi resfriada para temperatura ambiente e filtrada por celite. A torta filtrada foi concentrada em baixa pressão. O resíduo assim obtido foi dissolvido em diclorometano (15 mL) e ácido trifluoracético (2,0 mL, 25,6 mmol) e trietilsilano (2,0 mL, 12,8 mmol) foram adicionados a ele mediante resfriamento em gelo. A mistura foi agitada em temperatura ambiente por 16 horas. A mistura foi concentrada em baixa pressão e o resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 5:1 → acetato de etila). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão para obter 1-(4-hidróxi-3-metóxi-5-metil fenil)pirrolidin-2-ona (0,41 g) na forma de um óleo amarelo claro.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,17-2,25 (5H, m), 2,72 (2H, t, J=8,3Hz), 3,88 (2H, t, J=7,0Hz), 3,89 (3H, s), 6,66 (1H, d, J=2,5Hz), 7,15 (1H, d, J=2,5Hz).

Exemplo referência 31

Síntese de 3,4-diacetóxi-5-metil benzaldeído

Anidreto acético (1,2 mL, 12 mmol) foi adicionado a uma solução de piridina (4 mL) de 3,4-diidróxi-5-metil benzaldeído (0,72 g, 4,7

mmol) e a mistura foi agitada a 0 °C por uma hora. Ácido clorídrico 10 % foi adicionado à solução de reação, que foi extraída com acetato de etila. A fase orgânica foi lavada com uma solução de hidrogeno carbonato de sódio aquosa, seca sobre sulfato de magnésio e concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 5:1 → 3:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão para obter 3,4-diacetóxi-5-metil benzaldeído (0,98 g) na forma de um óleo amarelo claro.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,29 (3H, s), 2,32 (3H, s), 2,35 (3H, s), 7,58 (1H, d, J=1,6Hz), 7,67 (1H, d, J=1,6Hz), 9,93 (1H, s).

Exemplo referência 32

Síntese de 7-hidróxi-1,4-diidrobenzo[d][1,3]oxazin-2-ona

O composto título foi obtido usando 7-metoximetóxi-1,4-diidrobenzo[d][1,3]oxazin-2-ona da mesma maneira que no exemplo referência 26.

Pó branco

RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 5,14 (2H, s), 6,35 (1H, d, J=2,2 Hz), 6,39 (1H, dd, J= 8,1, J=2,2 Hz), 6,97 (1H, d, J=8,1 Hz), 9,98 (1H, br-s).

Exemplo referência 33

Síntese de 7-metóxi-3,4-diidro-1H-quinazolin-2-ona

2-aminometil-5-metoxianilina (1,2 g. 7,9 mmol) e carbonil diimidazol (1,53 g, 9,5 mmol) foram adicionados ao THF (100 mL) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente durante toda a noite. O material insolúvel precipitado foi obtido por filtração, lavado com diclorometano e água, seco para obter 7-metóxi-3,4-diidro-1H-quinazolin-2-ona (1,11 g) na forma de um pó branco.

RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 3,68 (3H, s), 4,23 (2H, s), 6,35 (1H, d, J=2,5Hz), 6,42 (1H, dd, J=8,3Hz, J=2,5Hz), 6,96 (1H, d, J=8,3Hz), 8,90 (1H, brs).

Exemplo referência 34

Síntese de 7-hidróxi-3,4-diidro-1H-quinazolin-2-ona

O composto título foi obtido usando 7-metóxi-3,4-diidro-1H-quinazolin-2-ona da mesma maneira que no exemplo referência 18.

Pó marrom claro

RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 4,18 (2H, brs), 6,75-6,85 (1H, m), 7,01 (1H, dd, J = 2,0 Hz, J=9,0Hz), 8,07 (1H, d, J = 9,0Hz), 8,87 (1H, brs), 9,48 (1H, brs), 13,21 (1H, brs).

Exemplo referência 35

Síntese de 5-(3-cloropropóxi)-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metila

Carbonato de césio (2,08 g, 6,4 mmol) e 1-bromo-3-cloropropano (1,6 mL) foram adicionados a uma solução de DMF (5 mL) de 5-hidróxi-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metila (0,83 g, 5,3 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 21 horas. Água foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com acetato de etila. A fase orgânica foi lavada com água e seca sobre sulfato de magnésio. A solução de reação foi concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 100:1 → 4:1). O produto purificado foi concentrado até secura em baixa pressão para obter 5-(3-cloropropóxi)-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metila (1,17 g) na forma de um sólido branco.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,21-2,32(2H, m), 3,72(2H, t, J=6,3Hz), 3,72(2H, s), 3,91(3H, s), 4,24(2H, t, J=5,8Hz), 6,10(1H, s).

Exemplo referência 36

Síntese de 7-(3-cloropropóxi)-2H-1,4-benzoxazin-3(4H)-ona

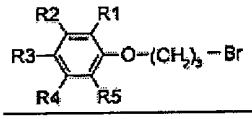
O composto título foi obtido usando 7-hidróxi-2H-1,4-benzoxazin-3(4H)-ona e 1-bromo-3-cloropropano da mesma maneira que no exemplo referência 35.

Cristal tipo agulha marrom claro (etanol-n-hexano)

Ponto de fusão: 119-120 °C

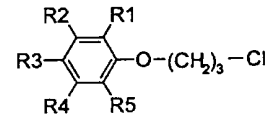
Os compostos listados nas seguintes tabelas 1 a 12 foram produzidos usando substâncias de partida apropriadas da mesma maneira que nos exemplos referência 1 a 36,

[Tabela 1]




| Exemplo de referência | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 37 | -H | -H | $-CONHC_2H_5$ | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm : 1.25(3H, t, J=7.5Hz), 2.29-2.39 ( 2H, m ), 3.43-3.54(2H, m), 3.61 ( 2H, t, J = 6.3Hz ), 4.15 ( 2H, t, J = 5.8Hz ), 5.99(1 H, br), 6.89-6.95 ( 2H, m ), 7.70-7.75 ( 2H, m ) |
| 38 | -H | -H | $-CONHC_3H$, | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 0.99(3H, t, J=7.5Hz), 1.57-1.68(2H, m), 2.23-2.36 (2H, m ), 3.37-3.45(2H, m), 3.61 (2H, t, J = 6.3Hz ), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.12-4.18 ( 2H, m), 6.02(1 H, br), 6.71-6.95 (2H, m ), 7.71-7.75 (2H, m ) |

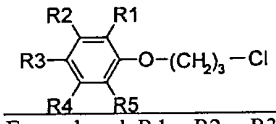
[Tabela 2]




| Exemplo de referência | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 39 | -H | -H | $-NO_2$ | -H | -F | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.20-2.45 (2H, m), 3.70-3.80 (2H, m), 4.30-4.35 (2H, m), 7.07 (1 H, dd, J=8.2, 8.9 Hz), 8.00 (1 H, dd, J=2.7, 10.7 Hz), 8.07 (1 H, dd, J=0.9, 9.0Hz). |
| 40 | -H | -H | $-NH_2$ | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.14-2.24 (2H, m), 3.26( 2H, br), 3.73(2H, t, J=6.3Hz), 4.04(2H, t, J=5.8Hz ), 6.61-5.67(2H, m), 6.72-6.78(2H, m) |
| 41 | -H | -H | $-NHCO_2CH_3$ | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.15-2.25 (2H, m ), 3.74 ( 2H, t, J = 6.3Hz ), 3.76(3H, s), 4.09 ( 2H, t, J = 5.8Hz ), 6.42(1 H, br), 6.85 (2H, dd, J = 2.5, 6.8Hz ), 7.21-7.33 (2H, m) |
| 42 | -H | -H | $-CH_2CON(C_2H_5)_2$ | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.07-1.14(6H, m), 2.17-2.30 (2H, m ), 3.26-3.42(4H, m), 3.63 ( 2H, s), 3.74 ( 2H, t, J = 6.3Hz ), 4.09(2H, t, J=5.8Hz), 6.83-6.88 ( 2H, m ), 7.14-7.19 ~2H,m) |
| 43 | -H | -H | -H | $-NHCO2CH_3$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.28-2.37 (2H, m ), 3.74(2H, t, J=6.5Hz), 3.77 ( 3H, s ), 4.11 ( 2H, t, J = 6.0Hz ), 6.50-6.67 ( 2H, m ), 6.83(1 H, dd, J=1.5Hz, 7.8Hz), 7.16-7.22 (2H, m ) |
| 44 | -H | -H | $-NHSO_2C_2H_5$ | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$ ) δppm: 1.37 (3H, t, J=7.4 Hz), 2.15-2.30 (2H, m), 3.07 (2H, q, J=7.4 Hz), 3.75 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.10 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.41 (1 H, brs), 6.88 (2H, dt, J=8.9, 3.4 Hz), 7.19 (2H, dt, J=8.9, 3.4 Hz). |
| 45 | -H | -H | $-NH_2$ | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.15-2.30 (2H, m), |

| | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | | | | | 3.20-3.70 (2H, br), 3.75-3.95 (2H, m), 3.83(3H, s), 4.07 (2H, t, J=3 Hz), 6.24 (1H, dd, J=2.6, 8.4 Hz), 6.33 (1 H, d, J=2.7 Hz), 6.77 (1 H, d, J=8.4Hz). |
| 46 | -H | -H | $-NHCO_2CH_3$ | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 3.77 (3H, s), 3.86 (3H, s), 4.13 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.55 (1 H, brs), 6.73 (1 H, dd, J=2.4, 8.6 Hz), 6.84 (1 H, d, J=8.6 Hz), 7.20 (1 H, brs). |
| 47 | -H | -H | $-CONHC_2H_5$ | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.23 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.20-2.30 (2H, m), 3.40-3.50 (2H, m), 3.74 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.14 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.13 (1 H, brs), 6.85-6.95 (2H, m), 7.70-7.75 (2H, m). |
| 48 | -H | -H | $-NHCON(CH_3)_2$ | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.15-2.25 (2H, m), 3.02 (6H, s), 3.74 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.08 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.20 (1 H, brs), 6.84 (2H, dd, J=2.0, 6.8 Hz), 7.26 (2H, dd, J=2.1, 6.8 Hz). |
| 49 | -H | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | -Cl | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.39(3H, t, J=7.0Hz), 2.27-2.37 (2H, m ), 3.81(2H, t, J=6.8Hz), 4.25(2H, t, J=6.3Hz), 4.36(2H, q, J=7.0Hz), 6.96(1 H, d, J=8.5Hz), 7.93(1 H, dd, J=2.0Hz, 8.5Hz), 8.06(1 H, d, J=2.0Hz) |

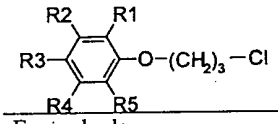
[Tabela 3]




| Exemplo de referência | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 50 | -H | -H | $-CH_2CO_2C_2H_5$ | -H | -Cl | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.26(3H, t, J=7.0Hz), 2.23-2.33 (2H, m ), 3.52(2H, s), 3.80(2H, t, J=6.3Hz), 4.15(2H, q, J=7.0Hz), 6.90(1 H, d, J=8.3Hz), 7.13(1 H, dd, J=2.0Hz, 8.3Hz), 7.30(1H, d, J=2.0Hz) |
| 51 | -H | -H | $-CH_2CONHCH_3$ | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.19-2.29(2H, m ), 2.76(3H, d, J=4.8Hz), 3.52(2H, s), 3.76(2H, t, J=6.3Hz), 4.12(2H, t, J=5.8Hz), 5.35(1 H, br), 6.86-6.92(2H, m), 7.13-7.18(2H, m) |
| 52 | -H | -H | $-CH_2CH_2NHCH_3$ | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.18-2.27 (2H, m), 2.43(2H, s), 2.72-2.83(4H, m), 3.71(3H, s), 3.75(4H, t, J=6.3Hz), 4.09(2H, t, J=5.8Hz), 6.83-6.86(2H, m), 7.10-7.14(2H, m) |
| 53 | -H | -H | $-(CH_2)_2N(CH_3)CO_2C(CH_3)_3$ | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.42(9H,s), 2.17-2.27 (2H, m), 2.67-2.86(5H, m), 3.35-3.41(2H, m), 3.74(2H, t, J=6.3Hz), 4.09( 2H, t, J=5.8Hz ), 6.83(2H, d, J=8.5Hz), 7.00-7.16(2H, m) |
| 54 | -H | -H | $-NH_2$ | -H | -F | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.15-2.25 (2H, m), 3.54 (2H, brs), 3.76 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.05-4.15 (2H, m), 6.35-6.40 (1 H, m), 6.46 (1 H, dd, J=0.9, 12.6 Hz), 6.82 (1 H, dd, J=8.5, 8.5Hz). |
| 55 | -H | -H | $-NHCO_2CH_3$ | -H | -F | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 3.77 (2H, t, J=6.5 Hz), 3.77 (3H, s), 4.10-4.20 (2H, m), 6.57 (1 H, brs), 6.85-7.00 (2H, m), 7.25-7.30 (1 H, m). |
| 56 | -H | -H | $-CH_2CO_2C_2H_5$ | -H | -F | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.26(3H, t, J=7.0Hz), 2.21-2.30 (2H, m ), 3.5382H, s), 3.77(2H, t, J=6.3Hz), 4.11-4.20(4H, m), 6.89-7.06(3H, m) |
| 57 | -H | -H | $-CO_2C_2H$, | -H | -Br | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.39(3H, t, |

| | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | | | | | J=7.0Hz), 2.27-2.37 (2H, m ), 3.82(2H, t, J=6.3Hz), 4.24(2H, t, J=5.8Hz), 4.35(2H, q, J=7.0Hz), 6.92(1 H, d, J=8.5Hz), 7.98(1 H, dd, J=2.0Hz, 8.5Hz), 8.23(1 H, d, J=2.0Hz) |
| 58 | | -H | -H | -CHO | $-OCH_3$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.23-2.34 (2H, m ), 3.76(2H, t, J=6.3Hz), 3.91(3H, s), 4.20(2H, t, J=5.8Hz), 6.46(1 H, d, J=2.0Hz), 6.56(1 H, dd, J=2.0Hz, 8.3Hz), 7.81(1 H, d, J=8.3Hz), 1029(1 H, s) |
| 59 | | -H | -H | $-CO_2C_2H$, | -H | -NO2 | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.41(3H, t, J=7.0Hz), 2.26-2.40(2H, m ), 3.81(2H, t, J=6.3Hz), 4.32-4.44(4H, m), 7.15(1 H, d, J=8.8Hz), 8.22(1 H, dd, J=2.0Hz, 8.8Hz), 8.52(1 H, d, J=2.0Hz) |

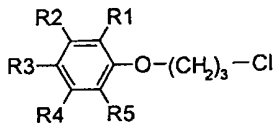
[Tabela 4]




| Exemplo de referência | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 60 | -H | -H | $-CONHC_2H_5$ | -H | $-NO_2$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.26 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.25-2.35 (2H, m), 3.45-3.55 (2H, m), 3.80 (2H, t, J=6.1 Hz), 4.30-4.35 (2H, m), 6.34 (1 H, brs), 7.15 (1 H, d, J=8.8 Hz), 8.04 (1 H, dd, J=2.3, 8.8 Hz), 8.25 (1 H, d, J=2.3 Hz). |
| 61 | -H | -H | $-CONH_2$ | $-OCH_3$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.21-2.35 (2H, m), 3.75( 2H, t, J=6.3Hz), 3.95(3H, s), 4.18( 2H, t, J=5.8Hz ), 5.67(1 H, br), 6.51(1 H, d, J=2.5Hz), 6.61(1 H, dd, J=2.5Hz, 8.8Hz), 7.59 i 1 H, br ), 8.18 ( 1 H, d, J=8.8Hz ) |
| 62 | -H | -H | $-CONHCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$ ) δppm: 2.20-2.30 (2H, m ), 2.99(3H, d, J=5.0Hz), 3.75( 2H, t, J=6.3Hz), 3.94(3H, s), 4.17( 2H, t, J=6.0Hz ), 6.49(1 H, d, J=2.5Hz), 6.60(1 H, dd, J=2.5Hz, 8.8Hz), 7.70 ( 1 H, br), 8.19 ( 1 H, d, J=8.8Hz ) |
| 63 | -H | -H | $-CONHC_2H_5$ | $-OCH_3$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$ ) δppm: 1.23(3H, t, J=7.3Hz), 2.20-2.30 (2H, m ), 3.43-3.54(2H, m), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 3.94(3H, s), 4.17( 2H, t, J=6.3Hz ), 6.49(1 H, d, J=2.5Hz), 6.60(1 H, dd, J=2.5Hz, 8.8Hz), 7.70 ( 1 H, br }, 8.18 ( 1H, d, **J=8.8** Hz ) |
| 64 | -H | -H | $-CONHCH_2CF_3$ | $-OCH_3$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.21-2.31 (2H, m), 3.75( 2H, t, J=6.3Hz), 3.98(3H, s), 4.07-4.21( 4H, m ), 6.51(1 H, d, J=2.5Hz), 6.62(1 H, dd, J=2.5Hz, 8.8Hz), 8.09 ( 1 H, br ), 8.18 ( 1 H, d, J=8.8Hz ) |
| 65 | -H | -H | $-CH=CHCO_2C_2H_5$ | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.33(3H, t, J=7.0Hz), 2.20-2.30(2H, m ), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.15(2H, t, J=5.8Hz), 4.25(2H, q, J=7.0Hz), 6.31(1 H, d, J=16.0Hz), 6.88-6.93(2H, m), 7.44-7.50(2H, m), 7.64(1 H, d, J=16.0Hz) |
| 66 | -F | -H | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 2.25-2.34 (2H, m ), 3.78(2H, t, J=6.3Hz), 4.25(2H, t, J=5.8Hz), 4.37(2H, q, J=7.0Hz), 7.08-7.15(1H, m), 7.62-7.70(2H, **M)** |
| 67 | -H | -H | $-CO_2H$ | $-CH_3$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.21-2.31 (2H, m), 2.64(3H, s), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.18(2H, t, J=5.8Hz), 6.77-6.81(2H, m), 8.06(1 H, d, J=9.5Hz), 11.00(1H, br) |
| 68 | -CI | -H | -H | - | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.40(3H, t, |

| | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| | | | | $CO_2C_2H_5$ | | J=7.0Hz), 2.25-2.37 (2H, m ), 3.82(2H, t, J=6.3Hz), 4.25(2H, t, J=5.8Hz), 4.38(2H, q, J=7.0Hz), 7.42(1 H, d, J=8.5Hz), 7.58-7.62(2H, m) |
| 69 | $-CH_3$ | -H | -H | - $CO_2C_2H_5$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.39(3H, t, J=7.0Hz), 2.24-2.34 (2H, m ), 2.26(3H, s), 3.78(2H, t, J=6.3Hz), 4.19(2H, t, J=5.8Hz), 4.37(2H, q, J=7.0Hz), 7.19(1 H, d, J=7.8Hz), 7.49(1H, d, J=1.5Hz), 7.57(1H, dd, J=1.5Hz, 7.8Hz) |

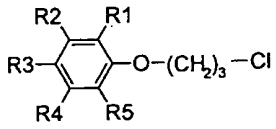
[Tabela 5]




| Exemplo de referência | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 70 | -H | -H | $-CONH_2$ | $-CH_3$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.19-2.29 (2H, m ), 2.51(3H, s), 3.75( 2H, t, J=6.3Hz), 4.14( 2H, t, J=6.3Hz ), 6.53(2H, br), 6.71(2H, m), 7.45 ( 1 H, d, J=8.3Hz ) |
| 71 | -H | -H | $-CONHCH_3$ | $-CH_3$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.18-2.28 (2H, m ), 2.45(3H, s), 2.98(3H, d, J=4.9Hz), 3.74( 2H, t, J=6.3Hz), 4.12( 2H, t, J=5.8Hz ), 5.72(1 H, br), 6.68-6.75(2H, m), 7.32 ( 1 H, d, J=8.3Hz ) |
| 72 | -H | -H | $-CONHC_2H_5$ | $-CH_3$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.24(3H, t, J=7.3Hz), 2.19-2.28 (2H, m ), 2.45(3H, s), 3.41-3.52(2H, m), 3.74( 2H, t, J=6.3Hz), 4.12( 2H, t, J=6.OHz ), 5.68(1 H, br), 6.68-6.75(2H, m), 7.32 ( 1 H, d, J=8.3Hz ) |
| 73 | $-CH_3$ | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | $-CH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.38(3H, t, J=7.OHz), 2.21-2.28 (2H, m ), 2.31(6H, s), 3.84(2H, t, J=6.3Hz), 3.93(2H, t, J=5.8Hz), 4.35(2H, t, J=7.OHz), 7.72(2H, S) |
| 74 | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.39(3H, t, J=7.1Hz), 2.26-2.36 (2H, m ), 3.78(2H, t, J=6.3Hz), 3.91(3H, s), 4.22( 2H, t, J=5.8Hz ), 4.36(2H, q, J=7.1 Hz), 6.89(1 H, d, J=8.3Hz), 7.58(1 H, d, J=2.OHz), 7.70 ( 1 H, d, J=8.3Hz ) |
| 75 | $-OCH_3$ | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.40(3H, t, J=7.OHz), 2.13-2.23 (2H, m ), 3.85(2H, t, J=6.3Hz), 3.90(6H, s), 4.17(2H, t, J=5.8Hz), 4.38(2H, q, J=7.OHz), 7.30(2H, S) |
| 76 | $-CH_3$ | -H | -CHO | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.17-2.29 (2H, m ), 2.34(3H, s), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.91(3H, s), 4.18(2H, t, J=5.8Hz), 7.31(1 H, s), 9.86(1 H, s) |
| 77 | $-CH_3$ | -H | $-CO_2H$ | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.18-2.28 (2H, m ), 2.32(6H, s), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.90(3H, s), 4.16(2H, t, J=5.8Hz), 7.50(1 H, d, J=2.OHz), 7.60(1 H, d, J=2.OHz) |
| 78 | $-CH_3$ | -H | $-CONH_2$ | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.17-2.27 (2H, m ), 2.30(3H, s), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.89(3H, s), 4.12( 2H, t, J=5.8Hz ), 5.24-6.26(2H, br), 7.15(1 H, d, J=2.OHz), 7.32 ( 1 H, d, J=2.OHz ) |
| 79 | $-CH_3$ | -H | $-CONHCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.17-2.26 (2H, m ), 2.29(3H, s), 3.00(3H, d, J=5.OHz), |

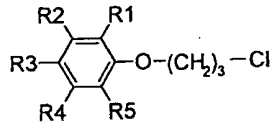
| | |
|---|---|
| | 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.88(3H, s), 4.10( 2H, t, J=5.8Hz ), 6.06(1 H, br), 7.08(1 H, d, J=1.9Hz), 7.28 ( 1 H, d, J=1.9Hz ) |

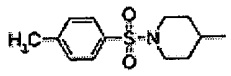
[Tabela 6]



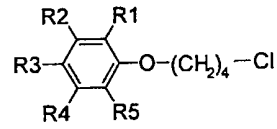

| Exemplo de referência | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 80 | $-CH_3$ | -H | $-CONHC_2H_5$ | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.25(3H, t, J=7.3Hz), 2.17-2.26 (2H, m ), 2.30(3H, s), 3.43-3.54(2H, m), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.89(3H, s), 4.10( 2H, t, J=5.8Hz ), 6.02(1 H, br), 7.07(1 H, d, J=2.OHz), 7.28 ( 1 H, d, J=2.OHz ) |
| 81 | $-CH_3$ | -H | $-NHCO_2C(CH_3)_3$ | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.51(9H,□), 2.14-2.26 (2H, m ), 2.23(3H, s), 3.82(2H, t, J=6.3Hz), 3.83(3H, s), 3.99( 2H, t, J=5.8Hz ), 6.34(1 H, br), 6.59(1 H, d, J=2.5Hz), 7.01(1 H, d, J=2.5Hz) |
| 82 | $-CH_3$ | -H | $-NHCO_2CH$, | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.17-2.29 (2H, m), 2.30(3H, s), 3.83( 2H, t, J=6.3Hz), 3.89(6H, s), 4.13(2H, t, J=5.8Hz ), 7.44(1H, d, J=2.OHz), 7.51 ( 1 H, d, J=2.OHz ) |
| 83 | $-CH_3$ | -H | $-CO_2CH_3$ | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.15-2.30 (2H, m), 2.29 (3H, s), 3.75-3.90 (2H, m), 3.88 (3H, s), 3.89 (3H, s), 4.13 (2H, t, J=5.9 Hz), 7.43~1H, d, J=1.8 Hz), 7.50 (1 H, d, J=1.4Hz). |
| 84 | $-CH_3$ | -H | $-NH_2$ | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.14-2.22 (2H, m), 2.19(3H, s), 3.47(2H, br), 3.82(2H, t, J=5.3Hz), 3.95(2H, t, J=4.8Hz), 6.09-6.13(2H, m) |
| 85 | $-CH_3$ | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.11-2.28 (2H, m), 2.15(3H, s), 2.24(3H, s), 3.82( 2H, t, J=6.3Hz), 3.83(3H, s), 4.01( 2H, t, J=5.8Hz ), 6.66(1 H, d, J=2.1 Hz), 7.02(1 H, br), 7.23 ( 1 H, d, J=2.1 Hz ) |
| 86 | $-CH_3$ | -H | -CHO | -H | $-OCOCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.17-2.27(2H, m ), 2.37(6H, s), 3.79(2H, t, J=5.6Hz), 4.11(2H, t, J=5.8Hz), 7.46(1 H, d, J=2.OHz), 7.62(1 H, d, J=2.OHz), 9.88(1 H, s) |
| 87 | $-CH_3$ | -H | $-CO_2H$ | -H | $-OCOCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.16-2.26(2H, m ), 2.35(3H, s), 2.36(3H, s), 3.79(2H, t, J=6.3Hz), 4.09(2H, t, J=5.8Hz), 7.67(1 H, d, J=2.OHz), 7.84(1 H, d, J=2.OHz) |
| 88 | -OH | -H | $-CONHCH_3$ | -H | $-CH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.21-2.35(2H, m), 2.32(3H, s), 2.99(3H, d, J=4.9Hz), 3.85(2H, t, J=6.3Hz), 4.05(2H, t, J=5.8Hz), 5.90(1 H, br), 6.02(1 H, br), 7.15(1 H, d, J=1.8Hz), 7.20(1 H, d, J=2.OHz) |
| 89 | $-CH_3$ | -H | $-CONHCH_3$ | -H | $-OC_2H_5$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.46(3H, t, J=7.OHz), 2.17-2.27 (2H, m ), 2.28(3H, s), 2.99(3H, d, J=5.OHz), 3.83( 2H, t, J=6.3Hz), 4.06-4.15(4H, m ), 6.04(1 H, br), 7.07(1 H, d, J=1.8Hz), 7.25 ( 1 H, d, J=1.8Hz ) |
| 90 | -H | -H | $-CO_2H$ | $-OCH_3$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.22-2.32 (2H, m), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.05(3H, s), 4.21( 2H, t, J=5.8Hz ), 6.55(1H, d, J=2.5Hz), 6.66(1H, d, J=8.8Hz), 8.14(1 H, d, J=8.8Hz), 10.43(1 H, br) |

[Tabela 7]




| Exemplo de referência | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 91 | -H | -H |  | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.2-2.3 (2H, m ), 3.77 (2H, t, J = 6.3Hz ), 4.16 ( 2H, t, J = 5.8Hz ), 7.00 ( 2H, dd, J = 2.2, 6.7Hz ), 7.15-7.25 ( 2H, m ), 7.25-7.35 ( 2H, m ), 7.76 1 H, s). |
| 92 | -H | -H |  | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.26 (2H, t, J=6.1 Hz), 3.75 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.7 Hz), 7.00 (1 H, dd, J=2.1, 6.9 Hz), 7.56 (1 H, dd, J=2.2, 7.1 Hz), 8.07 (1 H, s), 8.45(1 H, s). |
| 93 | -H | - |  | -H | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.70-1.90 (4H, m), 2.10-2.40 (3H, m), 2.45 (3H, s), 3.55-3.75 (2H, m), 3.90-3.95 (2H, m), 4.05-4.15 (2H, m), 6.84 (2H, dd, J=1.9,6.8 Hz), 7.06 (2H, dd, J=1.8, 6.9 Hz), 7.34 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.2 Hz). |
| 94 | $-CH_3$ | -H |  | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.16-2.25 (2H, m), 2.28(3H, s), 3.83( 2H, t, J=6.3Hz), 3.86(3H, s), 3.99-4.06(4H, m ), 4.46(2H, dd, J=6.3Hz, 8.8Hz), 6.61(1 H, d, J=2.5Hz), 7.33 (1 H, d, J=2.5Hz ) |
| 95 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_2OH$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.09-2.28 (2H, m), 2.61(2H, t, J=7.8Hz), 3.79-3.87(4H, m), 3.88(3H, s), 4.13(2H, t, J=5.5Hz ), 4.71(2H, d, J=5.8Hz), 6.85(1 H, d, J=2.5Hz), 7.59 ( 1 H, d, J=2.5Hz ) |
| 96 | $-CH_3$ | -H |  | -H | $-OCH_3$ | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.05-2.25 (4H, m ), 2.27(3H, s), 2.60(2H, t, J=8.3Hz), 3.79-3.89(42H, m), 3.86(3H, s), 6.71(1 H, d, J=2.5Hz), 7.37 ( 1 H, d, J=2.5Hz ) |

[Tabela 8]

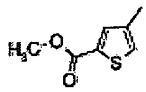
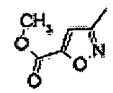
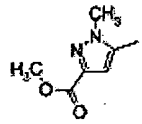
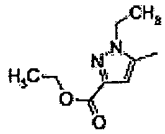
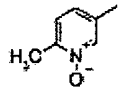
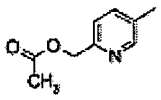
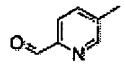
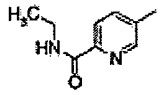
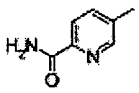
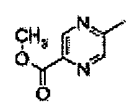



| Exemplo de referência | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 97 | -H | -H | -H | $-NO_2$ | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.93-2.11 (4H, m), 3.59-3.70(2H, m), 4.00-4.13(2H, m), 7.20-7.24(1 H, m), 7.43(1 H, t, J=8.OHz), 7.72(1 H, t, J-2.3Hz), 7.80-7.84(1 H, m) |
| 98 | -H | -H | -H | -CN | -H | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) bppm: 1.96-2.00 (4H, m ), 3.60-3.65 (2H, m), 3.99-4.14( 2H, m ), 7.10-7.14 ( 2H, m ), 7.22-7.26 ( 1H, m ), 7.34-7.40 ( 1 H, m ) |

5

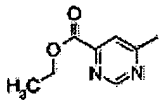
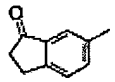
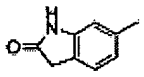
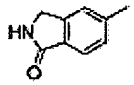
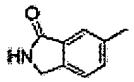
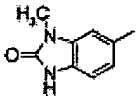
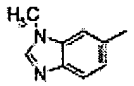
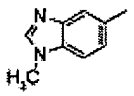
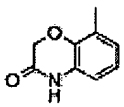
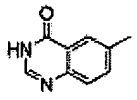
[Tabela 9]

R1-O-(CH2)3-Cl

| Exemplo de referência | R1 | RMN |
|---|---|---|
| 99 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.15-2.30 (2H, m), 3.72 (2H, t, J=6.3 Hz), 3.87 (3H, s), 4.05-4.15 (2H, m), 6.55 (1 H, d, J=1.8 Hz), 7.42 (1H, d, J=1.8 Hz). |
| 100 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.21-2.31(2H, m), 3.70(2H, t, J=6.3Hz), 3.95(3H, s), 4.46(2H, t, J=6.OHz), 6.54(1 H, s) |
| 101 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.21-2.32(2H, m), 3.72(2H, t,, J=6.3Hz), 3.72(2H, s), 3.91(3H, s), 4.24(2H, t, J=5.8Hz), 6.10(1 H, s) |
| 102 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$ ) δppm: 1.39(3H, t, J=7.OHz), 1.39(3H, t, J=7.3Hz), 2.22-2.32(2H, m), 3.71(2H, t,, J=6.3Hz), 4.10(2H, q, J=7.3Hz), 4.24(2H, t, J=5.8Hz), 4.39(2H, q, J=7.OHz), 6.08(1 H, s) |
| 103 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.20-2.29(2H, m), 2.46(3H, s), 3.72(2H, t, J=6.3Hz), 4.12(2H, t, J=5.8Hz), 6.84(1 H, dd,J=2.5Hz, 8.8Hz), 7.13(1 H, d, J=8.8Hz), 8.07(1 H, d, J=2.5Hz) |
| 104 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.13(3H, s), 2.21-2.31(2H, m), 3.76(2H, t, J=6.3Hz), 4.18(2H, t, J=5.8Hz), 5.17(2H, s), 7.19-7.32(2H, m), 8.30(1 H, d, J=2.5Hz) |
| 105 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.27-2.36(2H, m), 3.77(2H, t, J=6.OHz), 4.28(2H, t, J=5.8Hz), 7.33(1H, dd,J=2.5Hz, 8.5Hz), 7.97(1H, dd, J=2.5Hz, 8.5Hz), 8.44(1H, d, J=2.5Hz), 10.00(1H, s) |
| 106 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$ ) δppm: 1.26(3H, t, J=7.3Hz), 2.24-2.34(2H, m), 3.55(2H, dq, J=6.OHz, 7.3Hz), 3.77(2H, t, J=6.3Hz), 4.22(2H, t, J=5.8Hz), 7.29(1 H, dd, J=2.3Hz, 8.8Hz), 7.83(1 H, br), 8.18(1 H, d, J=8.8Hz), 8.20(1 H, d, J=2.3Hz) |
| 107 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.25-2.34(2H, m), 3.77(2H, t,, J=6.3Hz), 4.23(2H, t, J=5.8Hz), 5.48(1 H, br), 7.31(1 H, dd, J=2.3Hz, 8.8Hz), 7.68(1 H, br), 8.16(1 H, d, J=8.8Hz), 8.23(1 H, d, J=2.3Hz) |
| 108 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.24-2.34(2H, m), 3.73(2H, t,, J=6.3Hz), 4.00(3H, s), 4.58(2H, t, J=6.OHz), 8.28(1 H, d, J=1.3Hz), 8.87(1 H, d, J=1.3Hz) |

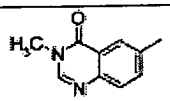
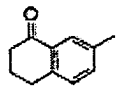
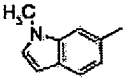
[Tabela 10]

R1-O-(CH2)3-Cl

| Exemplo de referência | R1 | RMN |
|---|---|---|
| 109 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$ ) δppm: 1.44(3H, t, J=7.OHz), 2.22-2.31(2H, m), 3.72(2H, t, J=6.3Hz), 4.48(2H, q, J=7.OHz), 4.59(2H, t, J=6.OHz), 7.44(1 H, d, J=1.OHz), 8.90(1 H, d, J=1.OHz) |
| 110 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 2.70-2.75 (2H, m), 3.07 (2H, t, J=5.8 Hz), 3.74 (2H, t, J=6.4 Hz), 7.15-7.20 (2H, m), 7.37 (1 H, d, J=8.2 Hz). |
| 111 |  | $^1$H-RMN (DMSO-d,) δppm : 2.1-2.2 (2H, m), 3.37 (2H, s), 3.78 (2H, t, J = 6.5Hz),4.04(2H,t,J=6Hz),6.40(1H,d,J=2.5Hz),6.49(1H, dd, J= 2.5, 8Hz ), 7.08 ( 1 H, d, J = 8Hz ), 10.33 ( 1 H, bs ). |
| 112 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.27 (2H, t, J=6.1 Hz), 3.76 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.19 (2H, t, J=5.7 Hz), 4.41 (2H, s), 6.96 (1 H, s), 7.01 (1 H, dd, J=2.2, 8.5 Hz), 7.17 (1 H, brs), 7.77 (1 H, d, J=8.4 Hz). |
| 113 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$ ) δppm: 2.27 (2H, t, J=6.1 Hz), 3.76 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.19 (2H, t, J=5.7 Hz), 4.40 (2H, s), 6.50-6.60 (1H, br), 7.15 (1H, dd, J=2.3, 8.5 Hz), 7.35-7.40 (2H, m). |
| 114 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.20-2.35 (2H, m), 3.39 (3H, s), 3.75-3.80 (2H, m), 4.05-4.15 (2H, m), 6.55-6.65 (2H, m), 6.98 (1 H, d, J=7.5 Hz), 9.92 (1 H, brs). |
| 115 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.28 (2H, t, J=6.0 Hz), 3.75-3.80 (5H, m), 4.18 (2H, t, J=5.7 Hz), 6.85 (1 H, d, J=2.1 Hz), 6.90-6.95 (1H, m), 7.66 (1 H, d, J=8.8 Hz), 7.76 (1 H, s). |
| 116 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 3.78 (2H, t, J=6.9 Hz), 3.82 (3H, s), 4.18 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.97 (1 H, dd, J=2.3, 8.8 Hz), 7.25-7.30 (2H, m), 7.81 (1 H, s). |
| 117 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$) δppm: 2.20-2.35 (2H, m), 3.77 (2H, t, J=6.2 Hz), 4.19 (2H, t, J=6.0 Hz), 4.66 (2H, s), 6.47 (1 H, dd, J=7.9,1.2 Hz), 6.67 (1 H, dd, J=8.3, 1.1 Hz), 6.90 (1 H, dd, J=8.2, 8.1 Hz), 8.29 (1 H, brs). |
| 118 |  | $^1$H-RMN (CDCl$_3$ ) δppm: 2.24 (2H, tt, J = 6.2, 6.2 Hz), 3.70(2H, t, J = 6.4 Hz), 3.77 (3H, s), 4.45 (2H, t, J = 6.1 Hz), 6.70 (1 H, d, J = 8.9 Hz), 6.98 (1 H, dd, J = 8.9, 3.0 Hz), 7.35 (1 H, d, J = 3.0 Hz) |

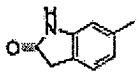
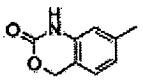
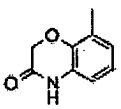
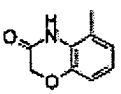
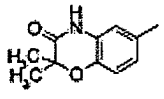
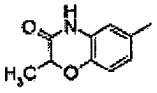
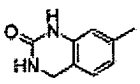
[Tabela 11]

R1-O-(CH2)3-Cl

| Exemplo de referência | R1 | RMN |
|---|---|---|
| 119 |  | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.30 (2H, tt, J = 61, 6.1 Hz), 3.60(3H, s), 3.77(2H, t, J= 6.3 Hz), 4.25 (2H, t, J = 5.8 Hz), 7.34 (1 H, dd, J = 8.9, 2.9 Hz), 7.65 (1 H, d, J = 8.9 Hz), 7.68 (1 H, d, J = 2.9 Hz), 7.96 (1H, s) |
| 120 |  | $^1$H-RMN ($CDCl_3$ ) δppm: 2.12 (2H, tt, J = 6.3, 6.3 Hz), 2.24 (2H, tt, J = 61, 6.1 Hz), 2.62(2H, t, J = 6.5 Hz), 2.902(2H, t, J = 6.1 Hz), 3.74(2H, t, J = 6.3 Hz), 4.15 (2H, t, J = 5.8 Hz), 7.05 (1 H, dd, J = 8.4, 2.8 Hz), 7.17 (1 H, d, J = 8.4 Hz), 7.52 (1 H, d, J = 2.8 Hz) |
| 121 |  | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 2.25 (2H, tt, J = 6.1, 6.1 Hz), 3.76 (3H, s), 3.78(2H, t, J=6.4Hz), 4.15(2H, t, J=5.8Hz), 6.39(1 H, t, J= 3.OHz),6.88(1H, dd, J = 8.8, 2.4 Hz), 7.02 (1 H, d, J = 3.0 Hz), 7.10 (1 H, d, J = 2.3 Hz), 7.21 (1 H, d, J = 8.8 Hz) |

[Tabela 12]

R1-O-(CH2)3-Cl

| Exemplo de referência | R1 | RMN |
|---|---|---|
| 122 |  | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.85-2.05 (4H, m), 3.62 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.33 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.72 (1 H, d, J=8.3 Hz), 6.85 (1H, dt, J=0.8, 5.1 Hz), 7.56 (1 H, dt, J=2.0, 8.4 Hz), 8.14 (1 H, dd, J=5.1, 1.4 Hz). |
| 123 |  | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.95-2.05 (4H, m), 3.62 (2H, t, J=6.2 Hz), 4.05 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.80 (2H, dd, J=4.8, 1.6 Hz), 8.43 (2H, dd, J=4.9, 1.5 Hz). |
| 124 |  | $^1$H-RMN (DMSO-d,) bppm : 1.75-1.9 (4H, m), 3.36 (2H, s), 3.70 (2H, t, J = 6.5Hz ), 3.96 (2H, t, J = 6Hz ), 6.38 ( 1 H, d, J = 2Hz ), 6.48 ( 1 H, dd, J = 2.5, 8Hz ), 7.07 ( 1 H, d, J = 8Hz ), 10.32 ( 1 H, bs ). |
| 125 |  | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.91-2.00 (4H, m), 3.62 (2H, t, J=6.2 Hz), 3.98 (2H, t, J=5.6 Hz), 5.26 (2H, s), 6.36 (1 H, d, J=2.3 Hz), 6.57 (1 H, dd, J=, 8.4, 2.3 Hz), 7.00 (1 H, d, J=8.4 Hz), 8.08 (1 H, br-s) |
| 126 |  | $^1$H-RMN (111$I_3$) bppm: 1.95-2.04 (4H, m), 3.61-3.65 (2H, m), 4.06-4.09 (2H, m), 4.66 (2H, s), 6.46 (1H, d, J=8.0 Hz), 6.63 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.89 (1 H, dd, J=8.0, 8.3 Hz), 8.41 (1H, br) |
| 127 |  | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.80-2.00 (4H, m), 3.77 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.24 (2H, t, J=5.8 Hz), 4.63(2H, s), 6.55-6.70 (2H, m), 6.90 (1H, dd, J=8.4, 8.4 Hz), 8.00 (1 H, brs). |
| 128 |  | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) δppm: 1.52 (6H, s), 1.90-2.10 (4H, m), 3.63 (2H, t, J=6.3 Hz), 3.95 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.38 (1H, d, J=2.8 Hz), 6.50 (1H, dd, J=2.8, 8.7 6.86 (1 H, d, J=8.8 Hz), 8.57 (1 H, brs). |
| 129 |  | $^1$H-RMN ($CDCl_3$) 5ppm: 1.56 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-2.10 (4H, m), 3.61 (2H, t, J=6.2 Hz), 3.94 (2H, t, J=5.8 Hz), 4.59 (1H, q, J=6.8 Hz), 6.38 (1H, d, J=2.8 Hz), 6.49 (1 H, dd, J=2.8, 8.7 Hz), 6.88 (1 H, d, J=8.7 Hz), 8.60 (1 H, |
| 130 |  | $^1$H-RMN (DMSO-$d_6$) 5ppm : 1.81-2.10 (4H, m), 3.54-3.70 (2H, m), 3.89-4.03 (2H, m), 4.47 ( 2H, brs ), 5.02 ( 1 H, brs ), 6.22 ( 1 H, d, J = 2.4 Hz ), 6.49 ( 1H, dd, J = 8.3, 2.4 Hz ), 6.86-7.00 (2H, m). |

Exemplo 1

Síntese de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-

1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metila

5-(3-cloropropóxi)-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metila (1,17g, 5,0 mmol), cloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazina (1,35 g, 5,3 mmol), carbonato de potássio (1,74, 12,6 mmol) e iodeto de sódio (0,75 g, 5,0 mmol) foram adicionados a DMF (12 mL), e a mistura foi agitada a 80 °C por 3 horas. A solução de reação foi resfriada para temperatura ambiente e água foi adicionada a ela, e então, extraída com acetato de etila. A fase orgânica foi lavada com água e seca sobre sulfato de magnésio. A solução de reação foi concentrada em baixa pressão e o resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 7:3 → diclorometano: metanol =100:3). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão para obter uma substância oleosa amarela clara (1,97 g). A substância oleosa foi deixada em repouso ainda em temperatura ambiente para obter uma substância sólida, que foi lavada com éter diisopropílico e seca para obter 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metila (1,49 g).

Ponto de fusão: 109,0-110,5 °C

MS 414 ($M^+$)

Exemplo 2

Síntese de ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico

Uma solução de hidróxido de sódio aquosa 6 N (2 mL) foi adicionada a uma solução de etanol (10 mL) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de metila (1,62 g, 3,9 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 4 dias. Então, ácido clorídrico 6 N (2 mL) foi adicionado à solução de reação mediante resfriamento em gelo e a mistura de solução foi agitada. Diclorometano foi adicionado à solução de reação e o precipitado foi obtido por filtração. O filtrado foi separado e a fase orgânica foi concentrada em baixa pressão. A

torta do filtro e o resíduo foram combinados, lavados com água e secos para obter ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico (1,53 g) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 114,5-118,0 °C

Exemplo 3

Síntese de cloridrato de N-metil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)]propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxamida

Uma solução DMF de ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico (0,3 g, 0,75 mmol) foi resfriada em gelo e trietil amina (0,73 mL, 5,2 mmol), cloridrato de metil amina (0,3 g, 4,5 mmol) e fosforocianidato de dietila (DEPC)(0,25 mL, 1,4 mmol) foram adicionados a ela, e então, a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 24 horas. À solução de reação, trietil amina (0,73 mL, 5,2 mmol), cloridrato de metil amina (0,3 g, 4,5 mmol) e DEPC (0,25 mL, 1,4 mmol) foram adicionados e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 4 dias. Água foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com acetato de etila. O material extraído foi lavado com água e seca sobre sulfato de magnésio. A solução foi concentrada em baixa pressão e o resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 5:1 → acetato de etila). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em acetato de etila e uma solução de ácido clorídrico 4 N/acetato de etila foi adicionada a ele. O material insolúvel precipitado foi obtido por filtração e seco para obter cloridrato de N-metil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxamida (0,24 g) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 228,0-232,5 °C (dec)

Exemplo 4

Síntese de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxamida

O composto título foi obtido usando 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico ácido e cloreto de amônio da mesma maneira que no exemplo 3.

Pó branco (acetato de etila-éter diisopropílico)

Ponto de fusão: 186,5-188,5 °C

Exemplo 5

Síntese de 4-[3-4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5,N-dimetil benzamida

O composto título foi obtido usando 4-(3-cloropropóxi)-3-metóxi-5,N-dimetil benzamida e cloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina da mesma maneira que no exemplo 1.

Pó branco (acetato de etila-metanol)

Ponto de fusão: 141,5-142,5 °C

Exemplo 6

Síntese de cloridrato de N-metil-2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]tiazol-4-carboxamida

Hidreto de sódio (55 %, oleoso, 90 mg, 2,2 mmol) foi adicionado a uma solução de DMF (2 mL) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propanol (0,2 g, 0,7 mmol) e N-metil-2-clorotiazol-4-carboxamida (0,26 g, 1,45 mmol) mediante resfriamento em gelo e a solução foi agitada a 80 °C por 1,5 horas. Depois que a solução de reação foi resfriada para temperatura ambiente e água foi adicionada a ela, ela foi extraída com acetato de etila. A solução de extração com acetato de etila foi lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio e concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: acetato de etila = 5:1 → acetato de etila). Depois que o produto purificado foi concentrado em baixa pressão, o resíduo foi dissolvido em acetato de etila. Uma solução de ácido clorídrico 4 N/acetato de etila foi adicionada à solução e o material insolúvel precipitado foi obtido por filtração

e seco para obter cloridrato de N-metil-2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]tiazol-4-carboxamida (0,24 g) na forma de um pó amarelo claro.

Ponto de fusão: 199,5-202,5 °C

Exemplo 7

Síntese de 2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]tiazol-4-carboxamida

O composto título foi obtido usando 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propanol (0,2 g, 0,7 mmol) e 2-clorotiazol-4-carboxamida da mesma maneira que no exemplo 6.

Pó branco (acetato de etila-éter diisopropílico)

Ponto de fusão: 139,5-140,5 °C

Exemplo 8

Síntese de éster terc-butílico do ácido {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}-carbâmico

O composto título foi obtido usando éster terc-butílico do ácido [4-(3-cloropropóxi)-3-metóxi-5-metil fenil]-carbâmico e cloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina da mesma maneira que no exemplo 1.

Substância oleosa marrom claro

RMN-$^1$H (CDCl3) δppm: 1,51(9H, s), 1,95-2,10 (2H, m), 2,24(3H, s), 2,66-2,81(6H, m), 3,14-3,31(2H, m), 3,84(3H, s), 3,95(2H, t, J=6,3Hz), 6,36(1H, br), 6,60(1H, d, J=2,5Hz), 6,87-6,92(1H, m), 7,01 (1H, d, J=2,0Hz), 7,24-7,31(1H, m), 7,37-7,44(2H, m), 7,55(1H, d, J=8,0Hz)

MS 511(M+).

Exemplo 9

Síntese de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metilanilina

Ácido clorídrico 6 N (3 mL) foi adicionado a uma solução de metanol (10 mL) de éster terc-butílico do ácido {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}-carbâmico (2,18 g, 4,3 mmol)

e a mistura foi agitada em temperatura ambiente durante toda a noite. Depois de agitada a 60 °C por 15 minutos, a mistura foi resfriada para temperatura ambiente e uma solução de hidróxido de sódio aquosa 6 N foi adicionada a ela para neutralizá-la. Diclorometano foi adicionado à mistura de reação, e a substância extraída com diclorometano foi seca sobre sulfato de magnésio e concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (n-hexano: acetato de etila = 3:2 → acetato de etila). O produto purificado foi concentrado até secura em baixa pressão para obter 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metilanilina (1,26 g) na forma de um sólido amarelo claro

Ponto de fusão: 155,0-158,0 °C

MS 411 ($M^+$)

Exemplo 10

Síntese de cloridrato de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}formamida

4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metilanilina (0,9 g, 2,2 mmol) foi adicionado a formato de etila (10 mL) e refluxado com aquecimento por 33 horas. Depois que a solução de reação foi resfriada para temperatura ambiente, ela foi concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 5:1 → acetato de etila). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e uma solução de ácido clorídrico 4 N/acetato de etila foi adicionado a uma solução de acetato de etila do resíduo. O material insolúvel precipitado foi obtido por filtração para obter cloridrato de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}formamida (0,3 g) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 247,5-253,0 °C (dec)

Exemplo 11

Síntese de cloridrato de N-metil-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-

piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metilanilina

Uma solução de cloridrato de sódio aquosa 6 N foi adicionada a cloridrato de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil formamida (0,23 g, 0,48 mmol) e a mistura de solução foi extraída com diclorometano. A solução de extração com diclorometano foi seca sobre sulfato de magnésio e concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi dissolvido em uma solução de tetraidrofurano (THF) (5 mL) e hidreto de alumínio e lítio (30 mg, 0,71 mmol) foi adicionado a ela mediante resfriamento em gelo e refluxado com aquecimento por 15 minutos. A solução de reação foi resfriada em gelo e água (0,03 mL), solução de hidróxido de sódio aquosa 15 % (0,03 mL), e água (0,09 mL) foram adicionados à mistura de reação nesta ordem e agitados. O material insolúvel foi removido por filtração, e o filtrado foi concentrado em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 5:1 → 3:1) e concentrado em baixa pressão. Uma solução de ácido clorídrico 4 N/acetato de etila foi adicionada a uma solução de acetato de etila do resíduo, e o material insolúvel precipitado foi obtido por filtração para obter cloridrato de N-metil-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metilanilina (63 mg) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 239,5-244,0 °C (dec)

Exemplo 12

Síntese de cloridrato de 3-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}oxazolidin-2-ona

O composto título foi obtido usando cloridrato de 3-[4-(3-cloropropóxi)-3-metóxi-5-metil fenil]oxazolidin-2-ona e 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina da mesma maneira que no exemplo 1.

Pó branco (etanol)

Ponto de fusão: 247,5-251,0 °C (dec)

Exemplo 13

Síntese de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}acetamida

O composto título foi obtido usando N-[4-(3-cloropropóxi)-3-metóxi-5-metil fenil]acetamida e cloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina da mesma maneira que no exemplo 1.

Pó branco (acetato de etila-éter diisopropílico)

Ponto de fusão: 121,5-122,0 °C

Exemplo 14

Síntese de cloridrato de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}-N-metil acetamida

Hidreto de sódio (55 %, oleoso, 0,06 g, 1,3 mmol) foi adicionado a uma solução de DMF (5 mL) de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}acetamida (0,45 g, 0,99 mmol) mediante resfriamento em gelo e a mistura foi agitada a 0 °C por 15 minutos. Iodeto de metila (0,07 mL, 1,1 mmol) foi adicionado à solução de reação e a solução foi agitada a 0 °C por uma hora. Adicionalmente, hidreto de sódio (55 % oleoso, 0,06 g, 1,3 mmol) e iodeto de metila (0,07 mL, 1,1 mmol) foram adicionados à solução de reação e a mistura de solução foi agitada a 0 °C por 2 horas. Água foi adicionada à solução de reação e extração foi realizada com acetato de etila. O material extraído foi lavado com água, e seco sobre sulfato de magnésio. A solução de reação foi concentrada em baixa pressão e o resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 5:1 → acetato de etila). Depois que o produto purificado foi concentrado em baixa pressão, uma solução de ácido clorídrico 4 N/acetato de etila foi adicionada uma solução de acetato de etila do resíduo. O material insolúvel precipitado foi obtido por filtração para obter cloridrato de N-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}-N-metil acetamida (325 mg).

Ponto de fusão: 230,0-234,0 °C (dec)

Exemplo 15

Síntese de cloridrato de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-N,N-dimetil-3-metóxi-5-metilanilina

Formalina (37%, 0,29 mL, 3,9 mmol) e cianoboroidreto de sódio (0,21 g, 3,1 mmol) foram adicionados a uma solução de metanol (6 mL) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metilanilina (0,32 g, 0,78 mmol) mediante resfriamento em gelo e a mistura foi agitada a 0 °C por 15 minutos. À solução de reação, ácido acético (0,18 mL, 3,1 mmol) foi adicionado e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por uma hora. Uma solução de carbonato de potássio aquosa foi adicionada à solução de reação mediante resfriamento em gelo, e extração foi realizada com acetato de etila. O material extraído foi seco sobre sulfato de magnésio. A solução de reação foi concentrada em baixa pressão, e o resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano:acetato de etila = 11:1 → 3:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão. Uma solução de ácido clorídrico 4 N e acetato de etila foi adicionado a uma solução de acetato de etila do resíduo e o material insolúvel precipitado foi obtido por filtração para obter cloridrato de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-N,N-dimetil-3-metóxi-5-metilanilina (137 mg) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 234,5-240,5 °C (dec)

Exemplo 16

Síntese de {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}carbamato cloridrato de metila

O composto título foi obtido usando 4-(3-cloropropóxi)-3-metóxi-5-metil fenil]carbamato de metila e cloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-piperazina da mesma maneira que no exemplo 1.

Pó branco (acetato de etila)

Ponto de fusão: 230,0-235,5 °C

Exemplo 17

Síntese de cloridrato de N-metil-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}carbamato de metila

O composto título foi obtido usando cloridrato de {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}carbamato de metila e iodeto de metila da mesma maneira que no exemplo 14.

Pó branco (acetato de etila)

Ponto de fusão: 228,0-233,5 °C

Exemplo 18

Síntese de cloridrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3,4-diidro-2H-benzo[1,4]oxazina

Hidreto de alumínio e lítio (86 mg, 2,3 mmol) foi suspenso em THF (20 mL). A esta solução, uma solução de THF (10 mL) de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3,4-diidro-2H-benzo[1,4]oxazin-3-ona (0,8 g, 1,9 mmol) foi adicionada gota-a-gota em uma atmosfera de argônio. Depois de completa a adição gota-a-gota, a mistura de solução foi refluxada com aquecimento por uma hora. Água (0,1 mL), solução de hidróxido de sódio aquosa 15 % (0,1 mL), e água (0,3 mL) foram adicionados à mistura de reação mediante resfriamento em gelo e agitados. O material insolúvel foi removido por filtração em celite, e o filtrado foi concentrado em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: metanol = 1:0 → 20:1) e concentrado em baixa pressão. O resíduo foi dissolvido em acetato de etila (10 mL) e uma solução (0,34 mL) de ácido clorídrico 1 N/etanol foi adicionado a ele e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 15 minutos. O material insolúvel precipitado foi obtido por filtração, lavado com acetato de etila, e seco para obter cloridrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3,4-diidro-2H-benzo[1,4]oxazina (0,11 g) na forma de um sólido branco.

Ponto de fusão 207,9-208,8 °C

Exemplo 19

Síntese de cloridrato de 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3,4-diidro-2H-benzo[1,4]oxazina

O composto título foi obtido usando 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3,4-diidro-2H-benzo[1,4]oxazin-3-ona da mesma maneira que no exemplo 18.

Sólido marrom claro (acetato de etila)

Ponto de fusão: 214,0-215,9 °C

Exemplo 20

Síntese de cloridrato de 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-4-metil-3,4-diidro-2H-benzo[1,4]oxazina

Formalina (37%, 0,22 mL, 2,7 mmol) e MP-cianoboroidreto (2,41 mmol/g, 1,12 g, 2,7 mmol) foram adicionados a uma solução de metanol (15 mL) de 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3,4-diidro-2H-benzo[1,4]oxazina (0,30 g, 0,67 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente durante toda a noite. O material insolúvel foi removido por filtração e o filtrado foi concentrado em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: metanol = 1:0 → 50:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em acetato de etila (15 mL) e uma solução (0,64 mL) de ácido clorídrico 1 N/etanol foi adicionado a ele. A mistura foi agitada em temperatura ambiente por 15 minutos. O material insolúvel precipitado foi obtido por filtração, lavado com acetato de etila, e seco para obter cloridrato de 7-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-4-metil-3,4-diidro-2H-benzo[1,4]oxazina (0,23 g) na forma de sólido marrom claro.

Ponto de fusão; 248,1-249,6 °C

Exemplo 21

Síntese de cloridrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metil-1,2,3,4-tetraidroquinazolin-4-ol e cloridrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metil-1,2,3,4-tetraidroquinazolina

Uma solução de THF (20 mL) de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metil quinazolina (0,25 g, 0,58 mmol) foi resfriada em gelo. A esta solução, uma solução de THF (5 mL) de hidreto de alumínio e lítio (26 mg, 0,69 mmol) foi adicionada gota-a-gota em uma atmosfera de argônio. Depois de completa a adição gota-a-gota, a solução foi agitada em temperatura ambiente por 20 minutos e refluxada com aquecimento por uma hora. Água (0,03 mL), solução de hidróxido de sódio aquosa 15 % (0,03 mL), e água (0,1 mL) foram adicionados à solução de reação mediante resfriamento em gelo e agitados. Material insolúvel foi removido por filtração em celite, e o filtrado foi concentrado em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: metanol = 1:0 → 25:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em acetato de etila (5 mL). A isto, uma solução (0,189 mL) de ácido clorídrico 1 N/etanol foi adicionada e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 15 minutos. O material insolúvel precipitado foi obtido por filtração, lavado com acetato de etila, e seco para obter cloridrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metil-1,2,3,4-tetraidroquinazolin-4-ol (87 mg) na forma de um sólido branco.

MS: 438 ($M^+$).

Uma solução de eluição de diclorometano/metanol (10:1) foi passada através da coluna de cromatografia em coluna de sílica gel. O eluato obtido foi concentrado em baixa pressão e então o resíduo foi dissolvido em acetato de etila (5 mL). A isto, uma solução (0,226 mL) de ácido clorídrico 1 N/etanol foi adicionada e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 15 minutos. O material insolúvel precipitado foi obtido por filtração, lavado

com acetato de etila, e seco para obter cloridrato de 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metil-1,2,3,4-tetraidroquinazolina (49 mg) na forma de um sólido branco.

Ponto de fusão: 203,1-204,4 °C

Exemplo 22

Síntese de cloridrato de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-2,3-diidro-1H-indol

Trietilsilano (1,14 mL, 7,14 mmol) foi adicionado a uma solução de ácido trifluoracético (5 mL) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1H-indol (228 mg, 0,71 mmol) e a mistura foi agitada a 50 °C por 2 horas. A mistura foi concentrada em baixa pressão. O resíduo foi dissolvido em diclorometano, neutralizado por uma solução aquosa saturada de hidrogeno carbonato de sódio e separado. A fase orgânica foi lavada com uma solução aquosa saturada de hidrogeno carbonato de sódio, água e uma solução de salina saturada nesta ordem e concentrada em baixa pressão. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 5:1 → 1:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi adicionado a acetato de etila (5 mL) e uma solução de ácido clorídrico 1 N/etanol (0,10 mL) foi adicionada a ele e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 15 minutos. O material insolúvel precipitado foi obtido por filtração, lavado com acetato de etila, e seco para obter cloridrato de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-2,3-diidro-1H-indol (32 mg) na forma de um sólido branco.

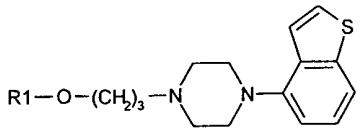
Ponto de fusão: 222,4-223,9 °C

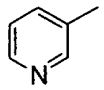
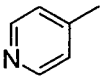
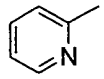
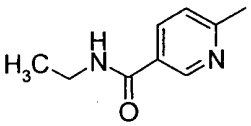
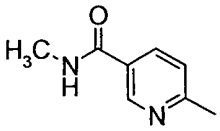
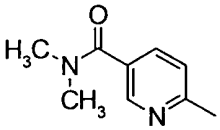
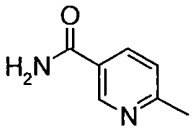
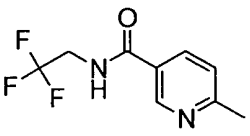
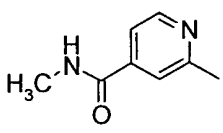
Os compostos listados nas seguintes tabelas 13 a foram produzidos usando substâncias de partida apropriadas da mesma maneira que nos exemplos referência 1 a 36 ou exemplos 1 a 22 e 3094 a 3110,

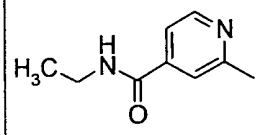
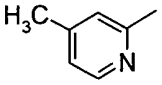
Nas seguintes tabelas, os compostos com as propriedades físicas, tais como forma cristalina, m.p. (ponto de fusão), sal, RMN-$^1$H e EM

(espectro de massa), foram preparados de fato.

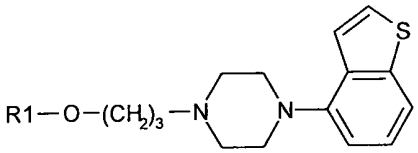
[Tabela 13]

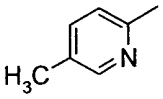
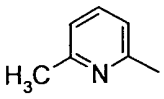
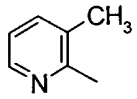
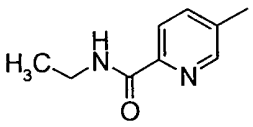
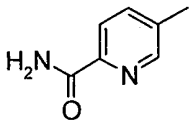
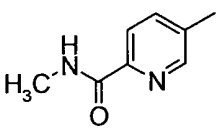
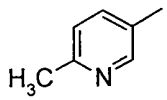
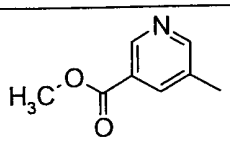


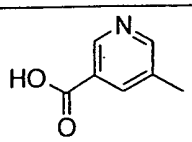
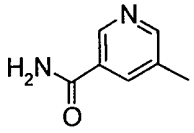
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 23 |  | Sólido branco (Etanol) | 225-228 | TriCloridrato |
| 24 |  | Cristal na forma de agulha branco (Etanol/acetato de etila) | 165,0-167,0 | Cloridrato |
| 25 |  | Sólido branco (Etanol) | 204-206 | Cloridrato |
| 26 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 201,5-207,5 | Cloridrato |
| 27 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 132,5-133,5 | – |
| 28 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 205,5-208,0 | Cloridrato |
| 29 |  | Pó branco (2-propanol) | 206,5-208,0 | – |
| 30 |  | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 201,5-204,0 | Cloridrato |
| 31 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 155,5-162,0 | Cloridrato |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 32 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 140,0-141,5 | Cloridrato |
| 33 |  | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 192-194 | Dicloridrato |

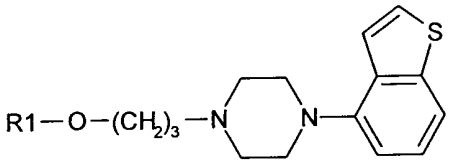
[Tabela 14]

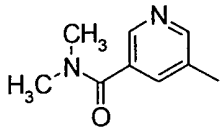
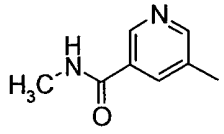
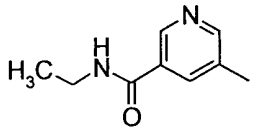
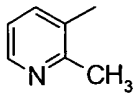
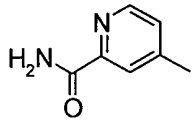
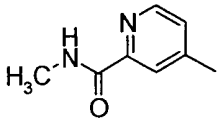
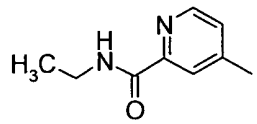


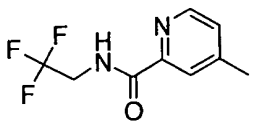
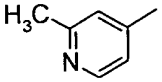
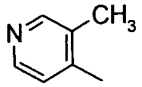
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 34 |  | Pó amarelo claro (Etanol) | 201-203 | Dicloridrato |
| 35 |  | Pó branco (Etanol) | 201-203 | Cloridrato |
| 36 |  | Pó branco (Etanol) | 214,0-215,0 | Cloridrato |
| 37 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 131,5-132,0 | – |
| 38 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 193,0-194,0 | – |
| 39 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 128,0-129,5 | – |
| 40 |  | Pó branco (Etanol) | 234,0-236,0 | Cloridrato |
| 41 |  | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 224,0-226,0 | Dicloridrato |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 42 |  | Pó branco (água) | 230,0 (dec) | Cloridrato |
| 43 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 171,0-174,5 | — |

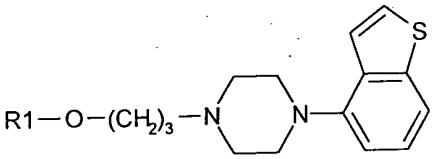
[Tabela 15]

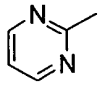
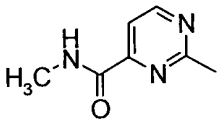
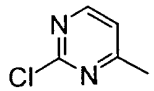
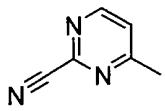
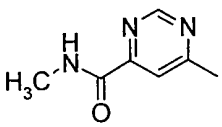
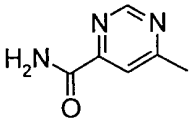
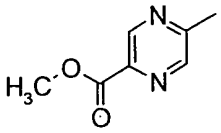


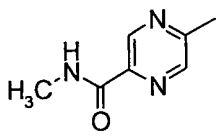
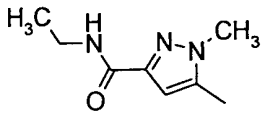
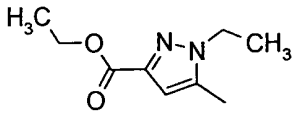
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 44 |  | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 166,0 (dec) | Dicloridrato |
| 45 |  | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 198,5-204,0 | Dicloridrato |
| 46 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 211,5-214,5 | Dicloridrato |
| 47 |  | Pó branco (Etanol) | 241,0-243,0 | Cloridrato |
| 48 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 150,0-150,5 | — |
| 49 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 199,0-200,5 | Dicloridrato |
| 50 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 206,0-208,5 | Cloridrato |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 51 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 208,0-213,0 | Cloridrato |
| 52 |  | Pó branco (Etanol) | 157-159 | Cloridrato |
| 53 |  | Pó branco (Etanol) | 197,0-199,0 | Dicloridrato |

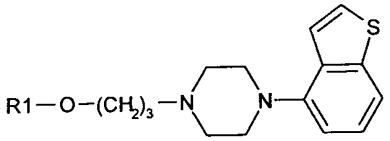
[Tabela 16]

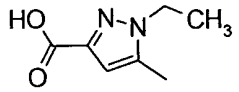
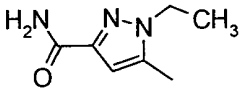
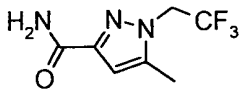
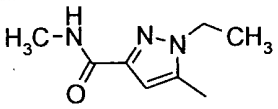
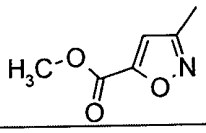
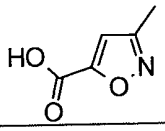
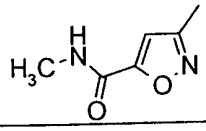
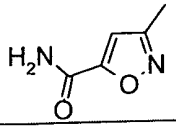


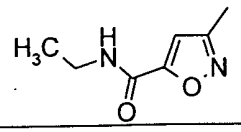
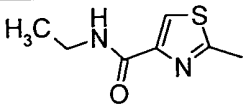
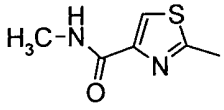
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 54 |  | Pó branco (Etanol) | 205-207 | Cloridrato |
| 55 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 178,0-182,5 | Cloridrato |
| 56 |  | Pó amarelo claro (acetato de etila) | 191,5-195,5 | Cloridrato |
| 57 |  | Pó amarelo claro (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 112,0-115,5 | -- |
| 58 |  | Pó branco (Metanol) | 205,0-209,5 | Cloridrato |
| 59 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 149,5-151,0 | -- |
| 60 |  | Pó amarelo claro (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 114,5-115,5 | -- |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 61 |  | Pó branco (Metanol) | 116,5-118,0 | -- |
| 62 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 210,5-214,5 | Cloridrato |
| 63 |  | Pó amarelo claro (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 109,0-110,0 | -- |

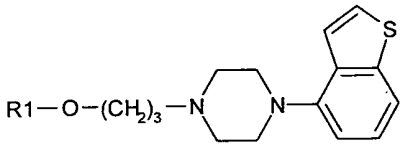
[Tabela 17]

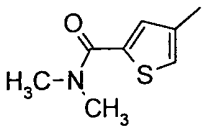
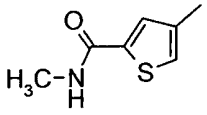
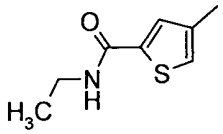
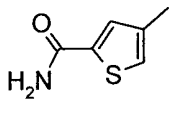


| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 64 |  | Pó branco (Etanol/água) | 129,0-131,0 | -- |
| 65 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 247,5 (dec) | Cloridrato |
| 66 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 231,0-234,0 | Cloridrato |
| 67 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 245,5 (dec) | Cloridrato |
| 68 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 199,5-201,5 | Cloridrato |
| 69 |  | Pó branco (Etanol/água) | 252,5-255,0 (dec) | -- |
| 70 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 131,5-132,5 | -- |
| 71 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 167,5-169,0 | -- |

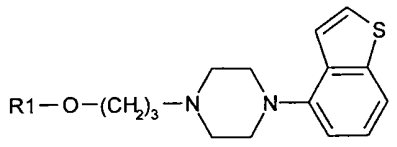
| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 72 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 219,5-222,5 (dec) | Cloridrato |
| 73 |  | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 151,0-153,5 | Cloridrato |
| 74 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 138,5-140,0 | -- |

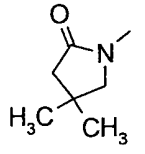
[Tabela 18]



| Exemplo | R1 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|
| 75 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 2,10-2,30 (2H, m), 2,80-3,90 (16H, m), 4,09 (2H, t, J=5,9 Hz), 6,88 (1H, d, J=1,5 Hz), 6,96 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,17 (1H, d, J=1,4 Hz), 7,31 (1H, dd, J=7,8, 7,8 Hz), 7,48 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,70 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,76 (1H, d, J=5,6 Hz), 10,68 (1H, brs). | Cloridrato |
| 76 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,62 (2H, t, J=7,0 Hz), 2,65-2,80 (4H, m), 2,98 (3H, d, J=4,9 Hz), 3,15-3,25 (4H, m), 4,05 (2H, t, J=6,3 Hz), 5,94 (1H, brs), 6,43 (1H, d, J=1,8 Hz), 6,90 (1H, dd, J=1,4, 7,6 Hz), 7,15 (1H, d, J=1,7 Hz), 7,20-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz). | |
| 77 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,23 (3H, t, J=7,3 Hz), 1,95-2,05 (2H, m), 2,61 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,65-2,80 (4H, m), 3,10-3,30 (4H, m), 3,40-3,55 (2H, m), 4,04 (2H, t, J=6,3 Hz), 6,01 (1H, brs), 6,43 (1H, d, J=1,6 Hz), 6,90 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,16 (1H, d, J=1,7 Hz), 7,27 (1H, dd, J=7,8, 7,8 Hz), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz). | |
| 78 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,63 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,70-2,80 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 4,06 (2H, t, J=6,3 Hz), 5,74 (2H, brs), 6,51 (1H, d, J=1,7 Hz), 6,90 (1H, dd, J=0,5, 7,6 Hz), 7,19 (1H, d, J=1,7 Hz), 7,28 (1H, dd, J=7,8, 7,8 Hz), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J=8,0 Hz). | |

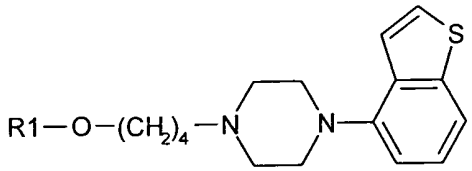
[Tabela 19]

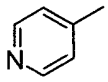
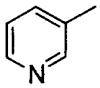
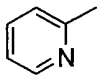
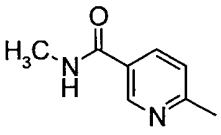
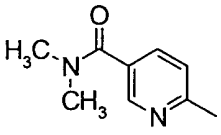
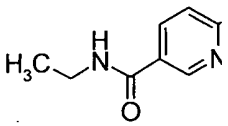
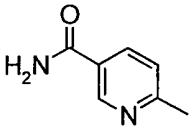
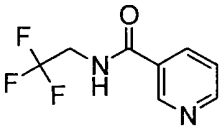
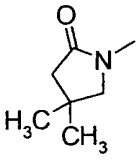


| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 79 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 183-186 | Cloridrato |

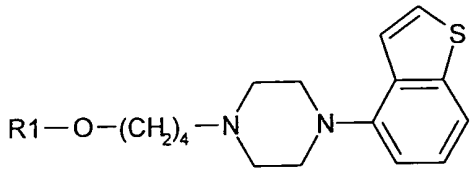
5

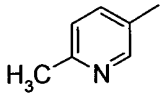
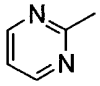
[Tabela 20]



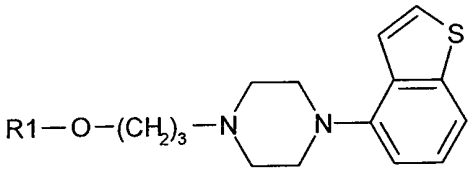
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 80 |  | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 183,0-185,0 | Dicloridrato |
| 81 |  | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 205,0-207,0 | Cloridrato |
| 82 |  | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 197,0-199,0 | Cloridrato |
| 83 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 166,5-168,0 | Cloridrato |
| 84 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 196,0-201,0 | Cloridrato |
| 85 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 175,0-176,0 | Cloridrato |
| 86 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 150,0-154,5 | – |
| 87 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 172,0-175,0 | Cloridrato |
| 88 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 201-205 | Cloridrato |

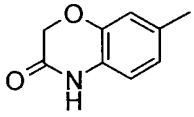
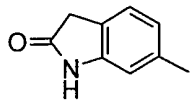
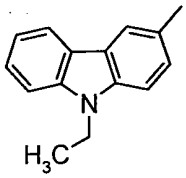
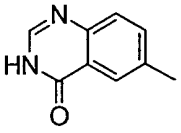
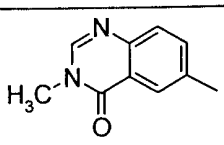
[Tabela 21]

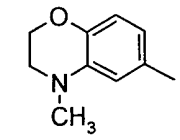
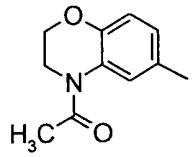
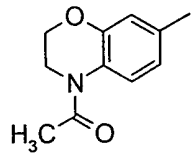


| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 89 |  | Pó branco (Etanol) | 195-197 | Cloridrato |
| 90 |  | Pó branco (Etanol) | 190-192 | Cloridrato |

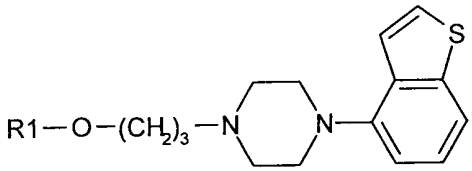
[Tabela 22]

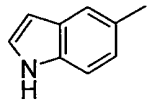
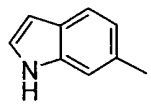
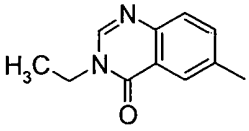
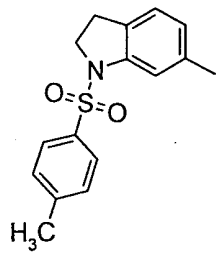
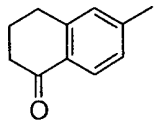


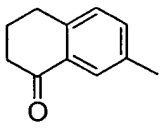
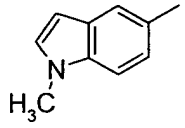
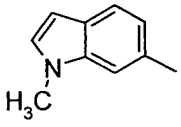
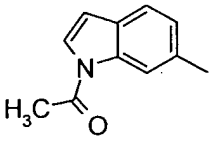
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 91 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 149-150 | – |
| 92 |  | Pó rosa claro (Etanol) | 161-163 | – |
| 93 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 226,8-229,0 | Cloridrato |
| 94 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 213,1-218,5 | – |
| 95 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 252,9-254,3 | Cloridrato |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 96 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 238,7-239,9 | Cloridrato |
| 97 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 238,9-240,7 | Cloridrato |
| 98 |  | Sólido marrom claro (Acetato de etila) | 218,4-220,4 | Cloridrato |

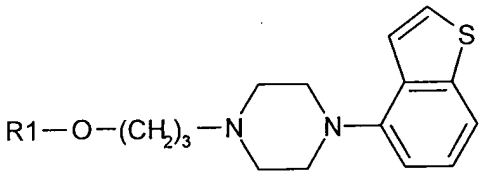
[Tabela 23]

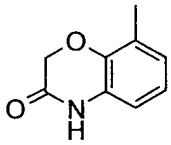
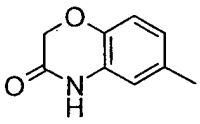
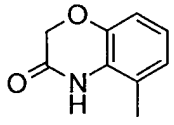
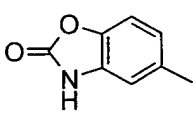


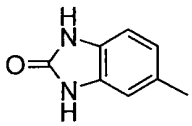
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 99 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 267,0-271,0 | Cloridrato |
| 100 |  | Sólido branco (Acetato de etila/ hexano) | 143,8-145,2 | – |
| 101 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 250,6-252,1 | Cloridrato |
| 102 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 233,3-235,2 | Cloridrato |
| 103 |  | Sólido branco (Etanol/ acetato de etila) | 251,1-253,6 | Cloridrato |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 104 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 249,8-252,3 | Cloridrato |
| 105 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 255,1-256,6 | Cloridrato |
| 106 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 207,9-208,7 | Cloridrato |
| 107 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 214,5-216,8 | Cloridrato |

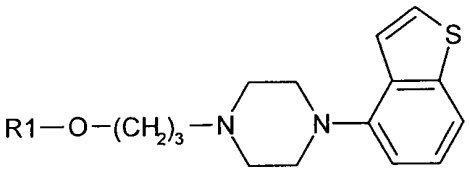
[Tabela 24]

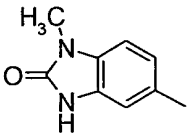
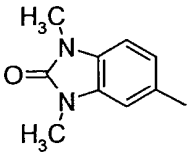
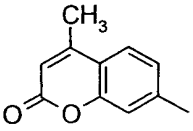
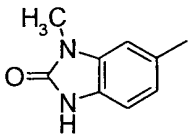


| Exemplo | R1 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|
| 108 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 2,04-2,13 (2H, m), 2,65 (2H, t, J=7,2 Hz), 2,73 (4H, br), 3,19 (4H, br), 4,15 (2H, t, J=6,6 Hz), 4,67 (2H, s), 6,42 (1H, dd, J=1,3, 8,0 Hz), 6,69 (1H, dd, J=1,3, 8,3 Hz), 6,87-6,92 (2H, m), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,42 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,84 (1H, br) | -- |
| 109 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,80-2,00 (2H, m), 2,45-2,55 (2H, m), 2,55-2,65 (4H, br), 3,00-3,10 (4H, br), 3,93 (2H, t, J=6,3 Hz), 4,47 (2H, s), 6,45-6,55 (2H, m), 6,80-6,90 (2H, m), 7,26 (1H, t, J=7,8 Hz), 7,38 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,60 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,67 (1H,d, J=5,5 Hz), 10,59 (1H, s) | -- |
| 110 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 2,06 (2H, quint, J=6,5 Hz), 2,66 (2H, t, J=6,9 Hz), 2,70-2,80 (4H, m), 3,20-3,25 (4H, m), 4,12 (2H, t, J=6,1 Hz), 4,60 (2H, s), 6,55-6,70(2H, m), 6,88 (1H, d, J=8,3 Hz), 6,91 (1H, d, J=8,3 Hz), 7,20-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz), 8,43 (1H, brs) | -- |
| 111 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,80-1,90 (2H, m), 2,41 (2H, t, J=6,6 Hz), 2,50-2,55 (4H, m), 2,95-3,00 (4H, m), 3,83 (2H, t, J=6,7 Hz), 6,47 (1H, dd, J=2,4, 8,6 Hz), 6,70 (1H, d, J=2,4 Hz), 6,85 (1H, d, J=7,5 Hz), 7,09 (1H, d, J=8,6 Hz), 7,27 (1H, dd, J=7,9, 7,9 Hz), 7,36 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,60 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,67 (1H, d, J=5,6 Hz), 9,46 (1H, brs). | -- |

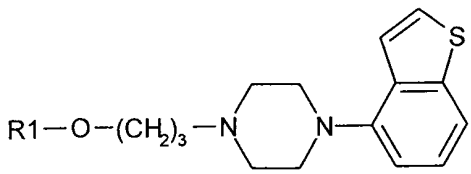
| | | | |
|---|---|---|---|
| 112 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,88 (2H, t, J=6,8 Hz), 2,50-2,55 (2H, m), 2,60 (4H, brs), 3,06 (4H, brs), 3,95 (2H, t, J=6,4 Hz), 6,45-6,55 (2H, m), 6,78 (1H, d, J=9,1 Hz), 6,88 (1H, d, J=7,7 Hz), 7,26 (1H, dd, J=7,8, 7,8 Hz), 7,39 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,55-7,70 (2H, m), 10,35 (1H, brs), 10,49 (1H, brs). | -- |

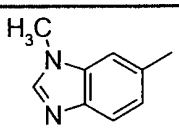
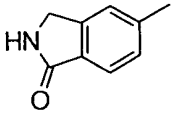
[Tabela 25]

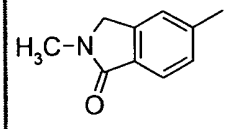


| Exemplo | R1 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|
| 113 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 2,20-2,30 (2H, m), 2,45-2,55 (2H, m), 3,00-3,80 (11H, m), 4,06 (2H, t, J=5,9 Hz), 6,60-6,70 (2H, m), 6,90-7,00 (2H, m), 7,33 (1H, dd, J=7,9, 7,9 Hz), 7,50 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,71 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,78 (1H, d, J=5,5 Hz), 10,67 (1H, brs), 10,81 (1H, brs). | Dicloridrato |
| 114 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 2,00-2,10 (4H, m), 2,70-2,85 (6H, m), 3,20-3,25 (4H, m), 3,40 (6H, s), 4,097 (2H, t, J=6,3 Hz),6,61 (1H, d, J=2,2 Hz), 6,68 (1H, dd, J=2,3, 8,4 Hz), 6,85 (1H, d, J=8,5 Hz), 6,92 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,25-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,57 (1H, d, J=8,0 Hz). | – |
| 115 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 2,25-2,35 (2H, m), 2,40 (3H, s), 3,20-3,70 (10H, m), 4,22 (2H, t, J=5,9 Hz), 6,22 (1H, s), 6,95-7,05 (3H, m), 7,31 (1H, dd, J=7,9, 7,9 Hz), 7,49 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,65-7,80 (3H, m), 10,93 (1H, brs). | Cloridrato |
| 116 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 2,00-2,10 (2H, m), 2,60-2,70 (2H, m), 2,75 (4H, brs), 3,21 (4H, brs), 3,39 (3H, s), 4,05-4,15 (2H, m), 6,55-6,70 (2H, m), 6,90 (1H, d, J=7,6 Hz), 6,96 (1H, d, J=8,5 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz), 9,12 (1H, brs) | – |

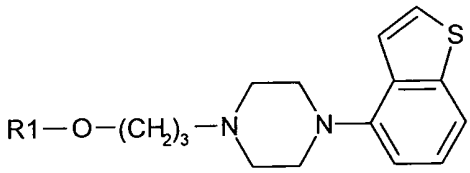
[Tabela 25-1]

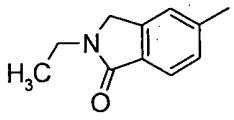


| Exemplo | R1 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|
| 117 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 2,10 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,70 (2H, t, J=7,4 Hz), 2,77 (4H, brs), 3,22 (4H, brs), 3,80 (3H, s), 4,14 (2H, t, J=6,3 Hz), 6,85-7,00 (3H, m), 7,25-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,68 (1H, d, J=8,8 Hz), 7,77 (1H, s). | – |
| 118 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 2,07 (2H, t, J=7,0 Hz), 2,65 (2H, t, J=7,2 Hz), 2,74 (4H, brs), 3,20 (4H, brs), 4,13 (2H, t, J=6,3 Hz), 4,40 (2H, s), 6,38 (1H, brs), 6,90 (1H, d, J=7,6 Hz), 6,97 (1H, s), 7,02 (1H, dd, J=2,1, 8,4 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,78 (1H, d, J=8,4 Hz). | – |

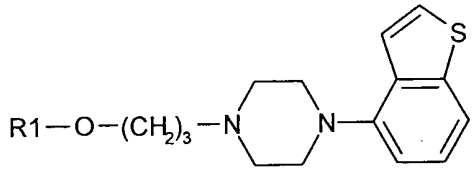
| | | | |
|---|---|---|---|
| 119 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 2,07 (2H, t, J=7,0 Hz), 2,66 (2H, t, J=5,7 Hz), 2,74 (4H, brs), 3,17 (3H, s), 3,20 (4H, brs), 4,12 (2H, t, J=6,3 Hz), 4,31 (2H, s), 6,90 (1H, d, J=7,6 Hz), 6,90-7,00 (2H, m), 7,25-7,30 (1H, m), 7,39 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,41 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,74 (1H, d, J=8,4 Hz) | – |

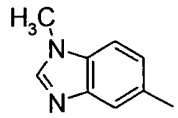
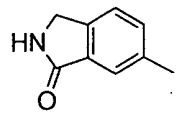
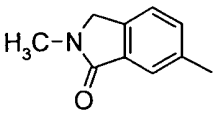
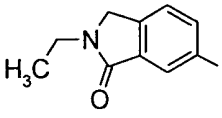
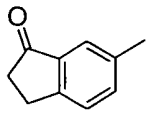
[Tabela 25-2]



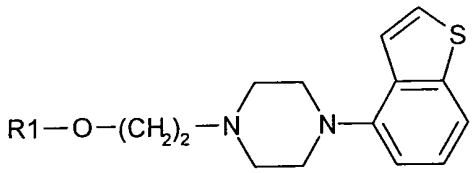
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 120 |  | Pó branco (Metanol) | 242-246 | Cloridrato |

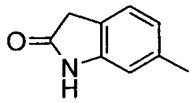
[Tabela 25-3]



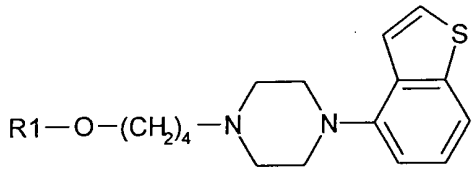
| Exemplo | R1 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|
| 121 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 2,08 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,69 (2H, t, J=7,4 Hz), 2,76 (4H, brs), 3,21 (4H, brs), 3,82 (3H, s), 4,13 (2H, t, J=6,3 Hz), 6,91 (1H, d, J=6,3 Hz), 6,99 (1H, dd, J=2,3, 8,7 Hz), 7,25-7,35 (3H, m), 7,39 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,43 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,81 (1H, s). | -- |
| 122 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 2,00-2,10 (2H, m), 2,65 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,74 (4H, brs), 3,21 (4H, brs), 4,13 (2H, t, J=6,4 Hz), 4,40 (2H, s), 6,84 (1H, brs), 6,91 (1H, d, J=7,5 Hz), 7,16 (1H, dd, J=2,3, 8,3 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (4H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz). | -- |
| 123 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 2,06 (2H, t, J=7,2 Hz), 2,65 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,74 (4H, brs), 3,20 (7H, brs), 4,12 (2H, t, J=6,4 Hz), 4,31 (2H, s), 6,91 (1H, d, J=7,7 Hz), 7,10 (1H, dd, J=2,4, 8,3 Hz), 7,25-7,35 (2H, m), 7,35 (1H, d, J=2,3 Hz), 7,39 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,42 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz). | -- |
| 124 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,15 (3H, t, J=7,3 Hz), 2,20-2,30 (2H, m), 3,15-3,30 (2H, m), 3,30-3,40 (4H, m), 3,45-3,70 (6H, m), 4,16 (2H, t, J=5,8 Hz), 4,39 (2H, s), 6,97 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,10-7,25 (2H, m), 7,31 (1H, dd, J=7,9, 7,9 Hz), 7,45-7,55 (2H, m), 7,69 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,76 (1H, d, J=5,6 Hz), 10,74 (1H, brs). | Cloridrato |
| 125 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 2,20-2,30 (2H, m), 2,64 (2H, t, J=5,8 Hz), 3,01 (2H, t, J=5,5 Hz), 3,20-3,40 (6H, m), 3,53 (2H, d, J=12,3 Hz), 3,64 (2H, d, J=11,2 Hz), 4,15 (2H, t, J=6,0 Hz), 6,95 (1H, d, J=7,7 Hz), 7,13 (1H, d, J=2,4 Hz), 7,25-7,35 (2H, m), 7,45-7,55 (2H, m), 7,69 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,75 (1H, d, J=5,6 Hz), 11,12 (1H, brs). | Cloridrato |

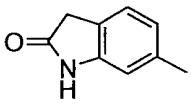
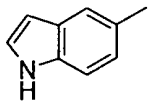
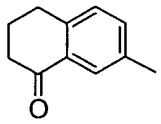
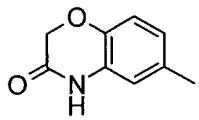
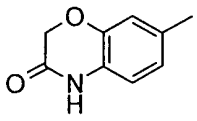
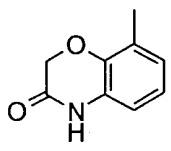
[Tabela 26]

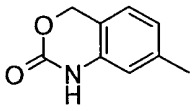
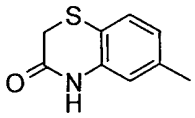
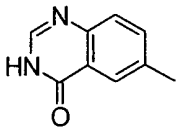
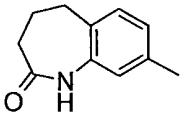


| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 126 |  | Pó vermelho marronzado (Acetonitrila) | 191-193 | – |

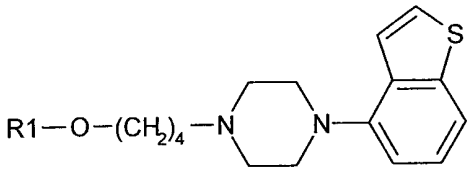
[Tabela 27]

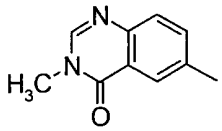
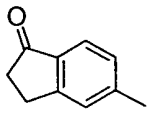
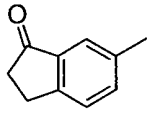
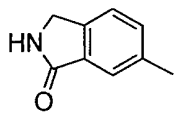


| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 127 |  | Pó vermelho marronzado (Etanol) | 215-217 | Cloridrato |
| 128 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 209,2-210,9 | Cloridrato |
| 129 |  | Sólido branco (Etanol/acetato de etila) | 242,0-244,9 | Cloridrato |
| 130 |  | Pó branco (Etanol) | 211-213 | Cloridrato |
| 131 |  | Pó roxo claro (Acetato de etila) | 180-182 | – |
| 132 |  | Pó rosa claro (Etanol) | 170,2-171,9 | – |

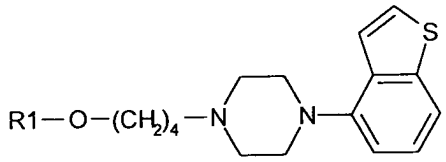
| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 133 |  | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 253-258(dec) | Cloridrato |
| 134 |  | Pó branco (2-propanol) | 213,7-220,6 | Cloridrato |
| 135 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 152,6-155,3 | Cloridrato |
| 136 |  | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 226-228 | Cloridrato |

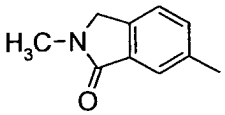
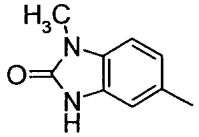
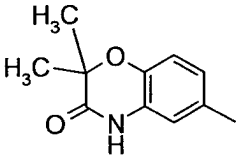
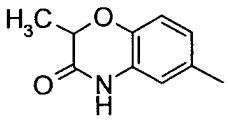
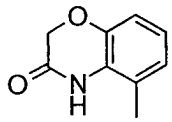
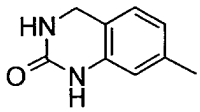
[Tabela 28]



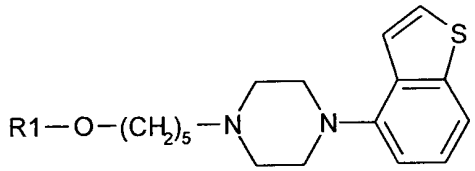
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 137 |  | Sólido branco (Acetato de etila) | 238,8-241,8 | Cloridrato |
| 138 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 198-201 | Cloridrato |
| 139 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 206-209 | Cloridrato |
| 140 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 157-161 | — |

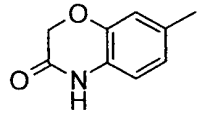
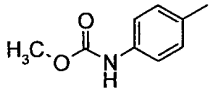
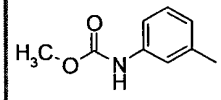
[Tabela 29]



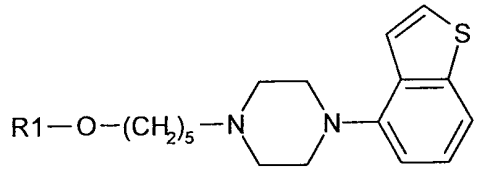
| Exemplo | R1 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|
| 141 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,75-1,85 (2H, m), 1,90-1,95 (2H, m), 3,05 (3H, s), 3,15-3,35 (6H, m), 3,55-3,65 (4H, m), 4,08 (2H, t, J=6,1 Hz), 4,36 (2H, s), 6,95 (1H, d, J=7,7 Hz), 7,10-7,20 (2H, m), 7,30 (1H, dd, J=7,9, 7,9 Hz), 7,45-7,50 (2H, m), 7,69 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,75 (1H, d, J=5,5 Hz), 10,75 (1H, brs). | Dicloridrato |
| 142 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,70-1,80 (2H, m), 1,85-2,00 (2H, m), 3,22 (3H, s), 3,15-3,35 (6H, m), 3,45-3,60 (4H, m), 3,95 (2H, t, J=6,1 Hz), 6,60-6,65 (2H, m), 6,90-7,00 (2H, m), 7,30 (1H, dd, J=7,9, 7,9 Hz), 7,45-7,50 (1H, m), 7,68 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,75 (1H, d, J=5,5 Hz), 10,82 (1H, s), 11,31 (1H, brs). | Cloridrato |
| 143 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,52 (6H, s), 1,60-1,90 (4H, m), 2,53 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,70-2,80 (4H, m), 3,10-3,30 (4H, m), 3,97 (2H, t, J=6,0 Hz), 6,37 (1H, d, J=2,7 Hz), 6,53 (1H, dd, J=2,7, 8,8 Hz), 6,85-6,95 (2H, m), 7,25-7,35 (2H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J=8,0 Hz), 8,06 (1H, s) | -- |
| 144 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,37 (3H,d, J=6,7 Hz), 1,50-1,80 (4H, m), 2,41 (2H, t, J=6,9 Hz), 2,55-2,65 (4H, br), 3,90 (2H, t, J=6,2 Hz), 4,51 (1H, q, J=6,7 Hz), 6,45-6,50 (2H, m), 6,80-6,90 (2H, m), 7,25 (1H, t, J=7,8 Hz), 7,38 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,59 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,67 (1H,d, J=5,5 Hz), 10,53 (1H, s) | -- |
| 145 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,65-1,95 (4H, m), 2,53 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,70-2,75 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 4,08 (2H, t, J=6,3 Hz), 4,61 (2H, s), 6,57 (1H, d, J=8,3 Hz), 6,61 (1H, d, J=8,3 Hz), 6,85-6,95 (2H, m), 7,20-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,80 (1H, brs) | -- |
| 146 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,60-1,88 (4H, m), 2,51 (2H, t, J=7,5 Hz), 2,63-2,77 (4H, m), 3,13-3,25 (4H, m), 3,95 (2H, t, J=6,3 Hz), 4,46 (2H, s), 5,28 (1H, brs), 6,25 (1H, d, J=2,4 Hz), 6,50 (1H, dd, J=8,4, 2,4 Hz), 6,90 (1H, d, J=7,7 Hz), 6,92 (1H, d, J=8,4 Hz), 7,27 (1H, dd, J=7,8, 8,0 Hz), 7,38 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,41 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,51 (1H, brs), 7,54(1H, d, J=8,0 Hz). | -- |

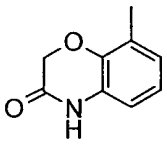
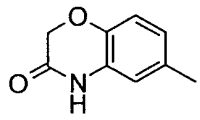
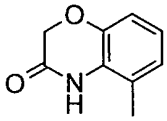
[Tabela 30]



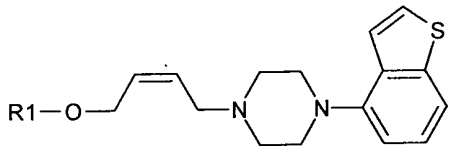
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 147 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 143-144 | – |
| 148 |  | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 112,5-114,5 | – |
| 149 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 208,0-211,5 | Cloridrato |

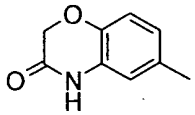
[Tabela 31]



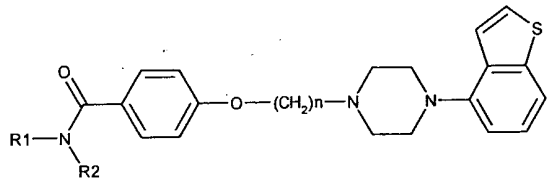
| Exemplo | R1 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|
| 150 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,40-1,67 (2H, m), 1,73-1,90 (4H, m), 3,13-3,30 (6H, m), 3,52-3,62 (4H, m), 3,96-4,01 (2H, m), 4,54 (2H, s), 6,50 (1H, d, J=7,7 Hz), 6,67 (1H, d, J=7,3 Hz), 6,83-6,88 (1H, m), 6,96 (1H, d, J=7,7 Hz), 7,28-7,34 (1H, m), 7,48 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,70 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,76 (1H, d, J=5,6 Hz), 10,42 (1H, br), 10,67 (1H, br) | Cloridrato |
| 151 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1, 4 0-1,60 (4H, m), 1,60-1,80 (2H, m), 2,35-2,45 (2H, m), 2,55-2,65 (4H, br), 3,90 (2H, t, J=6,4 Hz), 4,49 (2H, s), 6,45-6,55 (2H, m), 6,80-6,95 (2H, m), 7,28 (1H, t, J=7,8 Hz), 7,40 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,62 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,69 (1H,d, J=5,5 Hz), 10,61 (1H, s) | – |
| 152 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,45-1,70 (4H, m), 1,80-1,90 (2H, m), 2,45-2,55 (2H, m), 2,65-2,75 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 4,05 (2H, t, J=6,3 Hz), 4,61 (2H, s), 6,50-6,65 (2H, m), 6,85-6,95 (2H, m), 7,20-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,80 (1H, brs) | – |

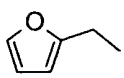
[Tabela 32]



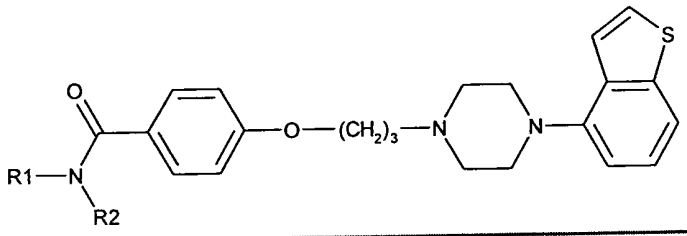
| Exemplo | R1 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|
| 153 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 2,73 (4H, m), 3,19-3,20 (6H, m), 4,56 (2H, s), 4,54-4,62 (2H, m), 5,76-5,92 (2H, m), 6,38 (1H, d, J=2,7 Hz), 6,54 (1H, dd, J=8,8, 2,7 Hz), 6,89-6,92 (2H, m), 7,25 (1H, m), 7,39-7,41 (2H, m), 7,53-7,56 (2H, m) | -- |

[Tabela 33]



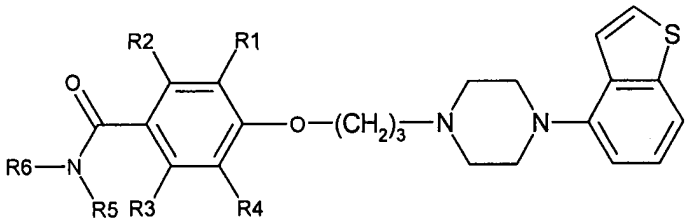
| Exemplo | R1 | R2 | n | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 154 | -H | $-C_2H_5$ | 3 | Pó branco (Acetato de etila) | 218,5-222,0(dec) | Cloridrato |
| 155 | -H | $-C_3H_7$ | 3 | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 127,0-128,5 | — |
| 156 | -H | $-CH_3$ | 3 | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 151,0-154,5 | — |
| 157 | $-CH_3$ | $-CH_3$ | 3 | Pó branco (Acetato de etila) | 206,5-211,5 | Cloridrato |
| 158 | $-C_2H_5$ | $-C_2H_5$ | 3 | Pó branco (Acetato de etila) | 205,5-209,0 | Cloridrato |
| 159 | -H | $-CH_2CF_3$ | 3 | Pó branco (Acetato de etila) | 217,0(dec) | Cloridrato |
| 160 | -H | $-CH_2CH_2N(C_2H_5)_2$ | 3 | Pó branco (Acetato de etila) | 229,5-232,5 | Dicloridrato |
| 161 | -H | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 3 | Pó branco (Acetato de etila) | 218,5-221,0 | Cloridrato |
| 162 | -H | -ciclo-$C_3H_5$ | 3 | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 165,5-167,0 | — |
| 163 | -H | $-CH(CH_3)_2$ | 3 | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 131,5-132,5 | — |
| 164 | -H | -H | 3 | Pó branco (Diclorometano) | 186,0-191,0 | — |
| 165 | -H | $-(CH_2)_5OH$ | 3 | Sólido branco (Etanol) | 202-203 | Cloridrato |
| 166 | -H |  | 3 | Sólido marrom claro (Etanol) | 215-216 | Cloridrato |
| 167 | -H | $-C_2H_5$ | 4 | Pó branco (Acetato de etila) | 198,0-199,5 | Cloridrato |
| 168 | -H | $-CH_2CF_3$ | 4 | Pó branco (Acetato de etila) | 194,5-196,0 | Cloridrato |
| 169 | -H | -H | 4 | Pó branco (2-propanol) | 150,0-151,5 | — |
| 170 | -H | $-CH_3$ | 4 | Pó branco (Acetato de etila) | 154,0-156,0 | — |
| 171 | $-CH_3$ | $-CH_3$ | 4 | Pó branco (Acetato de etila) | 226,0(dec) | Cloridrato |

[Tabela 34]



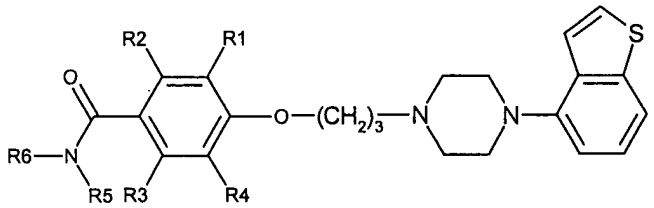
| Exemplo | R1 | R2 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 172 | -H | $-CH_2CH_2OH$ | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 2,1-2,2 (2H, m), 3,1-3,8 (14H, m), 4,17 (2H, t, J=5,7 Hz), 4,6-4,8 (1H, br), 6,9-7,1 (3H, m), 7,33 (1H, dd, J=7,9, 8,1 Hz), 7,51 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,72 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,78 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,86 (2H, d, J=8,8 Hz), 8,2-8,3 (1H, br), 10,2-10,4 (1H, br). | Cloridrato |

[Tabela 35]



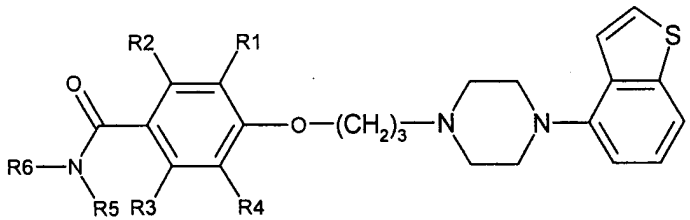
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (℃) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 173 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 199,0-204,0 | Cloridrato |
| 174 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 162,0-163,0 | -- |
| 175 | -Cl | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 154,0-155,5 | -- |
| 176 | -Cl | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 145,0-148,0 | -- |
| 177 | -H | -H | -H | -Cl | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 213,0(dec) | Cloridrato |
| 178 | -H | -H | -H | -Cl | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 211,0(dec) | Cloridrato |
| 179 | -Cl | -H | -H | -H | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 128,5-131,0 | -- |
| 180 | -F | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 153,5-156,0 | -- |

[Tabela 36]



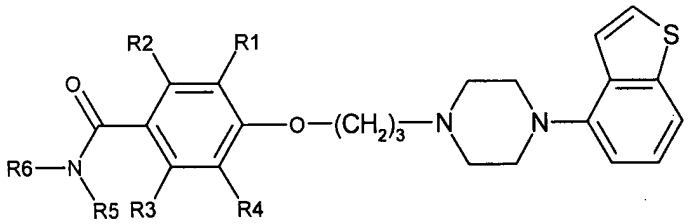
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (℃) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 181 | -H | -H | -H | -F | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 232,0(dec) | Cloridrato |
| 182 | -H | -H | -H | -F | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 198,0-202,0 | Cloridrato |
| 183 | -H | -H | -H | -F | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 210,5-213,0 | Cloridrato |
| 184 | -F | -H | -H | -H | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 176,5-179,5 | -- |
| 185 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (2-propanol) | 178,5-180,0 | -- |
| 186 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (2-propanol) | 156,5-158,0 | -- |
| 187 | -H | -H | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 220,0-222,0(dec) | Cloridrato |
| 188 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (2-propanol) | 140,5-143,0 | -- |
| 189 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó branco (2-propanol) | 154,5-157,0 | -- |
| 190 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (2-propanol) | 162,0-163,5 | -- |

[Tabela 37]



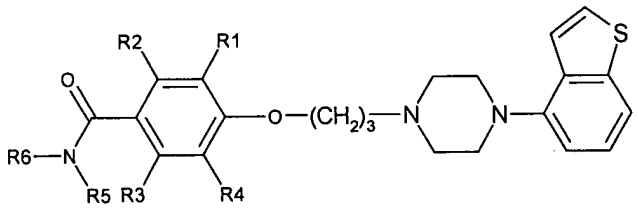
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (℃) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 191 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (2-propanol) | 160,5-162,0 | -- |
| 192 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó amarelo claro (2-propanol) | 144,5-146,0 | -- |
| 193 | -Cl | -H | -H | -H | $-CH_2CH_2OCH_3$ | -H | Pó branco | 120-122 | -- |
| 194 | -H | -H | -H | -F | $-CH_2CH_2OCH_3$ | -H | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 215,0-217,0 | Cloridrato |
| 195 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | $-CH_2CH_2OCH_3$ | -H | Pó branco (Etanol/hexano) | 120,0-121,0 | -- |
| 196 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_3$ | -H | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 194-196 | Cloridrato |
| 197 | -Br | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 152,5-154,0 | -- |
| 198 | -Br | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 148,0-150,0 | -- |
| 199 | -H | -H | -H | -Br | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 225,0 (dec) | Cloridrato |
| 200 | -H | -H | -H | -Br | $-C_2H_5$ | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 214,5-220,5(dec) | Cloridrato |

[Tabela 38]



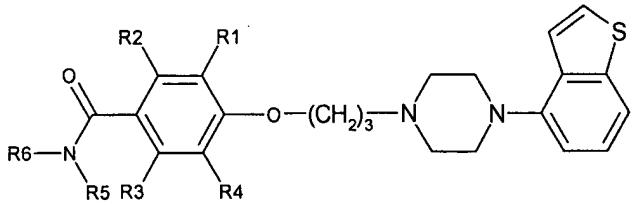

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (℃) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 201 | -H | -H | -H | -Br | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 230,0-234,5 | Cloridrato |
| 202 | -CN | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 182,0-185,0 | -- |
| 203 | -CN | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (2-propanol) | 177,5-181,5 | -- |
| 204 | -H | -H | -H | -CN | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 213,5-214,0 | Cloridrato |
| 205 | -CN | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (2-propanol) | 162,5-166,0 | -- |
| 206 | -H | -H | -H | -CN | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 217,0-222,0 | Cloridrato |
| 207 | -H | -Cl | -H | -H | -H | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 133,5-135,5 | -- |
| 208 | -H | -Cl | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 137,0-139,0 | -- |
| 209 | -H | -H | -Cl | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 236,0 (dec) | Cloridrato |
| 210 | -H | -H | -Cl | -H | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 223,0-224,0 | Cloridrato |

[Tabela 39]



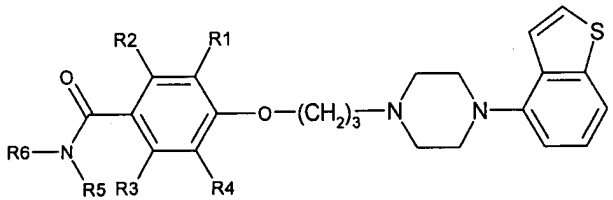
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (℃) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 211 | -H | -H | -Cl | -H | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 210,5-216,0 | Cloridrato |
| 212 | -H | -H | $-CF_3$ | -H | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 212,0-219,5 | Cloridrato |
| 213 | -H | $-CF_3$ | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Diclorometano/éter isopropílico) | 139,5-141,0 | Cloridrato |
| 214 | -H | -H | $-CF_3$ | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 214,0-218,5 | Cloridrato |
| 215 | -H | -H | $-CF_3$ | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 252,5 (dec) | Cloridrato |
| 216 | -H | -H | $-CF_3$ | -H | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 216,0-218,5 | Cloridrato |
| 217 | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | Pó branco (2-propanol) | 173,5-178,5 | -- |

[Tabela 39-1]



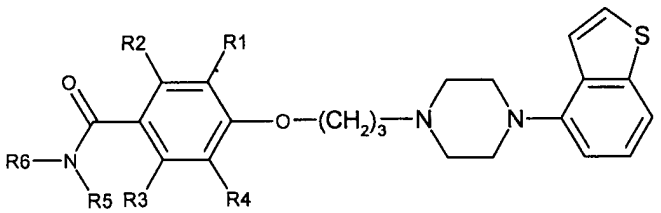

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 218 | $-N(CH_3)_2$ | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | -H | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,20-1,30 (3H, m), 2,10-2,20 (2H, m), 2,69 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,70-2,75 (4H, m), 2,85 (6H, s), 3,20-3,25 (4H, m), 3,45-3,55 (2H, m), 4,10-4,20 (2H, m), 6,00 (1H, brs), 6,85-6,95 (2H, m), 7,25-7,30 (3H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J=8,1 Hz). | -- |
| 219 | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | -H | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,20-1,30 (3H, m), 2,05-2,15 (2H, m), 2,25 (3H, s), 2,65 (2H, t, J=7,1 Hz), 2,70-2,80 (4H, m), 3,20-3,25 (4H, m), 3,40-3,55 (2H, m), 4,21 (2H, t, J=6,4 Hz), 6,22 (1H, brs), 6,91 (1H, d, J=7,7 Hz), 6,98 (1H, d, J=8,6 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,71 (1H, d, J=8,5 Hz), 7,82 (1H, brs), 8,70 (1H, s). | -- |

[Tabela 40]



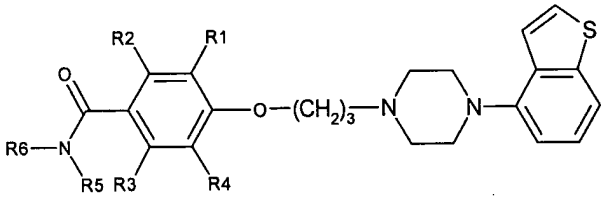
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (℃) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 220 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (2-propanol) | 221,5-223,0 | Cloridrato |
| 221 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 207,5-215,0 | Cloridrato |
| 222 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 197,0-202,0 | Cloridrato |
| 223 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 219,0-227,0 | Cloridrato |
| 224 | $-NO_2$ | -H | -H | -H | -H | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 157,5-161,0 | -- |
| 225 | $-NO_2$ | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 157,5-161,5 | -- |
| 226 | -H | -H | -H | $-NO_2$ | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 217,5-219,5 (dec) | Cloridrato |
| 227 | $-CF_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 163,5-165,5 | -- |
| 228 | $-NH_2$ | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 172,5-173,0 | -- |
| 229 | $-CF_3$ | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 158,5-162,0 | -- |
| 230 | $-CF_3$ | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 146,5-148,5 | -- |

[Tabela 41]



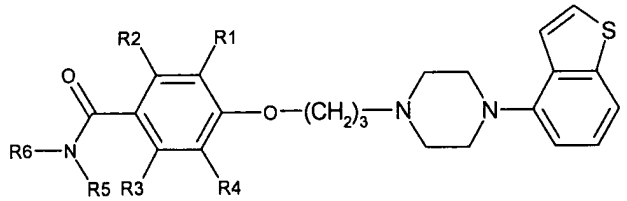
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (℃) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 231 | $-CF_3$ | -H | -H | -H | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 144,5-150,0 | -- |
| 232 | $-NH_2$ | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 124,0-125,5 | -- |
| 233 | $-N(CH_3)_2$ | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 143,0-145,0 | -- |
| 234 | -H | -H | -H | $-N(CH_3)_2$ | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 219,0-223,0 | Cloridrato |
| 235 | $-NH_2$ | -H | -H | -H | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 125,0-126,0 | -- |
| 236 | $-N(CH_3)_2$ | -H | -H | -H | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 147,5-148,5 | -- |
| 237 | -H | $-CH_3$ | -H | -H | -H | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 150,5-152,5 | -- |
| 238 | -H | $-CH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 138,0-139,0 | -- |
| 239 | -H | $-CH_3$ | -H | -H | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 137,5-139,0 | -- |
| 240 | $-CH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | -H | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 167,0-168,0 | -- |

[Tabela 42]



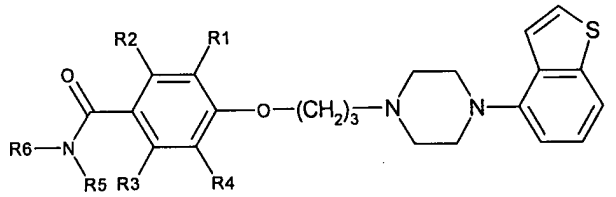
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 241 | $-CH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 152,5-154,5 | — |
| 242 | $-CH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 184,0-185,5 | — |
| 243 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 147,5-148,0 | — |
| 244 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 233,0-237,5 (dec) | Cloridrato |
| 245 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 145,5-147,5 | — |
| 246 | $-OC_2H_5$ | -H | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 186,5-188,0 | Cloridrato |
| 247 | $-CH_2CH=CH_2$ | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | (Acetato de etila/éter isopropílico) | 126,0-130,0 | — |
| 248 | $-C_3H_7$ | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | (Acetato de etila/éter isopropílico) | 137,5-140,0 | — |
| 249 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-CH_2CH=CH_2$ | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 180,5-186,0 | Cloridrato |
| 250 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-C_3H_7$ | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 186,5-192,0 | Cloridrato |

[Tabela 43]



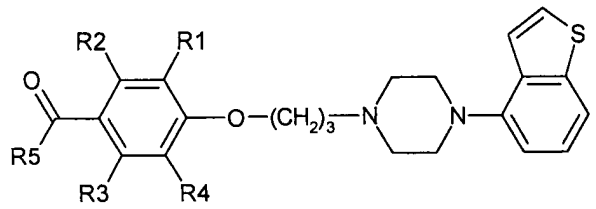
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 251 | $-CH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 156,0-157,0 | — |
| 252 | $-CH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila/metanol) | 141,5-142,5 | — |
| 253 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | $-C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 220,5-224,5 | Cloridrato |
| 254 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | $-OCH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 223,0-227,5 | Cloridrato |

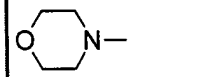
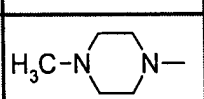
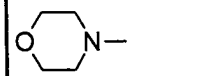
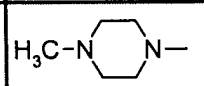
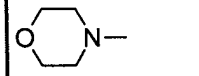
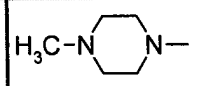
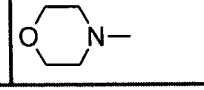
[Tabela 44]

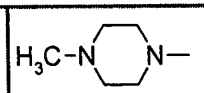
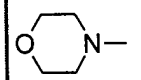
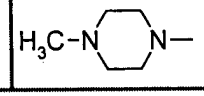


| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 255 | -H | -H | -H | $-NO_2$ | $-C_2H_5$ | -H | RMN-$^1$H (CDCl3 ) δppm: 1,28 (3H, t, J=7,3 Hz), 2,05-2,15 (2H, m), 2,68 (2H, t, J=7,0 Hz), 2,73 (4H, brs), 3,19 (4H, brs), 3,45-3,55 (2H, m), 4,29 (2H, t, J=6,2 Hz), 6,14 (1H, brs), 6,90 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,18 (1H, d, J=8,8 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz), 8,04 (1H, dd, J=2,3, 8,8 Hz), 8,23 (1H, d, J=2,2 Hz). | — |

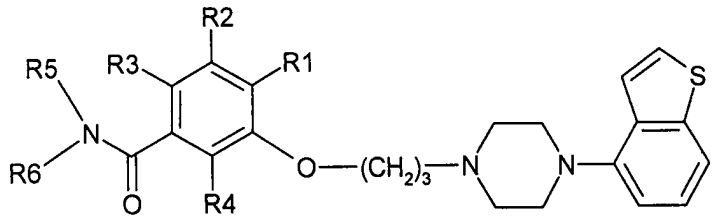
[Tabela 45]



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 256 | -H | -H | -H | -H |  | Pó branco (Acetato de etila) | 234,5-238,0 | Cloridrato |
| 257 | -H | -H | -H | -H |  | Pó branco (Acetato de etila) | 244,0 (dec) | Dicloridrato |
| 258 | -H | -H | -H | -Cl |  | Pó branco (Acetato de etila) | 218,5-222,0 | Cloridrato |
| 259 | -H | -H | -H | -Cl |  | Pó branco (Acetato de etila) | 255,0 (dec) | Dicloridrato |
| 260 | -H | -H | -H | -F |  | Pó branco (Acetato de etila) | 224,5-227,5 (dec) | Cloridrato |
| 261 | -H | -H | -H | -F |  | Pó branco (Acetato de etila) | 255,0 (dec) | Dicloridrato |
| 262 | -H | -H | -H | $-CH_3$ |  | Pó branco (Acetato de etila) | 236,0 (dec) | Cloridrato |

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 263 | -H | -H | -H | $-CH_3$ |  | Pó branco (Acetato de etila) | 255,5 (dec) | Dicloridrato |
| 264 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ |  | Pó branco (Acetato de etila) | 226,0-228,0 (dec) | Cloridrato |
| 265 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ |  | Pó branco (Acetato de etila) | 232,0 (dec) | Dicloridrato |

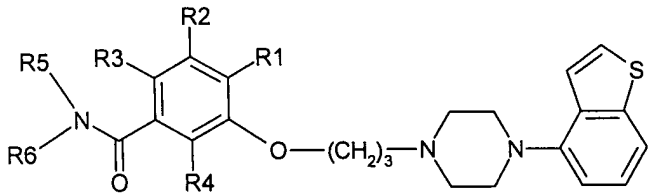
[Tabela 46]




| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 266 | -H | -H | -H | -H | -H | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 158,0-160,0 | — |
| 267 | -H | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 183,0-186,0 | Cloridrato |
| 268 | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 158,0-161,5 | Cloridrato |
| 269 | -H | -H | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 168,5-173,0 | Cloridrato |
| 270 | -H | -H | -H | -H | -H | $-CH_2CF_3$ | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 187,5-189,0 | Cloridrato |
| 271 | -F | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 156,5-159,0 | — |
| 272 | -F | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 214,5-218,0 | Cloridrato |
| 273 | -F | -H | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila) | 211,0-218,0 | Cloridrato |

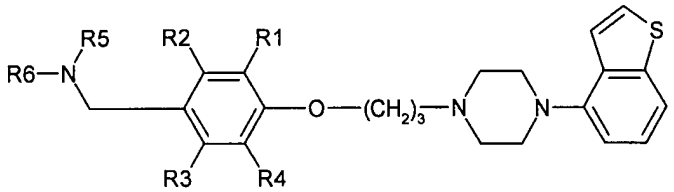
| | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 274 | -Cl | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 139,0-140,5 | — |
| 275 | -Cl | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 218,5-222,5 | Cloridrato |
| 276 | -Cl | -H | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila) | 247,0 (dec) | Cloridrato |
| 277 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 129,5-130,0 | — |
| 278 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 148,5-151,0 | — |
| 279 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 133,0-134,5 | — |
| 280 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 155,5-160,0 | — |
| 281 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 163,5-165,0 | Cloridrato |

[Tabela 47]



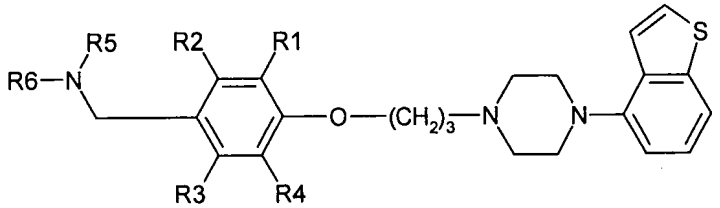

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 282 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila) | 187,0-188,5 | Cloridrato |
| 283 | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 132,0-134,0 | — |
| 284 | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 201,0-206,0 | Cloridrato |
| 285 | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 156,0-158,5 | — |

[Tabela 48]



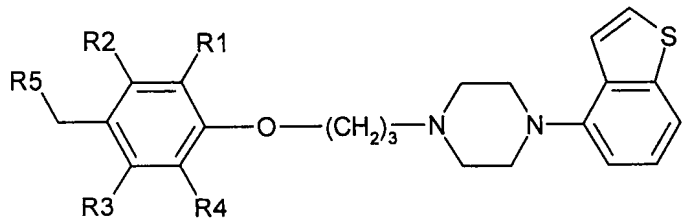
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 286 | -H | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 228,0-241,0 (dec) | Dicloridrato |
| 287 | -H | -H | -H | -H | $-C_3H_7$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 232,0-236,0 (dec) | Dicloridrato |
| 288 | -H | -H | -H | -H | $-C_3H_7$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 210,0-222,0 (dec) | Dicloridrato |
| 289 | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 235,5 (dec) | Dicloridrato |
| 290 | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 257,5 (dec) | Dicloridrato |
| 291 | -H | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | $-C_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila) | 232,0 (dec) | Dicloridrato |
| 292 | -H | -H | -H | -H | $-CH_2CF_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 238,5-240,5 (dec) | Dicloridrato |
| 293 | -H | -H | -H | -H | $-CH_2CH_2N(C_2H_5)_2$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 209,5 (dec) | Tricloridrato |
| 294 | -H | -H | -H | -H | -H | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 245,5 (dec) | Dicloridrato |
| 295 | -H | -H | -H | -H | -CHO | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 207,5-213,0 | Cloridrato |
| 296 | -H | -H | -H | -H | $-COCH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 196,5-201,0 | Cloridrato |
| 297 | -H | -H | -H | -H | $-COC_2H_5$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 194,5-198,0 | Cloridrato |
| 298 | -H | -H | -H | -H | $-COC_6H_5$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 192,5-195,5 | Cloridrato |
| 299 | -H | -H | -H | -H | $-CH_2C_6H_5$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 236,5 (dec) | Dicloridrato |
| 300 | -H | -H | -H | -H | $-C_6H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 191,0-193,5 | Dicloridrato |
| 301 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 101,0-103,0 | — |
| 302 | -H | -H | -H | -H | $-C_6H_5$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 207,5-214,5 | Tricloridrato |
| 303 | -H | -H | -H | -Cl | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 259,0 (dec) | Dicloridrato |
| 304 | -H | -H | -H | -F | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 247,0 (dec) | Dicloridrato |
| 305 | -H | -H | -H | -F | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 237,0 (dec) | Dicloridrato |
| 306 | -H | -H | -H | -F | $-CH_3$ | $-COCH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 196,0-199,0 | Cloridrato |

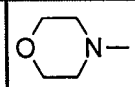
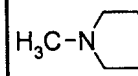
[Tabela 49]

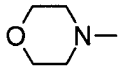
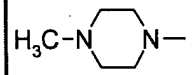
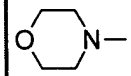
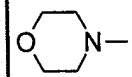


| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 307 | -H | -H | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | $-C_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila) | 256,5 (dec) | Dicloridrato |
| 308 | -H | -H | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 254,5 (dec) | Dicloridrato |
| 309 | -H | -H | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 277,5 (dec) | Dicloridrato |
| 310 | -H | -H | -H | $-CH_3$ | $-COCH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 230,0-232,0 (dec) | Cloridrato |
| 311 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 239,5 (dec) | Dicloridrato |
| 312 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | $-CH_3$ | $-COCH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 206,0-211,5 | Cloridrato |

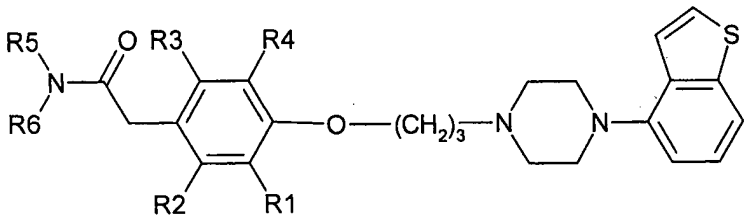
[Tabela 50]



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 313 | -H | -H | -H | -H |  | Pó branco (Acetato de etila) | 243,5 (dec) | Dicloridrato |
| 314 | -H | -H | -H | -H |  | Pó branco (Acetato de etila) | 261,5 (dec) | Dicloridrato |

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 315 | -H | -H | -H | -Cl |  | Pó branco (Acetato de etila) | 249,0 (dec) | Dicloridrato |
| 316 | -H | -H | -H | -Cl |  | Pó branco (Acetato de etila) | 253,5 (dec) | Tricloridrato |
| 317 | -H | -H | -H | -F |  | Pó branco (Acetato de etila) | 252,0 (dec) | Dicloridrato |
| 318 | -H | -H | -H | $-CH_3$ |  | Pó branco (Acetato de etila) | 242,0 (dec) | Dicloridrato |

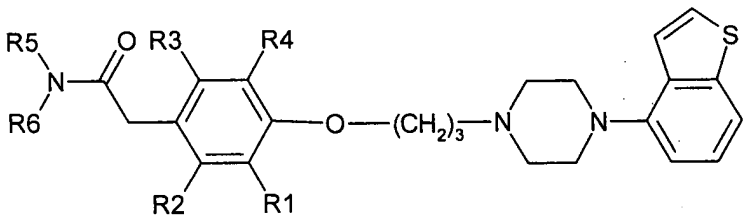
[Tabela 51]



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 319 | -H | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | $-C_2H_5$ | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 179,0-183,5 | Cloridrato |
| 320 | -H | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/água) | 150,0-154,5 | — |
| 321 | -H | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 198,0-207,0 | Cloridrato |
| 322 | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 128,0-129,5 | — |
| 323 | -H | -H | -H | -H | -H | $-C_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 112,5-113,5 | — |
| 324 | -H | -H | -H | -H | -H | $-CH_2CF_3$ | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 126,0-127,0 | — |

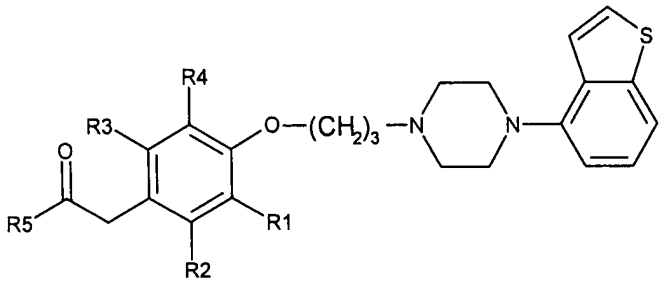
| | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 325 | -Cl | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (2-propanol) | 161,5-166,0 | — |
| 326 | -H | -H | -H | -Cl | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 194,5-197,0 | Cloridrato |
| 327 | -H | -H | -H | -Cl | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 197,5-201,0 | Cloridrato |
| 328 | -H | -H | -H | -Cl | -H | $-C_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila) | 227,5 (dec) | Cloridrato |
| 329 | -H | -H | -H | -Cl | -H | $-CH_2CF_3$ | (Acetato de etila) | 204,0-206,0 | Cloridrato |
| 330 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 129,0-130,0 | — |
| 331 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 176,0-178,5 | Cloridrato |
| 332 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 188,5-192,0 | Cloridrato |
| 333 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | $-C_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila) | 178,0-184,0 | Cloridrato |
| 334 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | $-CH_2CF_3$ | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 187,5-192,0 | Cloridrato |

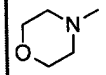
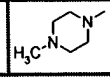
[Tabela 52]



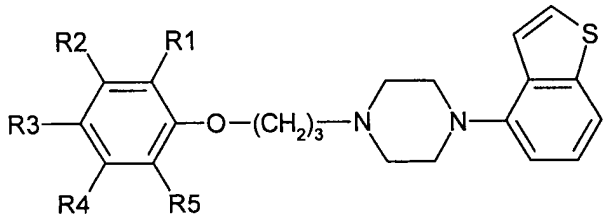

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 335 | -F | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (2-propanol) | 146,5-150,0 | — |
| 336 | -H | -H | -H | -F | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 191,0-193,0 | Cloridrato |
| 337 | -H | -H | -H | -F | $-CH_3$ | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 192,5-197,0 | Cloridrato |
| 338 | -H | -H | -H | -F | -H | $-C_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila) | 216,0-220,5 | Cloridrato |
| 339 | -H | -H | -H | -F | -H | $-CH_2CF_3$ | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 197,0-202,0 | Cloridrato |
| 340 | -H | -H | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 149,5-150,5 | — |

[Tabela 53]



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 341 | -H | -H | -H | -H |  | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 130,5-131,5 | — |
| 342 | -H | -H | -H | -H |  | Pó branco (Acetato de etila) | 227,5 (dec) | Dicloridrato |

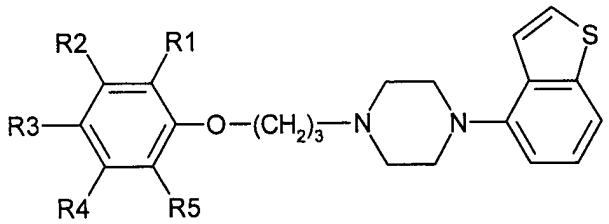
[Tabela 54]

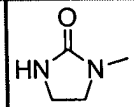
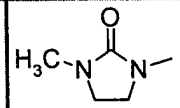
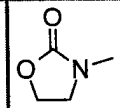


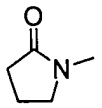
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 343 | -H | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | Pó branco (Etanol) | 283,0-285,0 | Cloridrato |
| 344 | -H | -H | $-NHCO_2CH_3$ | -H | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 149,5-150,5 | — |
| 345 | -H | -H | $-NHSO_2C_2H_5$ | -H | -H | Pó amarelo claro (Etanol/acetato de etila) | 174-176 | Dicloridrato |
| 346 | -H | -H | $-NHC_2H_5$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 225 (dec) | Cloridrato |
| 347 | -H | -H | $-N(CH_3)CO_2CH_3$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 196,0-202,0 | Cloridrato |

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 348 | -H | -H | $-N(CH_3)COCH_3$ | -H | -H | Pó branco (Etanol) | 246-247 | Cloridrato |
| 349 | -H | -H | $-NH_2$ | -H | -H | Pó branco (Etanol contendo água) | 266-271 (dec) | Cloridrato |
| 350 | -H | -H | $-NHCH_3$ | -H | -H | Pó branco (Etanol) | 264-266 | Dicloridrato |
| 351 | -H | -H | $-N(CH_3)_2$ | -H | -H | Pó branco (Etanol) | 269-270 | Dicloridrato |
| 352 | $-CH_3$ | -H | $-NH_2$ | -H | $-OCH_3$ | Sólido amarelo claro(Acetato de etila) | 155,0-158,0 | – |
| 353 | $-OCH_3$ | -H | $-NHCON(CH_3)_2$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 206,0-210,0 | Cloridrato |
| 354 | $-OCH_3$ | -H | -NHCHO | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 247,5-253,0 (dec) | Cloridrato |
| 355 | $-OCH_3$ | -H | $-NHCO_2CH_3$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 230,0-235,5 | Cloridrato |

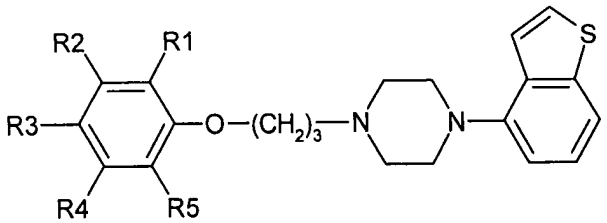
[Tabela 55]




| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 356 | -H | -H |  | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/2-propanol) | 154,5-156,5 | – |
| 357 | -H | -H |  | -H | -H | Pó branco (2-propanol) | 141,0-144,5 | – |
| 358 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Etanol) | 247,5-251,0 (dec) | Cloridrato |

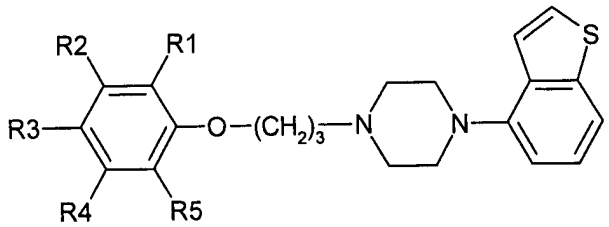
| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 359 | -$CH_2OH$ | -H |  | -H | -$OCH_3$ | Pó branco (Etanol) | 144,0-145,0 | Cloridrato |

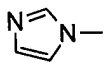
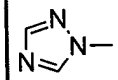
[Tabela 56]



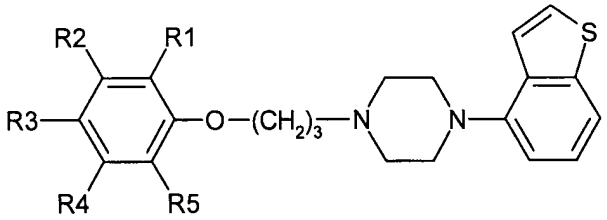

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 360 | -H | -H | -$NHCH(CH_3)_2$ | -H | -H | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,24 (6H, d, J = 6,5Hz), 2,2-2,4 (2H, m), 3,15-3,8 (12H, m), 4,15 (2H, t, J = 6Hz), 6,99 (1H, d, J = 7,5Hz), 7,11 (2H, d, J = 9Hz), 7,33 (1H, dd, J = 8, 8Hz), 7,4-7,55 (3H, m), 7,71 (1H, d, J = 8Hz), 7,78 (1H, d, J = 5,5Hz), 10,87 (3H, br). | TriCloridrato |
| 361 | -$OCH_3$ | -H | -$NHCO_2CH_3$ | -H | -H | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,00-2,15 (2H, m), 2,60-2,70 (2H, m), 2,73 (4H, brs), 3,20 (4H, brs), 3,77 (3H, s), 3,88 (3H, s), 4,10 (2H, t, J=6,6 Hz), 6,52 (1H, brs), 6,74 (1H, dd, J=2,5, 8,6 Hz), 6,87 (1H, d, J=8,6 Hz), 6,90 (1H, d, J=7,7 Hz), 7,19 (1H, brs), 7,28 (1H, dd, J=7,8, 7,8 Hz), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=7,8 Hz). | _ |
| 362 | -H | -H | -$NHCON(CH_3)_2$ | -H | -H | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 2,20-2,30 (2H, m), 2,91 (6H, s), 3,20-3,40 (6H, m), 3,55 (2H, d, J=12,4 Hz), 3,65 (2H, d, J=11,4 Hz), 4,05 (2H, t, J=6,0 Hz), 6,86 (2H, d, J=9,0 Hz), 6,98 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,30-7,40 (3H, m), 7,50 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,71 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,78 (1H, d, J=5,5 Hz), 8,16 (1H, brs), 11,05 (1H, brs). | Dicloridrato |
| 363 | -F | -H | -$NHCO_2CH_3$ | -H | -H | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 2,24 (2H, brs), 3,10-3,25 (2H, m), 3,30-3,50 (4H, m), 3,50-3,60 (2H, m), 3,66 (3H, s), 3,65-3,70 (2H, m), 4,13 (2H, t, J=5,9 Hz), 6,98 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,10-7,20 (2H, m), 7,32 (1H, dd, J=7,9, 7,9 Hz), 7,40 (1H, d, J=13,3 Hz), 7,50 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,71 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,77 (1H, d, J=5,5 Hz), 9,69 (1H, brs), 10,56 (1H, brs). | Cloridrato |

[Tabela 56-1]



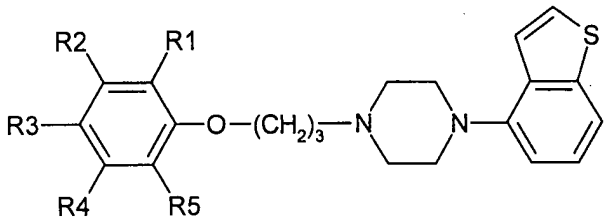

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 364 | -H | -H | -$NHCONH_2$ | -H | -H | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,64 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,70-2,75 (4H, m), 3,15-3,20 (4H, m), 4,03 (2H, t, J=6,3 Hz), 4,83 (2H, brs), 6,83 (1H, brs), 6,85-6,95 (3H, m), 7,20 (2H, d, J=8,6 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz). | _ |
| 365 | -H | -H | -$NHCON(C_2H_5)_2$ | -H | -H | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,06 (6H, t, J=7,0 Hz), 2,15-2,30 (2H, m), 3,20-3,45 (10H, m), 3,54 (2H, d, J=12 Hz), 3,64 (2H, d, J=12 Hz), 4,03 (2H, t, J=5,9 Hz), 6,84 (2H, d, J=8,9 Hz), 6,97 (1H, d, J=7,7 Hz), 7,25-7,40 (3H, m), 7,49 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,70 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,76 (1H, d, J=5,6 Hz), 8,01 (1H, s), 10,95 (1H, s). | Dicloridrato |
| 366 | -H | -H |  | -H | -H | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 2,05-2,10 (2H, m), 2,67 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,76 (4H, brs), 3,22 (4H, brs), 4,11 (2H, t, J=6,3 Hz), 6,91 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,01 (2H, d, J=8,9 Hz), 7,20 (2H, d, J=9,6 Hz), 7,25-7,35 (3H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,77 (1H, s). | _ |
| 367 | -H | -H |  | -H | -H | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,05-2,15 (2H, m), 2,67 (2H, t, J=7,2 Hz), 2,75 (4H, brs), 3,21 (4H, brs), 4,12 (2H, t, J=6,3 Hz), 6,91 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,00-7,05 (2H, m), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,50-7,60 (3H, m), 8,08 (1H, s), 8,45 (1H, s). | — |

[Tabela 57]



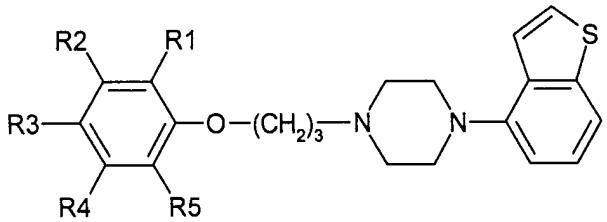

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão(°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 368 | -H | -H | $-CH_2CH_2N(C_2H_5)_2$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 224,0-232,0 (dec) | Dicloridrato |
| 369 | -H | -H | -H | $-NHCO_2CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 178,0-181,0 (dec) | Cloridrato |
| 370 | -H | -H | -CN | -H | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 105,5-107,0 | — |
| 371 | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | -H | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 263,0 (dec) | Cloridrato |
| 372 | -H | -H | $-CO_2CH_3$ | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 242,0 (dec) | Cloridrato |
| 373 | -H | -H | -Br | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 119,0-120,0 | — |
| 374 | $-OCH_3$ | -H | $-CO_2H$ | -H | -H | Pó branco (Água) | 121,0-124,5 | — |
| 375 | -Cl | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | -H | Pó amarelo claro (Etanol/éter isopropílico) | 122,0-123,5 | — |
| 376 | -H | -H | $-CH_2CO_2CH_3$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 213,5-221,5 (dec) | Cloridrato |
| 377 | -H | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | -F | Pó branco (Acetato de etila) | 231,5-233,5 | Cloridrato |

[Tabela 58]



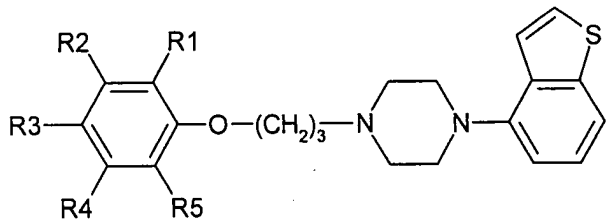

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão(°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 378 | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | -Cl | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 273,0 (dec) | Cloridrato |
| 379 | -H | -H | $-CH_2CO_2H$ | -H | -H | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 217,0-222,0 | Cloridrato |
| 380 | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | -F | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 267,0 (dec) | Cloridrato |
| 381 | -H | -H | $-CH_2CH_2NHCH_3$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 258,0 (dec) | Dicloridrato |
| 382 | -H | -H | $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 236,5 (dec) | Dicloridrato |
| 383 | -H | -H | $-CH_2CH_2N(CH_3)COCH_3$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 215,0-217,0 | Cloridrato |
| 384 | -H | -H | $-CH_2CH_2N(CH_3)COC_2H_5$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 211,0-217,0 | Cloridrato |
| 385 | -H | -H | $-CH_2CH_2N(CH_3)COC_6H_5$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 210,5-212,0 | Cloridrato |
| 386 | -H | -H | $-CH_2CH_2N(CH_3)CH_2C_6H_5$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 196,0-202,0 (dec) | Dicloridrato |
| 387 | -H | -H | $-CH_2CH_2NHC_2H_5$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 230,0 (dec) | Dicloridrato |

[Tabela 59]



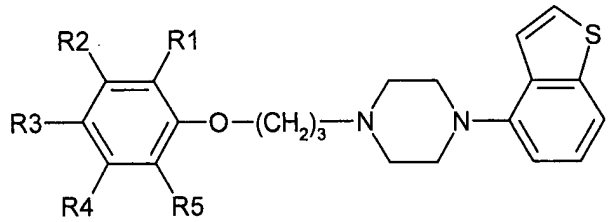

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão(°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 388 | -H | -H | $-CH_2CH_2NHCH_2CF_3$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 223,0 (dec) | Dicloridrato |
| 389 | -H | -H | $-CH_2CO_2C_2H_5$ | -H | -Cl | Pó branco (Acetato de etila) | 225,0-228,5 | Cloridrato |
| 390 | -H | -H | $-CH_2CO_2H$ | -H | -Cl | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 208,0-209,5 | Cloridrato |
| 391 | -H | -H | $-CH_2CO_2C_2H_5$ | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 205,5-213,5 | Cloridrato |
| 392 | $-CH_3$ | -H | -CN | -H | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 105,5-106,0 | — |
| 393 | -H | -H | $-CH_2CO_2H$ | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 198,5-201,0 | Cloridrato |
| 394 | -H | -H | $-SO_2NH_2$ | -H | -H | Pó branco (Etanol) | 199,0-203,0 | — |
| 395 | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 280,0 (dec) | Cloridrato |
| 396 | -H | -H | $-CH_2CO_2C_2H_5$ | -H | -F | Pó branco (Acetato de etila) | 220,5-224,0 | Cloridrato |
| 397 | -H | -H | $-CH_2CO_2H$ | -H | -F | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 181,5-184,5 | Cloridrato |

[Tabela 60]



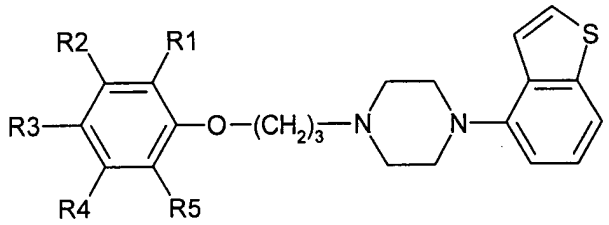

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão(°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 398 | -H | -H | -CN | $-OCH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 238,0 (dec) | Cloridrato |
| 399 | -H | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | -Br | Pó branco (Acetato de etila) | 237,5-242,5 (dec) | Cloridrato |
| 400 | -H | -CN | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 217,5-221,0 (dec) | Cloridrato |
| 401 | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | -Br | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 271,0 (dec) | Cloridrato |
| 402 | -H | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 242,5-244,5 | Cloridrato |
| 403 | -H | -H | -H | -H | -CN | Pó branco (Acetato de etila) | 221,5-226,0 | Cloridrato |
| 404 | -CN | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 128,5-130,0 | – |
| 405 | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | -CN | Pó branco (Diclorometano/água) | 271,0 (dec) | Cloridrato |
| 406 | $-CONHC_2H_5$ | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 220,0-227,5 | Cloridrato |
| 407 | -H | -H | $-CO_2C_2H_5$ | $-CF_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 224,5-232,0 | Cloridrato |

[Tabela 61]



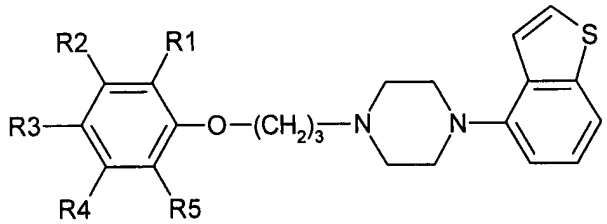

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão(°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 408 | -H | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -Cl | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 216,5-219,0 | Cloridrato |
| 409 | -H | -H | $-CO_2H$ | -Cl | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 259,0 (dec) | Cloridrato |
| 410 | -H | $-OCH_3$ | -CHO | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila 2-propanol) | 118,0-119,5 | — |
| 411 | -H | -H | $-CO_2H$ | $-CF_3$ | -H | Pó branco (Água) | 240,0 (dec) | Cloridrato |
| 412 | -H | -H | -CN | $-CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 230,0-237,0 | Cloridrato |
| 413 | $-NO_2$ | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila/éter isopropílico) | 113,0-114,0 | — |
| 414 | -H | -H | -CHO | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 102,5-105,5 | — |
| 415 | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | $-NO_2$ | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 259,0 (dec) | Dicloridrato |
| 416 | -H | -H | $-CH=CHCO_2H$ | -H | -H | Pó branco (Ácido clorídrico/água) | 265,0 (dec) | Cloridrato |
| 417 | -H | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | $-CF_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 211,5-221,0 | Cloridrato |

[Tabela 62]



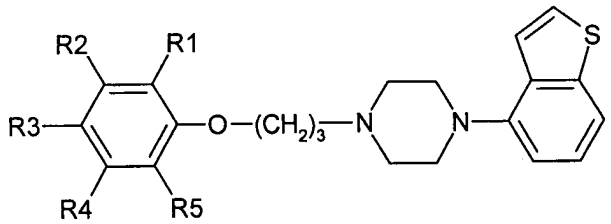

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão(°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 418 | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | $-CF_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 269,0 (dec) | Cloridrato |
| 419 | -H | $-CH_2CO_2C_2H_5$ | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 206,0-208,0 | Cloridrato |
| 420 | -H | -H | $-CH=CHCONH_2$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 210,5-215,0 | — |
| 421 | -H | $-CH_2CO_2H$ | -H | -H | -H | Pó marrom claro (Acetato de etila) | 255,0 (dec) | Cloridrato |
| 422 | -H | -H | $-CH=CHCONHCH_3$ | -H | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 165,5-169,0 | — |
| 423 | -H | -H | $-CH=CHCON(CH_3)_2$ | -H | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 130,5-131,5 | — |
| 424 | -H | -H | $-CH=CHCONHC_2H_5$ | -H | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 158,0-159,0 | — |
| 425 | -H | -H | $-CH=CHCONHCH_2CF_3$ | -H | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 177,5-180,0 | — |
| 426 | -H | -H | $-(CH_2)_2CO_2C_2H_5$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 235,0-237,5 | Cloridrato |
| 427 | -F | -H | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 218,5-224,0 | Cloridrato |

[Tabela 63]



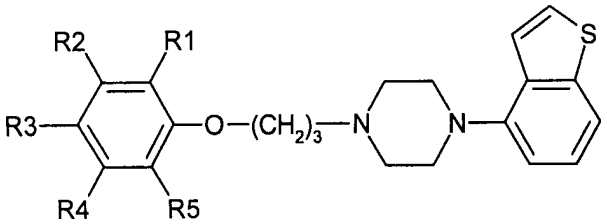

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão(°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 428 | -H | -H | $-CH_2CH_2CO_2H$ | -H | -H | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 240,0 (dec) | Cloridrato |
| 429 | -F | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 260,0 (dec) | Cloridrato |
| 430 | -Cl | -H | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 241,0-245,0 | Cloridrato |
| 431 | -Cl | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 268,0 (dec) | Cloridrato |
| 432 | $-CH_3$ | -H | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 238,0-242,0 (dec) | Cloridrato |
| 433 | $-CH_3$ | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (éter isopropílico) | 106,0-108,0 | — |
| 434 | $-CH_3$ | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 256,5 (dec) | Cloridrato |
| 435 | $-CH_3$ | -H | $-CO_2H$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Água) | 252,5 (dec) | Cloridrato |
| 436 | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 225,0-234,0 | Cloridrato |
| 437 | -H | -H | $-C(CH_3)_2CO_2CH_3$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 222,0-226,5 | Cloridrato |

[Tabela 64]



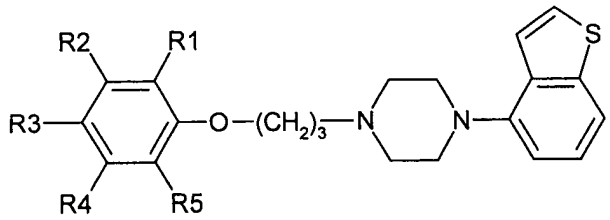

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 438 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 208,0-213,5 | Cloridrato |
| 439 | -H | -H | $-C(CH_3)_2CO_2H$ | -H | -H | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 257,5 (dec) | Cloridrato |
| 440 | -H | -H | $-CH_2CH_2CONH_2$ | -H | -H | Pó amarelo claro (95 % de 2-propanol) | 167,5-170,0 | — |
| 441 | -H | -H | $-CH_2CH_2CONHCH_3$ | -H | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 128,0-132,0 | — |
| 442 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | Pó branco (Ácido clorídrico/água) | 250,0 (dec) | Cloridrato |
| 443 | -H | -H | $-CH_2CH_2CONHC_2H_5$ | -H | -H | Pó branco (95 % de 2-propanol) | 130,5-132,0 | Cloridrato |
| 444 | -H | $-CH_2CONH_2$ | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 132,5-134,0 | Cloridrato |
| 445 | -H | -H | -H | $-CH_2CONHCH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 173,5-175,0 | Cloridrato |
| 446 | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | $-CO_2H$ | -H | Pó branco (Água) | 154,0-155,5 | Cloridrato |
| 447 | $-OCH_3$ | -H | $-CO_2C_2H_5$ | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 239,0-242,0 (dec) | Cloridrato |

[Tabela 65]



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 448 | $-OCH_3$ | -H | $-CO_2H$ | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Água) | 191,0-196,0 | — |
| 449 | -H | -H | $-CSNHC_2H_5$ | -H | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila/THF) | 193,0-196,5 | Dicloridrato |
| 450 | $-OCH_3$ | -H | $-COCH_3$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 243,0 (dec) | Cloridrato |
| 451 | $-CH_2CH=CH_2$ | -H | $-CO_2H$ | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Água) | 97,0-102,0 | — |
| 452 | $-C_3H_7$ | -H | $-CO_2H$ | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Água) | 145,5-150,5 | — |

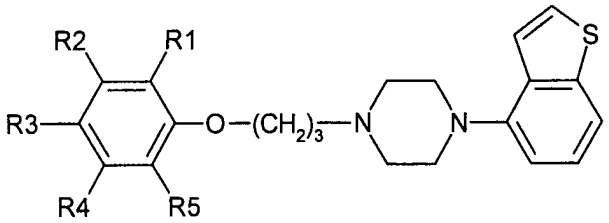
[Tabela 66]



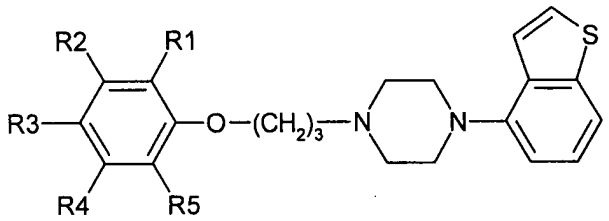
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 453 | -H | -H | | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/éter isopropílico) | 112,5-113,5 | - |
| 454 | -H | -H | | -H | -H | Pó branco | 112,0-113,0 | - |

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| | | | | | | (Acetato de etila/éter isopropílico) | | |

[Tabela 67]

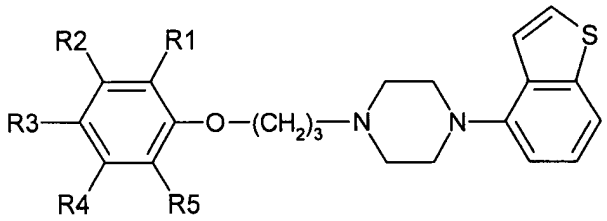


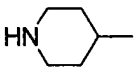
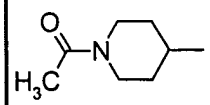

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 455 | -H | -H | -F | -H | -H | | Cloridrato |
| 456 | -H | -H | -H | -H | -H | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 2,15-2,30 (2H, m), 3,10-3,25 (2H, m), 3,25-3,60 (4H, m), 3,55-3,75 (4H, m), 4,10 (2H, t, J=6,0 Hz), 6,90-7,10 (4H, m), 7,25-7,40 (3H, m), 7,51 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,72 (1H, d, J=8,3 Hz), 7,78 (1H, d, J=5,5 Hz), 10,12 (1H, brs). | Cloridrato |

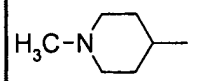



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 457 | -H | -H | -H | -H | -NHCOCH$_3$ | Cristal na forma de agulha incolor (Etanol) | 243,7 -244,8 | - |

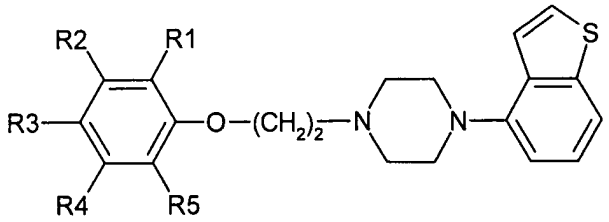
[Tabela 67-1]




| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 458 | -H | -H | $-COCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm : 2,20-2,40 (2H, m), 2,53 (3H, s), 3,20-3,70 (10H, m), 3,83 (3H, s), 4,19 (2H, t, J=5,8 Hz), 6,96 (1H, d, J=7,5 Hz), 7,10 (1H, d, J=8,5 Hz), 7,31 (1H, t, J=7,8 Hz), 7,45-7,50 (2H, m), 7,62 (1H, dd, J=2,0, 8,4 Hz), 7,69 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,76 (1H, d, J=5,5 Hz), 11,14 (1H, brs). | Cloridrato |
| 459 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | | Cloridrato |
| 460 | -H | -H |  | -H | -H | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,95-2,10 (6H, m), 2,60-2,75 (7H, m), 2,96 (2H, t, J=11,3 Hz), 3,21 (4H, brs), 3,55 (2H, d, J=12,4 Hz), 4,06 (2H, t, J=6,2 Hz), 6,80-6,95 (3H, m), 7,17 (2H, d, J=8,5 Hz), 7,25-7,35 (1H, m), 7,40 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,43 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,57 (1H, d, J=8,1 Hz). | |
| 461 | -H | -H |  | -H | -H | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,55-1,65 (2H, m), 1,80-1,95 (2H, m), 2,00-2,10 (2H, m), 2,13 (3H, s), 2,55-2,75 (7H, m), 3,10-3,20 (6H, m), 3,93 (1H, d, J=13,7 Hz), 4,05 (2H, t, J=6,4 Hz), 4,78 (1H, d, J=13,3 Hz), 6,85-6,95 (3H, m), 7,11 (2H, d, J=8,6 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,39 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,42 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz). | |

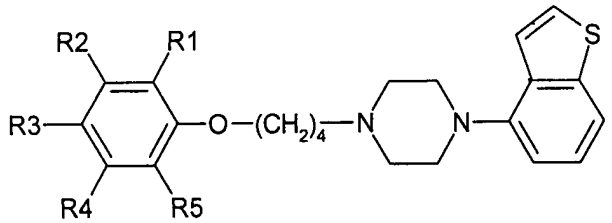
| | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 462 | -H | -H |  | -H | -H | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,75-1,85 (4H, m), 2,00-2,10 (4H, m), 2,32 (3H, s), 2,35-2,45 (1H, m), 2,63 (2H, t, J=7,4 Hz), 2,73 (4H, brs), 2,96 (2H, d, J=11,5 Hz), 3,20 (4H, brs), 4,04 (2H, t, J=6,3 Hz), 6,85-6,95 (3H, m), 7,14 (2H, d, J=8,6 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz). | |

[Tabela 68]



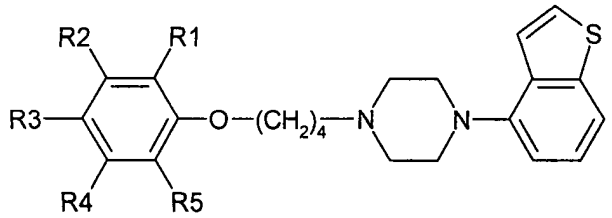

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 463 | -H | -H | -F | -H | -H | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 3,10-3,25 (2H, m), 3,40-3,75 (8H, m), 4,40-4,45 (2H, m), 6,98 (1H, d, J=7,7 Hz), 7,00-7,25 (4H, m), 7,33 (1H, dd, J=7,9, 7,8 Hz), 7,50 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,71 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,78 (1H, d, J=5,5 Hz), 10,37 (1H, brs). | Cloridrato |
| 464 | -H | -H | -H | -H | -H | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 3,10-3,35 (2H, m), 3,40-3,80 (8H, m), 4,48 (2H, t, J=4,8 Hz), 6,95-7,10 (4H, m), 7,25-7,40 (3H, m), 7,51 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,71 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,77 (1H, d, J=5,5 Hz), 10,80-11,20 (1H, br). | Cloridrato |

[Tabela 69]



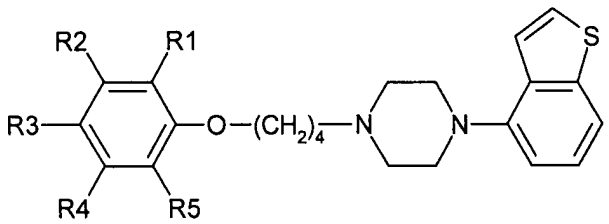

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 465 | -H | -H | -H | -H | -H | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,70-2,00 (4H, m), 3,10-3,40 (6H, m), 3,50-3,80 (4H, m), 4,03 (2H, t, J=5,9 Hz), 6,90-7,00 (5H, m), 7,25-7,40 (3H, m), 7,50 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,71 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,77 (1H, d, J=5,5 Hz), 10,59 (1H, brs) | Cloridrato |
| 466 | -H | -H | -F | -H | -H | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,75-1,95 (4H, m), 3,10-3,50 (6H, m), 3,50-3,65 (4H, m), 4,00 (2H, t, J=5,9 Hz), 6,90-7,00 (3H, m), 7,00-7,20 (2H, m), 7,32 (1H, dd, J=7,9, 7,8 Hz), 7,50 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,71 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,77 (1H, d, J=5,5 Hz), 10,40-10,60 (1H, br). | Cloridrato |
| 467 | -H | -H | -$COCH_3$ | -H | -$OCH_3$ | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,80-1,95 (4H, m), 2,52 (3H, s), 3,20-3,35 (6H, m), 3,50-3,65 (4H, m), 3,83 (3H, s), 4,00-4,15 (2H, m), 6,95 (1H, d, J=7,5 Hz), 7,08 (1H, d, J=8,5 Hz), 7,30 (1H, dd, J=7,8, 7,8 Hz), 7,40-7,50 (2H, m), 7,61 (1H, dd, J=1,9, 8,4 Hz), 7,69 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,75 (1H, d, J=5,6 Hz), 11,0 (1H, brs). | Cloridrato |

[Tabela 69-1]



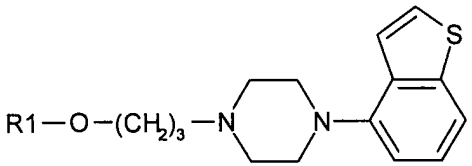

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 468 | -H | -H | $-NHCO_2CH_3$ | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 241,0 (dec) | Cloridrato |
| 469 | -H | -H | -H | $-NHCO_2CH_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 203,0-209,5 | Cloridrato |
| 470 | -H | -H | -CN | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 220,0-223,0 (dec) | Cloridrato |
| 471 | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | -H | Pó branco (Ácido clorídrico/ácido acético) | 247,5-250,0 (dec) | Cloridrato |
| 472 | -H | -CN | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 196,0-198,5 | Cloridrato |
| 473 | -H | -H | -H | $-CO_2H$ | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 255,5-258,5 | Cloridrato |
| 474 | -CN | -H | -H | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 187,5-188,5 | Cloridrato |
| 475 | -H | -H | -H | $-CONHCH_2CF_3$ | -H | Pó branco (Acetato de etila/2-propanol) | 137,0 (dec) | Cloridrato |
| 476 | -H | -H | -H | $-CONHC_2H_5$ | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila/2-propanol) | 130,0-135,0 | Cloridrato |
| 477 | -H | -H | -H | -H | $-CO_2H$ | Pó branco (Diclorometano/água) | 192,0-197,0 | Cloridrato |
| 478 | -H | $-CONH_2$ | -H | -H | -H | Pó amarelo claro (2-propanol) | 148,0-151,0 | – |

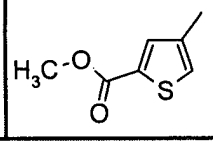
[Tabela 69-2]

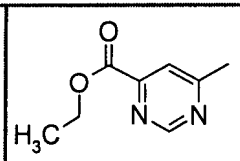
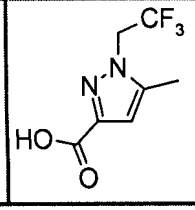



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 479 | -H | -H | -H | $-CONHCH_3$ | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 234,0-239,0 | Cloridrato |
| 480 | -H | -H | -H | $-CON(CH_3)_2$ | -H | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 135,0-141,5 | Cloridrato |
| 481 | -H | -H | -H | -H | $-CONHC_2H_5$ | Pó branco (Acetato de etila) | 209,5-213,0 | Cloridrato |

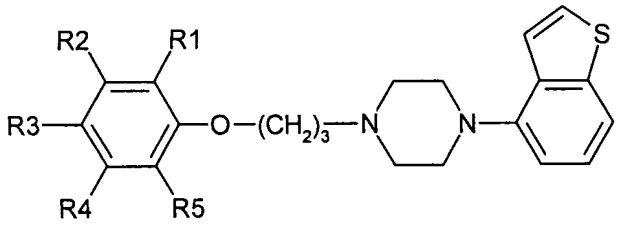
[Tabela 70]

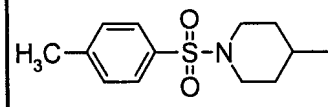



| Exemplo | R1 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|
| 482 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,00-2,10 (2H, m), 2,63 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,70-2,80 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3,89 (3H, s), 4,00-4,10 (2H, m), 6,57 (1H, d, J=1,9 Hz), 6,91 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,20-7,35 (2H, m), 7,35-7,50 (3H, m), 7,56 (1H, d, J=8,0 Hz). | — |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 483 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,44(3H, t, 7,0Hz), 2,01-2,12(2H, m), 2,63(2H, t, J=7,5Hz), 2,67-2,81(4H, m), 3,12-3,29(4H, m), 4,44-4,55(4H, m), 6,90(1H, d, J=7,5Hz), 7,27(1H, dd, J=5,5Hz, 7,5Hz), 7,40(2H, dd, J=5,5Hz, 8,0Hz), 7,44(1H, d, J=1,0Hz), 7,55(1H, d, J=8,0Hz), 8,90(1H, d, J=1,0Hz) | _ |
| 484 |  | RMN-$^1$H ($DMSO-d_6$) δppm : 1,83-2,00 (2H, m), 2,59-2,70 (4H, m), 3,00-3,15(4H, m), 3,17(1H, d, J=4,5Hz), 3,31(1H, d, J=4,5Hz), 4,15 (2H, t, J=6,0 Hz), 4,77(2H, q, J=8,8Hz), 6,90 (1H, d, J=7,3Hz), 7,27 (1H, t, J=7,8Hz), 7,40(1H, d, J=5,5Hz), 7,61(1H, d, J=8,0Hz), 7,69(1H, d, J=5,5Hz). | _ |

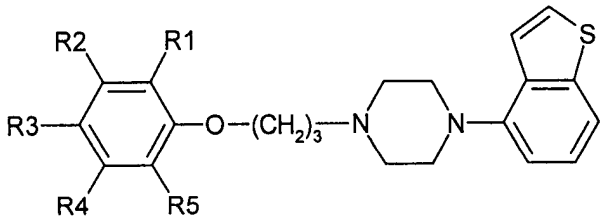
[Tabela 71]



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 485 | -H | -H | $-(CH_2)_2N(CH_3)CO_2C(CH_3)_3$ | -H | -H | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,43(9H, s), 1,97-2,07 (2H, m), 2,64(2H, t, J=7,5Hz), 2,69-2,87(6H, m), 2,81(3H, s), 3,15-3,27(4H, m), 3,38 (2H, t, J=7,5Hz), 4,04 (2H, t, J = 6,3Hz), 6,83-6,92 (3H, m), 7,02-7,15(2H, m), 7,28(1H, t, J=7,8Hz), 7,37-7,43 (2H, m), 7,55(1H, d, J=8,0Hz) | _ |
| 486 | -H | -H |  | -H | -H | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,60-2,10 (6H, m), 2,30-2,40 (2H, m), 2,47 (3H, s), 2,60-2,70 (1H, m), 2,74 (4H, br), 2,85-3,00 (2H, m), 3,20 (4H, br), 3,90-4,10 (4H, m), 6,85-6,95 (2H, m), 7,07 (1H, d, J=8,6 Hz), 7,25-7,45 (3H, m), 7,56 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,69 (2H, d, J=8,2 Hz). | _ |
| 487 | -H | -H | -H | -H | $-CO_2H$ | RMN-$^1$H ($DMSO-d_6$) δppm : 2,20-2,43 (2H, m), 3,17-3,77 (10H, m), 4,30 (2H, t, J=6,0 Hz), 6,90-7,20 (2H, m), 7,30-7,40 (2H, m), 7,50-7,63 (1H, | — |

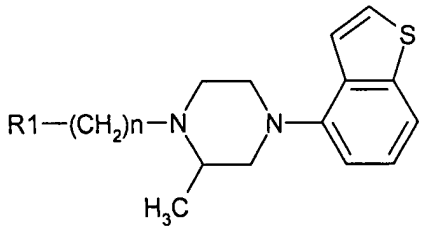
| | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| | | | | | | m), 7,70-7,79 (4H, m), 11,00 (1H, br), 12,71(1H, br). | |
| 488 | -$OCH_3$ | -H | -$CO_2CH_3$ | -H | -$CH_3$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,31 (3H, s), 2,60-2,80 (6H, m), 3,10-3,30 (4H, m), 3,89 (6H, s), 4,10 (2H, t, J = 6,4Hz), 6,90 (1H, dd, J = 0,5, 7,6Hz), 7,27 (1H, dd, J = 7,8, 7,8Hz), 7,35-7,45 (3H, m), 7,50-7,60 (2H, m). | — |
| 489 | -$OCH_3$ | -H | -$CO_2H$ | -H | -$CH_3$ | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm : 1,90-2,05 (2H, m), 2,26 (3H, s), 2,55-3,30 (10H, m), 3,85 (3H, s), 4,03 (2H, t, J = 6,1Hz), 6,93 (1H, d, J = 7,6Hz), 7,29 (1H, dd, J = 7,8, 7,8Hz), 7,35-7,50 (3H, m), 7,65 (1H, d, J = 8,0Hz), 7,72 (1H, d, J = 5,5Hz), 11,50-13,50 (1H, br). | — |

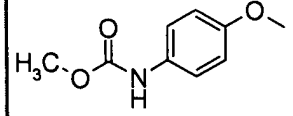
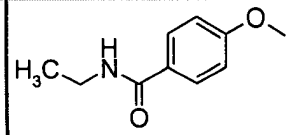
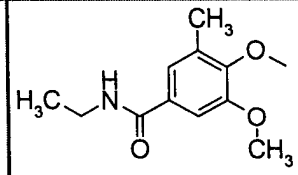
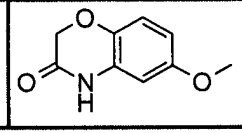
[Tabela 71-1]



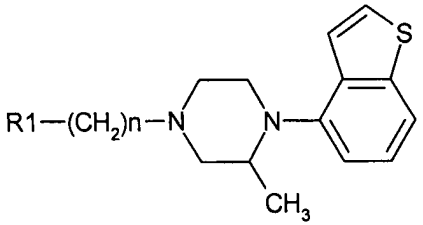

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 490 | -$CH_2CH=CH_2$ | -H | -$CO_2CH_3$ | -H | -$OCH_3$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,98-2,09(2H, m), 2,70-2,83(6H, m), 3,13-3,30(4H, m), 3,45(2H, d, J=6,5Hz), 3,89(3H, s), 4,10(2H, t, J=6,4Hz), 5,04-5,11(2H, m), 5,91-6,09(1H, m), 6,90(1H, d, J=7,5Hz), 7,24-7,31(1H, m), 7,38-7,44(2H, m), 7,47-7,57(3H, m). | — |
| 491 | -$C_3H_7$ | -H | -$CO_2CH_3$ | -H | -$OCH_3$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 0,97(3H, t, J=7,3Hz), 1,52-1,74(2H, m), 1,93-2,13(2H, m), 2,57-2,85(6H, m), 3,07-3,30(4H, m), 3,89(6H, s), 4,09(2H, t, J=6,3Hz), 6,90(1H, d, J=7,5Hz), 7,24-7,31(1H, m), 7,38-7,45(3H, m), 7,52-7,57(2H, m). | — |

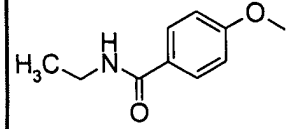
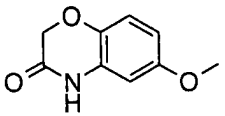
[Tabela 72]



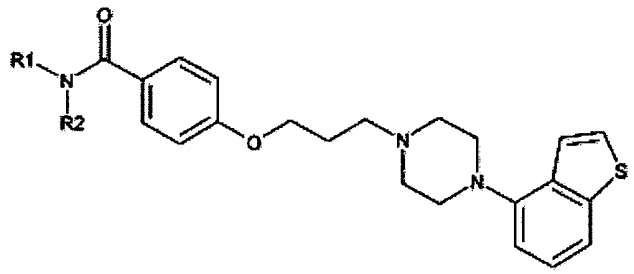
| Exemplo | R1 | n | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|
| 492 |  | 3 | Pó branco (Acetato de etila) | 129,0-138,5 | Cloridrato |
| 493 |  | 3 | Pó branco (Acetato de etila) | 130,0-136,0 | Cloridrato |
| 494 |  | 3 | Pó branco | | Fumarato |
| 495 |  | 4 | Pó branco (Acetonitrila) | 154-156 | Dicloridrato |

[Tabela 73]



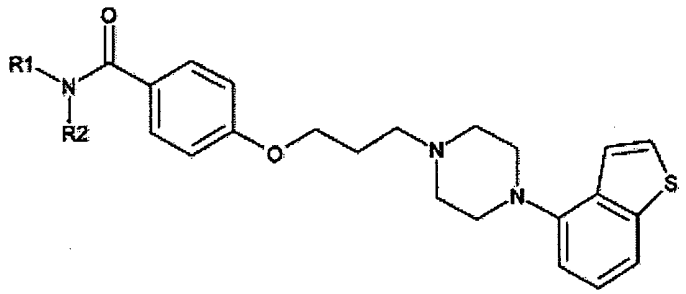
| Exemplo | R1 | n | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|
| 496 |  | 3 | Pó branco (Acetato de etila) | 151,5-156,5 | Cloridrato |
| 497 |  | 4 | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 220-225 | Dicloridrato |

[Tabela 74]



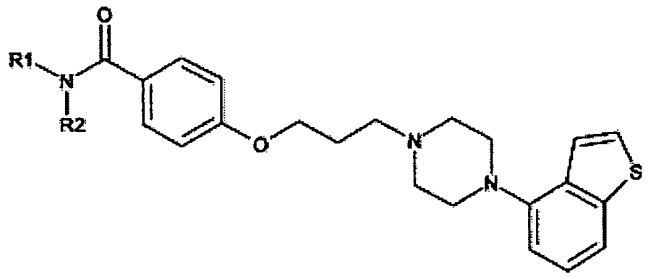
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 498 | -H | -cyclo-$C_6H_{11}$ | 478 |
| 499 | -$CH_2CH(CH_3)_2$ | -$CH_2CH(CH_3)_2$ | 508 |
| 500 | -$CH_2CH_2OH$ | -$CH_2CH_2OH$ | 484 |
| 501 | -$CH_3$ | -$CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | 481 |
| 502 | -$CH_2CH_2OCH_3$ | -$CH_2CH_2OCH_3$ | 512 |
| 503 | -$C_3H_7$ | -$CH_2$-cyclo-$C_3H_5$ | 492 |
| 504 | -$CH_2CH=CH_2$ | -cyclo-$C_5H_9$ | 504 |
| 505 | -$C_2H_5$ | -$C_2H_5$ | 452 |
| 506 | -H | -$C_4H_9$ | 452 |
| 507 | -H | -$C(CH_3)_3$ | 452 |
| 508 | -H | -cyclo-$C_7H_{13}$ | 492 |
| 509 | -$C_2H_5$ | -cyclo-$C_6H_{11}$ | 506 |
| 510 | -$C_2H_5$ | -$CH(CH_3)_2$ | 466 |
| 511 | -H | -$CH_2CH(CH_3)_2$ | 452 |
| 512 | -H | -$CH_2CH_2OCH_3$ | 454 |
| 513 | -H | -$CH_2CH_2OC_2H_5$ | 468 |
| 514 | -H | -$(CH_2)_3OC_2H_5$ | 482 |
| 515 | -H | -1-$CH_3$-CYCLOHEXYL | 492 |
| 516 | -H | -$CH_2$-cyclo-$C_3H_5$ | 450 |
| 517 | -H | -$CH_2$-cyclo-$C_6H_{11}$ | 492 |
| 518 | -H | -$CH_2CO_2CH_3$ | 468 |
| 519 | -H | -$CH_2CONH_2$ | 453 |
| 520 | -$CH_3$ | -$CH_2CO_2CH_3$ | 482 |
| 521 | -H | -$CH_2CCH$ | 434 |
| 522 | -$CH_3$ | -$CH(CH_3)_2$ | 452 |
| 523 | -H | -$(CH_2)_2CH(CH_3)_2$ | 466 |
| 524 | -H | -$CH(CH_3)C(CH_3)_3$ | 480 |
| 525 | -H | -$CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | 467 |
| 526 | -$CH_3$ | -$CH_2$-cyclo-$C_3H_5$ | 464 |
| 527 | -H | -$CH_2CF_3$ | 478 |
| 528 | -$CH_3$ | -cyclo-$C_6H_{11}$ | 492 |
| 529 | -$C_2H_5$ | -$CH_2CH_2OH$ | 468 |
| 530 | -$CH_2CH_2OH$ | -cyclo-$C_6H_{11}$ | 522 |
| 531 | -H | -cyclo-$C_5H_9$ | 464 |
| 532 | -H | -3-PYRIDYL | 473 |
| 533 | -H | -4-PYRIDYL | 473 |
| 534 | -$CH_2CH_2OH$ | -$C_6H_5$ | 516 |

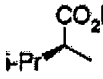
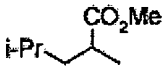
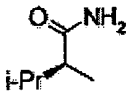
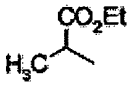
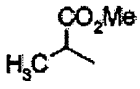
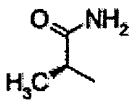
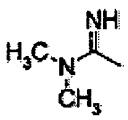
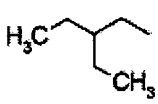
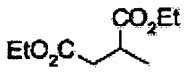
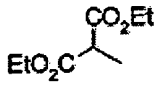
[Tabela 75]



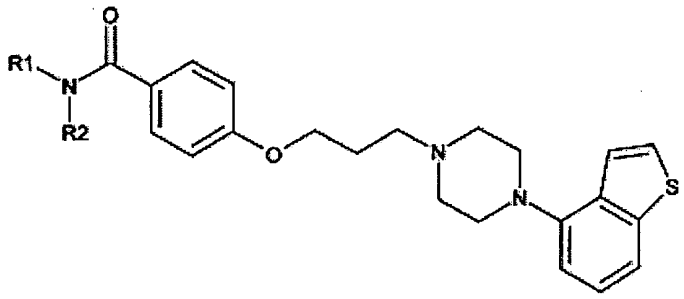
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 535 | -H | $-C_6H_5$ | 435 |
| 536 | -H | $-CH_2CH_2C(CH_3)_3$ | 468 |
| 537 | -H | $-CH(C_2H_5)_2$ | 449 |
| 538 | -H | $-CH_2CN$ | 566 |
| 539 | -H | $-(CH_2)_3OCH_3$ | 523 |
| 540 | -H | $-CH_2CH_2CN$ | 523 |
| 541 | $-(CH_2)_3N(CH_3)_2$ | $-(CH_2)_3N(CH_3)_2$ | 481 |
| 542 | $-CH_3$ | $-(CH_2)_3N(C_2H_5)_2$ | 482 |
| 543 | $-C_2H_5$ | $-(CH_2)_2N(C_2H_5)_2$ | 523 |
| 544 | -H | $-(CH_2)_2NHCOCH_3$ | 481 |
| 545 | -H | $-(CH_2)_5OH$ | 495 |
| 546 | -H | $-(CH_2)_2N(I\text{-}Pr)_2$ | 524 |
| 547 | -H | $-(CH_2)_3N(CH_3)_2$ | 524 |
| 548 | -H | $-(CH_2)_2N(C_2H_5)_2$ | 563 |
| 549 | $-CH_3$ | $-(CH_2)_3CO_2C_2H_5$ | 509 |
| 550 | -H | $-(CH_2)_4CO_2C_2H_5$ | 493 |
| 551 | -cyclo-$C_5H_9$ | $-(CH_2)_2N(C_2H_5)_2$ | 528 |
| 552 | $-CH_3$ | $-(CH_2)_2N(C_2H_5)_2$ | 484 |
| 553 | -H | $-NHCH_2CF_3$ | 496 |
| 554 | -H | $-CH_2CF_2CF_3$ | 482 |
| 555 | -H | $-CH_2CH(OCH_3)_2$ | 442 |
| 556 | -H | $-(CH_2)_3OCH(CH_3)_2$ | 467 |
| 557 | -H | $-(CH_2)_2OCH(CH_3)_2$ | 470 |
| 558 | -H | $-CH_2CH_2F$ | 435 |
| 559 | -H | $-CH_2CONHCH_3$ | 468 |
| 560 | -H | $-CH_2CH_2SCH_3$ | 449 |

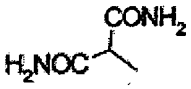
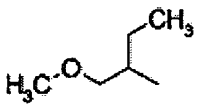
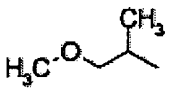
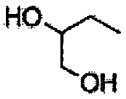
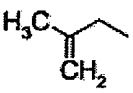
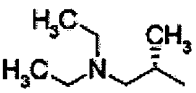
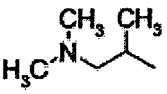
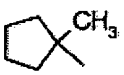
[Tabela 76]



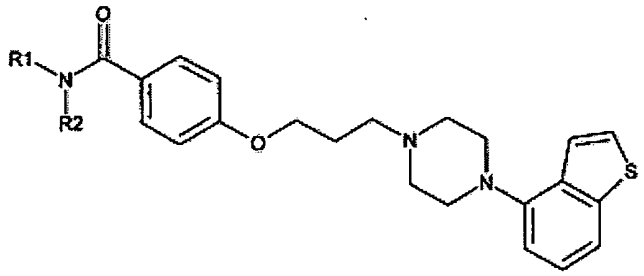
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 561 | -H |  | 510 |
| 562 | -H |  | 524 |
| 563 | -H |  | 495 |
| 564 | -H |  | 496 |
| 565 | -H |  | 482 |
| 566 | -H |  | 467 |
| 567 | -H |  | 466 |
| 568 | -H |  | 480 |
| 569 | -H |  | 568 |
| 570 | -H |  | 554 |

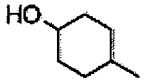
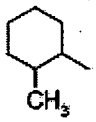
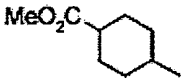
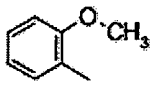
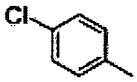
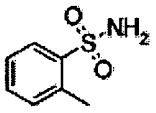
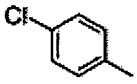
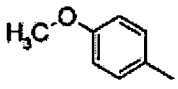
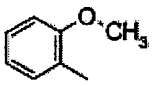
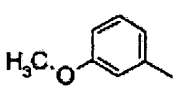
[Tabela 77]



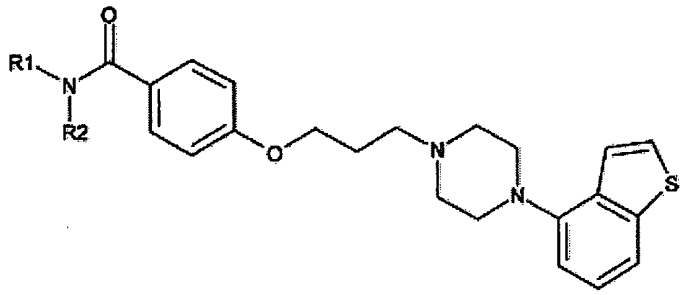
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 571 | -H |  | 496 |
| 572 | -H |  | 482 |
| 573 | -H |  | 468 |
| 574 | -H |  | 470 |
| 575 | -H |  | 450 |
| 576 | -H |  | 509 |
| 577 | -H |  | 481 |
| 578 | -H |  | 450 |
| 579 | -H |  | 478 |

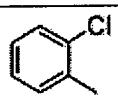
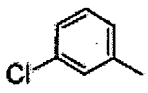
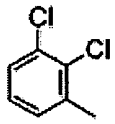
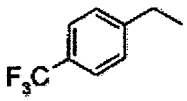
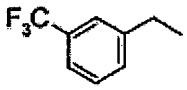
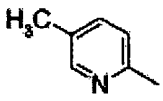
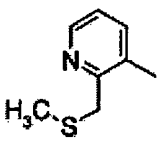
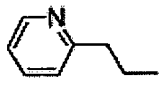
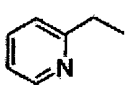
[Tabela 78]



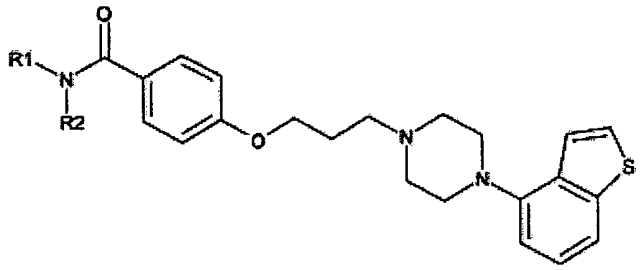
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 580 | -H |  | 494 |
| 581 | -H |  | 492 |
| 582 | -H |  | 536 |
| 583 | -$CH_3$ |  | 516 |
| 584 | -$CH_3$ |  | 520 |
| 585 | -H |  | 551 |
| 586 | -H |  | 506 |
| 587 | -H |  | 502 |
| 588 | -H |  | 502 |
| 589 | -H |  | 502 |

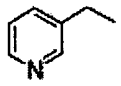
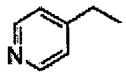
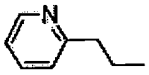
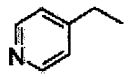
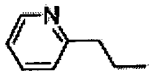
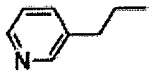
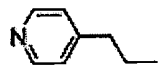
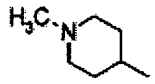
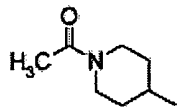
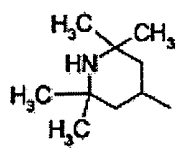
[Tabela 79]



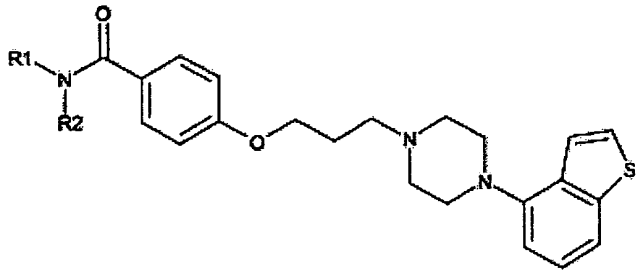
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 590 | -H |  | 506 |
| 591 | -H |  | 506 |
| 592 | -H |  | 540 |
| 593 | -H |  | 554 |
| 594 | -H |  | 554 |
| 595 | -H |  | 487 |
| 596 | -H |  | 533 |
| 597 | -$CH_3$ |  | 515 |
| 598 | -H |  | 487 |

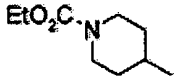
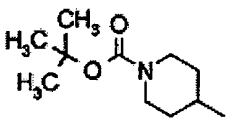
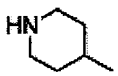
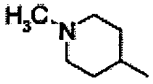
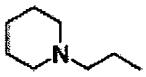
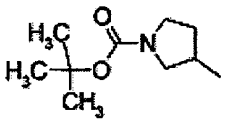
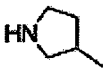
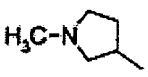
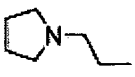
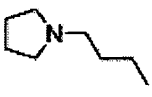
[Tabela 80]



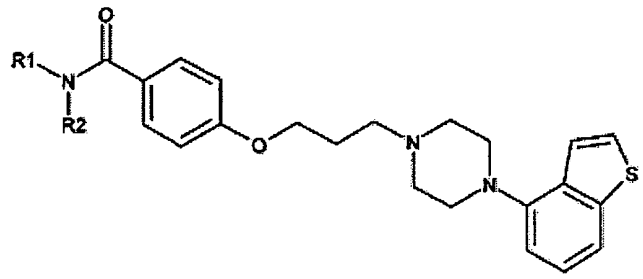
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 599 | -H |  | 487 |
| 600 | -H |  | 487 |
| 601 | $-C_2H_5$ |  | 529 |
| 602 | $-C_2H_5$ |  | 515 |
| 603 | -H |  | 501 |
| 604 | -H |  | 501 |
| 605 | -H |  | 501 |
| 606 | $-CH_3$ |  | 507 |
| 607 | $-CH_3$ |  | 535 |
| 608 | -H |  | 535 |

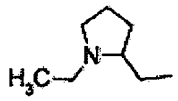
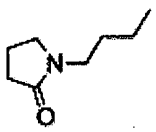
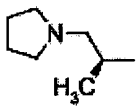
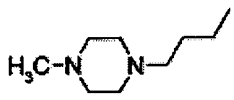
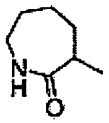
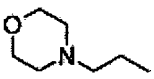
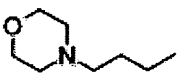
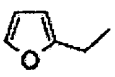
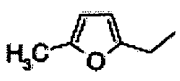
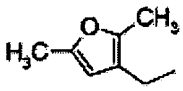
[Tabela 81]



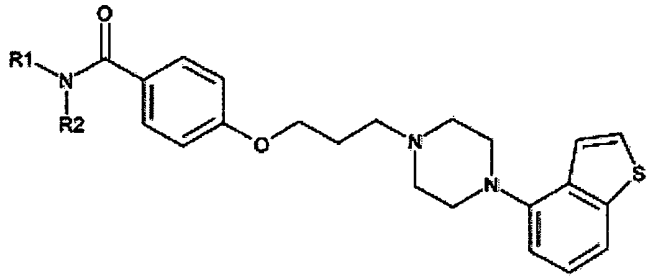
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 609 | -H |  | 551 |
| 610 | -H |  | 579 |
| 611 | -H |  | 479 |
| 612 | -H |  | 493 |
| 613 | -H |  | 507 |
| 614 | -H |  | 565 |
| 615 | -H |  | 465 |
| 616 | -H |  | 479 |
| 617 | -H |  | 493 |
| 618 | -H |  | 507 |

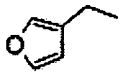
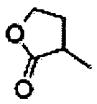
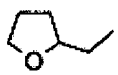
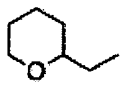
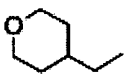
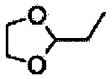
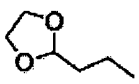
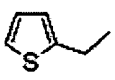
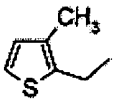
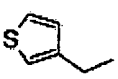
[Tabela 82]



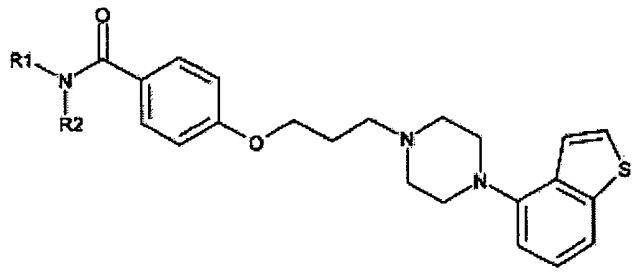
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 619 | -H |  | 507 |
| 620 | -H |  | 521 |
| 621 | -H |  | 507 |
| 622 | -H |  | 536 |
| 623 | -H |  | 507 |
| 624 | -H |  | 509 |
| 625 | -H |  | 523 |
| 626 | -H |  | 476 |
| 627 | -H |  | 490 |
| 628 | -H |  | 504 |

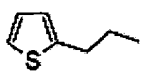
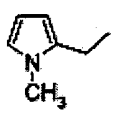
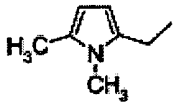
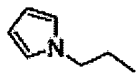
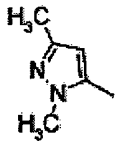
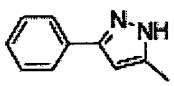
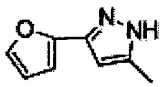
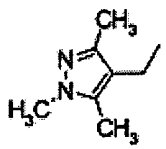
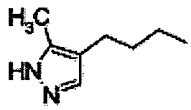
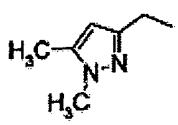
[Tabela 83]



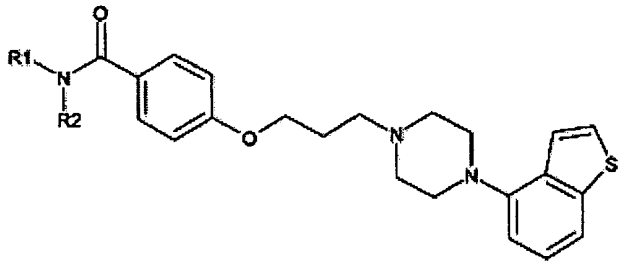
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 629 | -H |  | 476 |
| 630 | -H |  | 480 |
| 631 | -H |  | 480 |
| 632 | -$C_2H_5$ |  | 522 |
| 633 | -H |  | 494 |
| 634 | -H |  | 482 |
| 635 | -H |  | 496 |
| 636 | -H |  | 492 |
| 637 | -H |  | 506 |
| 638 | -H |  | 492 |

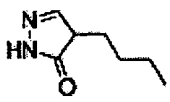
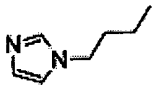
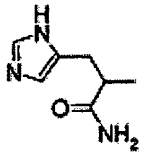
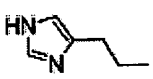
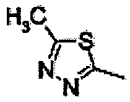
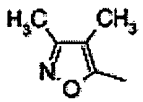
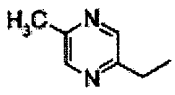
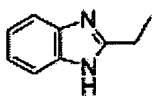
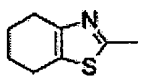
[Tabela 84]



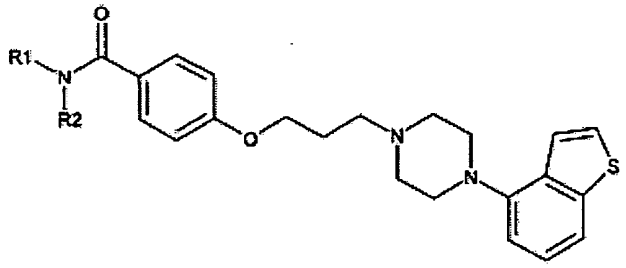
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 639 | -H |  | 506 |
| 640 | -H |  | 489 |
| 641 | -H |  | 503 |
| 642 | -H |  | 489 |
| 643 | -H |  | 490 |
| 644 | -H |  | 538 |
| 645 | -H |  | 528 |
| 646 | -H |  | 518 |
| 647 | -H |  | 518 |
| 648 | -H |  | 504 |

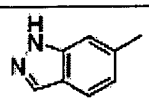
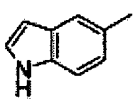
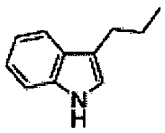
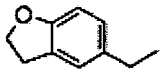
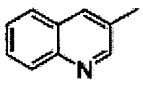
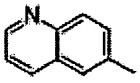
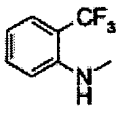
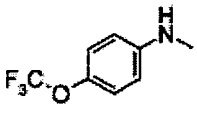
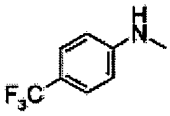
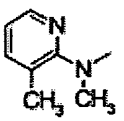
[Tabela 85]



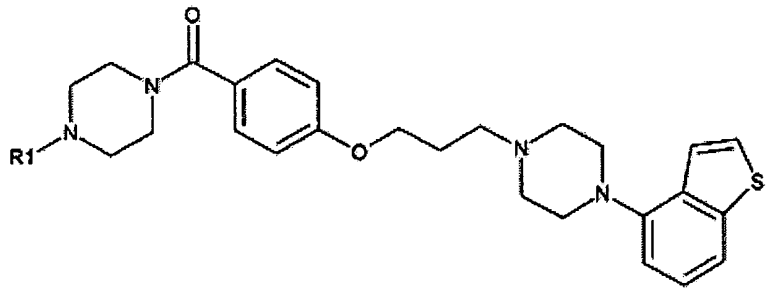
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 649 | -H |  | 520 |
| 650 | -H |  | 504 |
| 651 | -H |  | 533 |
| 652 | -H |  | 490 |
| 653 | -H |  | 479 |
| 654 | -H |  | 494 |
| 655 | -H |  | 491 |
| 656 | -H |  | 502 |
| 657 | -H |  | 526 |
| 658 | -H |  | 533 |

[Tabela 86]



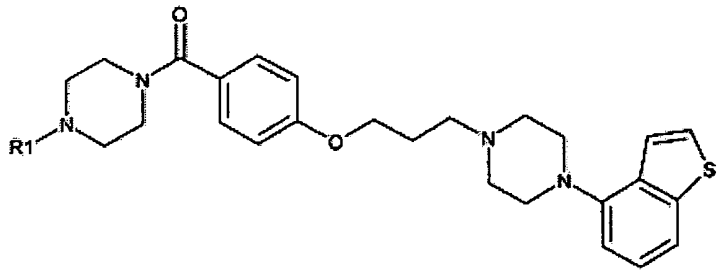
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 659 | -H |  | 512 |
| 660 | -H |  | 511 |
| 661 | -H |  | 539 |
| 662 | -H |  | 528 |
| 663 | -H |  | 523 |
| 664 | -H |  | 523 |
| 665 | -H |  | 555 |
| 666 | -H |  | 571 |
| 667 | -H |  | 555 |
| 668 | -H |  | 570 |

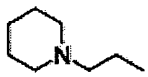
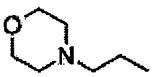
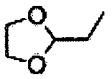
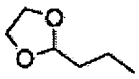
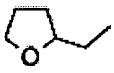
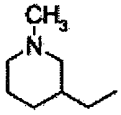
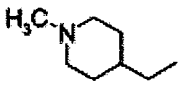
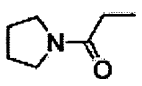
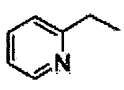
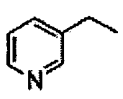
[Tabela 87]



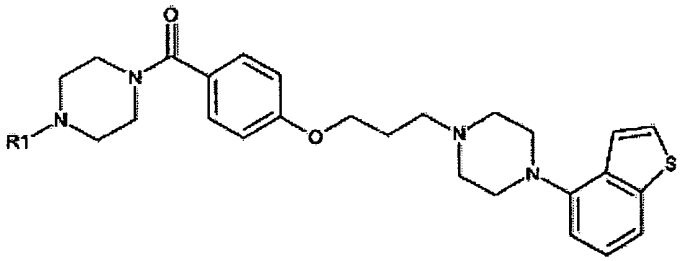

| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 669 | -H | 465 |
| 670 | $-C_4H_9$ | 521 |
| 671 | $-CH(C_2H_5)_2$ | 535 |
| 672 | $-CH(CH_3)_2$ | 507 |
| 673 | $-C(CH_3)_3$ | 535 |
| 674 | $-C_3H_7$ | 507 |
| 675 | $-C_2H_5$ | 493 |
| 676 | $-C_6H_{13}$ | 549 |
| 677 | -cyclo-$C_5H_9$ | 533 |
| 678 | -cyclo-$C_7H_{13}$ | 561 |
| 679 | $-CH_2CH_2OH$ | 509 |
| 680 | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 523 |
| 681 | $-(CH_2)_3OCH_3$ | 537 |
| 682 | $-(CH_2)_4OCH_3$ | 551 |
| 683 | $-CO_2C_2H_5$ | 537 |
| 684 | $-CO_2C(CH_3)_3$ | 565 |
| 685 | $-COCH_3$ | 507 |
| 686 | $-(CH_2)_3N(CH_3)_2$ | 550 |
| 687 | $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | 536 |

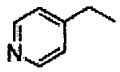
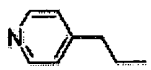
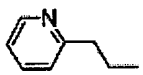
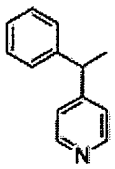
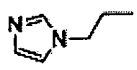
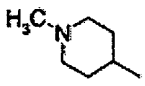
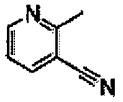
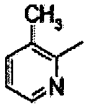
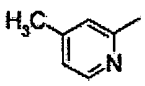
[Tabela 88]



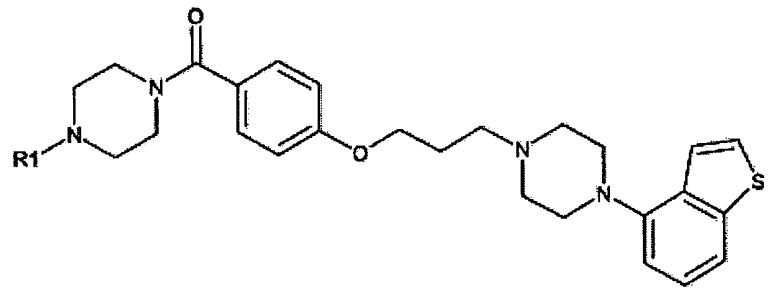
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 688 |  | 576 |
| 689 |  | 578 |
| 690 |  | 562 |
| 691 |  | 551 |
| 692 |  | 565 |
| 693 |  | 549 |
| 694 |  | 576 |
| 695 |  | 576 |
| 696 |  | 576 |
| 697 |  | 556 |
| 698 |  | 556 |

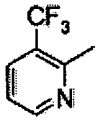
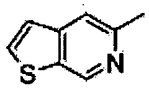
[Tabela 89]



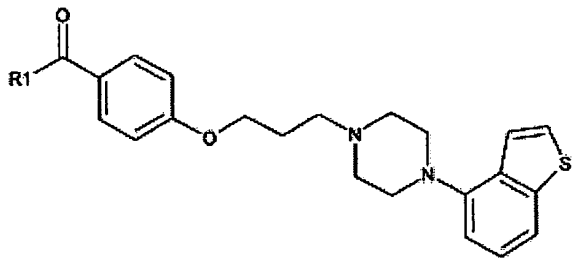
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 699 |  | 556 |
| 700 |  | 570 |
| 701 |  | 570 |
| 702 |  | 632 |
| 703 |  | 559 |
| 704 |  | 545 |
| 705 |  | 561 |
| 706 | -4-PIRIDILA | 542 |
| 707 | -3-PIRIDILA | 542 |
| 708 | -2-PIRIDILA | 542 |
| 709 |  | 567 |
| 710 |  | 556 |
| 711 |  | 556 |

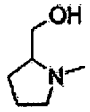
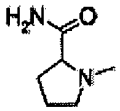
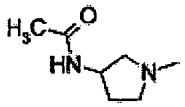
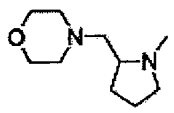
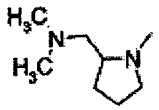
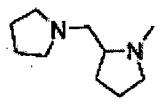
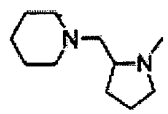
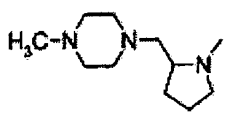
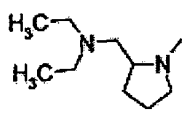
[Tabela 90]



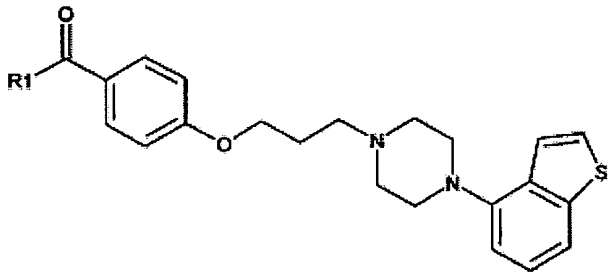
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 712 |  | 610 |
| 713 |  | 598 |

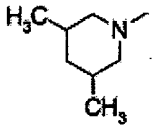
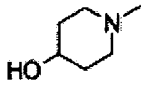
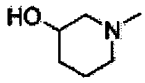
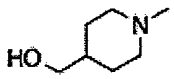
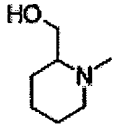
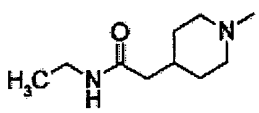
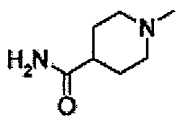
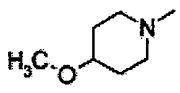
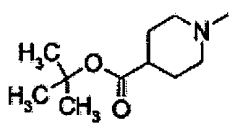
[Tabela 91]



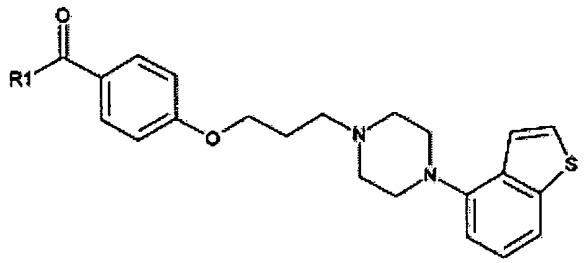
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 714 |  | 450 |
| 715 |  | 480 |
| 716 |  | 493 |
| 717 |  | 466 |
| 718 |  | 507 |
| 719 |  | 549 |
| 720 |  | 507 |
| 721 |  | 533 |
| 722 |  | 547 |
| 723 |  | 562 |
| 724 |  | 535 |

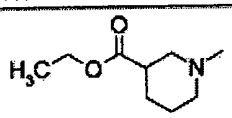
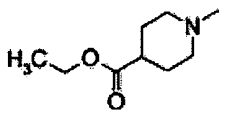
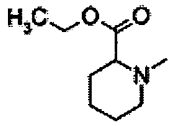
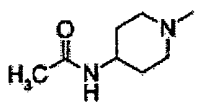
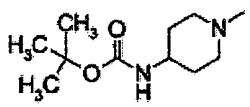
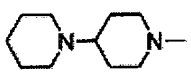
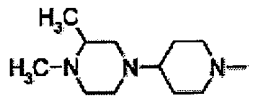
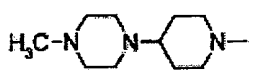
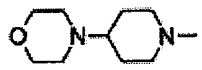
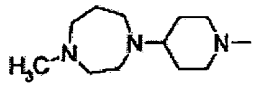
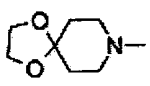
[Tabela 92]



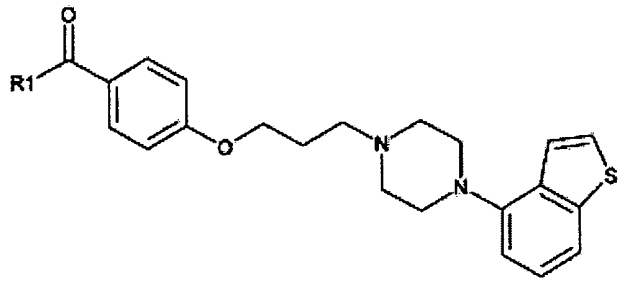
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 725 |  | 464 |
| 726 |  | 492 |
| 727 |  | 480 |
| 728 |  | 480 |
| 729 |  | 494 |
| 730 |  | 494 |
| 731 |  | 549 |
| 732 |  | 507 |
| 733 |  | 494 |
| 734 |  | 564 |

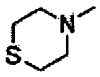
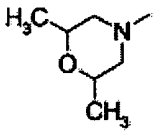
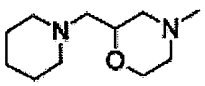
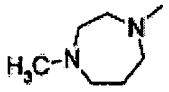
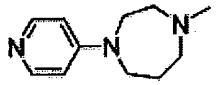
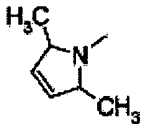
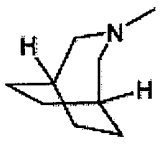
[Tabela 93]



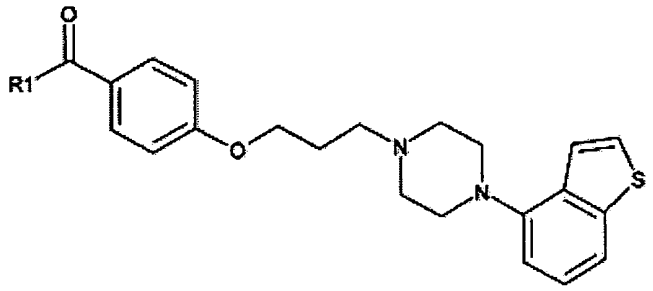
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 735 |  | 536 |
| 736 |  | 536 |
| 737 |  | 536 |
| 738 |  | 521 |
| 739 |  | 579 |
| 740 |  | 547 |
| 741 |  | 576 |
| 742 |  | 562 |
| 743 |  | 549 |
| 744 |  | 576 |
| 745 |  | 522 |

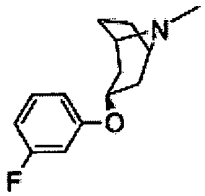
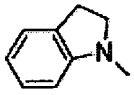
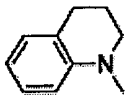
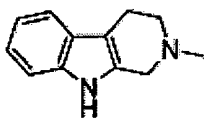
[Tabela 94]



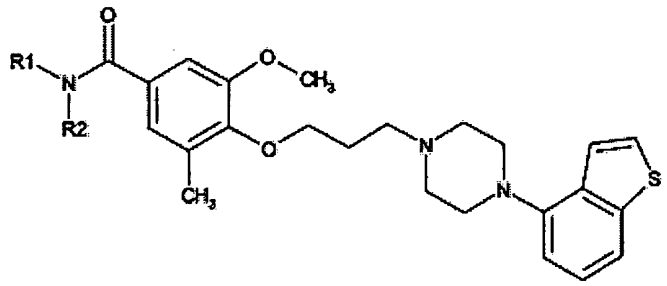
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 746 |  | 478 |
| 747 |  | 482 |
| 748 |  | 494 |
| 749 |  | 563 |
| 750 |  | 479 |
| 751 |  | 493 |
| 752 |  | 556 |
| 753 |  | 476 |
| 754 |  | 468 |
| 755 |  | 504 |

[Tabela 95]



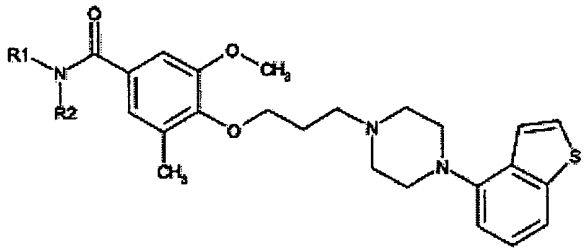
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 756 |  | 600 |
| 757 |  | 498 |
| 758 |  | 512 |
| 759 |  | 551 |

[Tabela 96]



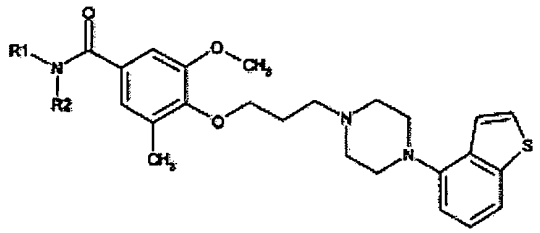
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 760 | -H | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 522 |
| 761 | -H | -$CH(CH_3)_2$ | 482 |
| 762 | -H | -$C_4H_9$ | 496 |
| 763 | -H | -ciclo-$C_3H_5$ | 480 |
| 764 | -H | -ciclo-$C_7H_{13}$ | 536 |
| 765 | -H | -$CH_2C_6H_5$ | 530 |
| 766 | -H | -$C_3H_7$ | 482 |
| 767 | -H | -$CH_2CH(CH_3)_2$ | 496 |
| 768 | -H | -$CH_2CH_2OCH_3$ | 498 |
| 769 | -H | -$CH_2CH_2OC_2H_5$ | 512 |
| 770 | -H | -$(CH_2)_3OC_2H_5$ | 526 |
| 771 | -H | -1-CH3- CICLOHEXILA | 536 |
| 772 | -H | -$(CH_2)_2OC_6H_5$ | 560 |
| 773 | -H | -cyclo-$C_5H_9$ | 508 |
| 774 | -H | -$CH_2$-ciclo-$C_3H_5$ | 494 |
| 775 | -H | -$CH_2$-ciclo-$C_6H_{11}$ | 536 |
| 776 | -H | -$CH(CH_3)C_6H_5$ | 544 |
| 777 | -H | -$(CH_2)_2C_6H_5$ | 544 |
| 778 | -H | -$CH_2CO_2CH_3$ | 512 |
| 779 | -H | -$CH_2CONH_2$ | 497 |
| 780 | -H | -$CH_2CCH$ | 478 |
| 781 | -H | -$(CH_2)_2CH(CH_3)_2$ | 510 |
| 782 | -H | -$CH(CH_3)C(CH_3)_3$ | 524 |
| 783 | -H | -$CH_2C(CH_3)_3$ | 510 |
| 784 | -$CH_3$ | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 536 |
| 785 | -$C_2H_5$ | -$C_2H_5$ | 496 |
| 786 | -H | -$C(CH_3)_3$ | 496 |
| 787 | -$CH_3$ | -$CH_2C_6H_5$ | 544 |
| 788 | -$C_2H_5$ | -$CH(CH_3)_2$ | 510 |
| 789 | -$CH_3$ | -$CH_2CO_2CH_3$ | 526 |
| 790 | -$CH_3$ | -$CH(CH_3)_2$ | 496 |
| 791 | -$CH_3$ | -$CH_2$-ciclo-$C_3H_5$ | 508 |
| 792 | -H | -$CH_2CF_3$ | 522 |
| 793 | -H | -$CH(C_2H_5)_2$ | 510 |

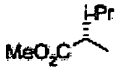
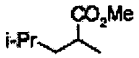
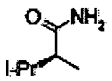
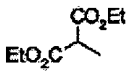
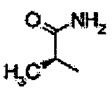
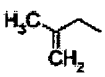
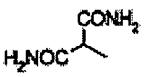
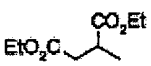
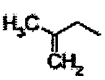
[Tabela 97]



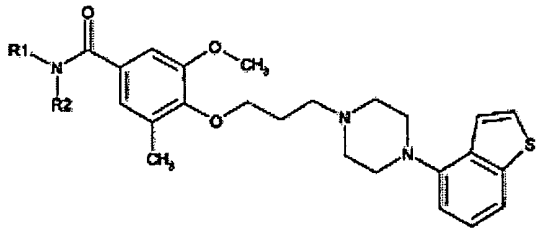
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 794 | -H | $-(CH_2)_3OCH_3$ | 512 |
| 795 | -H | $-CH_2CH_2OH$ | 484 |
| 796 | -H | $-CH_2CN$ | 479 |
| 797 | $-C_2H_5$ | -2-PYRIDYL | 545 |
| 798 | -H | -3-PYRIDYL | 517 |
| 799 | -H | $-C_6H_5$ | 516 |
| 800 | -H | $-(CH_2)_2NHCOCH_3$ | 525 |
| 801 | -H | $-CH_2CH(C_2H_5)_2$ | 524 |
| 802 | -H | $-CH_2CH(OCH_3)_2$ | 528 |
| 803 | -H | $-(CH_2)_3OCH(CH_3)_2$ | 540 |
| 804 | -H | $-(CH_2)_2OCH(CH_3)_2$ | 526 |
| 805 | -H | $-CH_2CH_2F$ | 486 |
| 806 | -H | $-CH_2CONHCH_3$ | 511 |
| 807 | -H | $-CH_2CH_2SCH_3$ | 514 |
| 808 | -H | $-CH_2CHF_2$ | 504 |

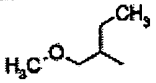
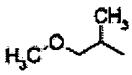
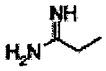
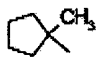
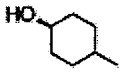
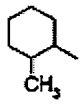
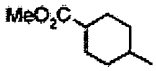
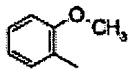
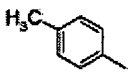
[Tabela 98]



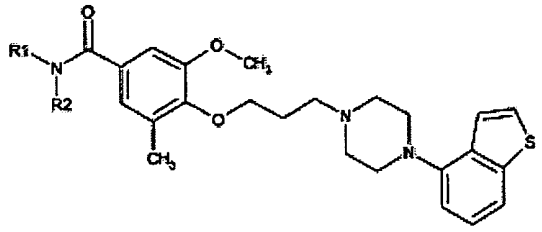
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 809 | -H |  | 554 |
| 810 | -H |  | 568 |
| 811 | -H |  | 539 |
| 812 | -H |  | 598 |
| 813 | -H |  | 540 |
| 814 | -H |  | 526 |
| 815 | -H |  | 511 |
| 816 | -H |  | 494 |
| 817 | -H |  | 540 |
| 818 | -H |  | 612 |
| 819 | $-C_2H_5$ |  | 522 |

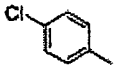
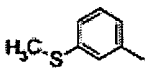
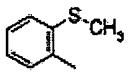
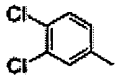
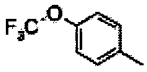
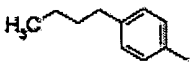
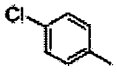
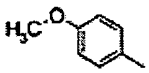
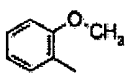
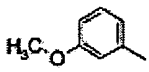
[Tabela 99]



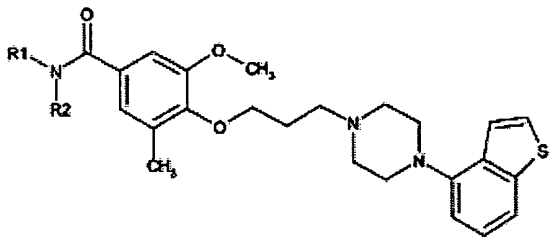
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 820 | -H |  | 526 |
| 821 | -H |  | 512 |
| 822 | -H |  | 514 |
| 823 | -H |  | 496 |
| 824 | -H |  | 494 |
| 825 | -H |  | 522 |
| 826 | -H |  | 538 |
| 827 | -H |  | 536 |
| 828 | -H |  | 580 |
| 829 | -CH3 |  | 560 |
| 830 | -CH3 |  | 544 |

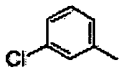
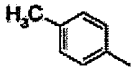
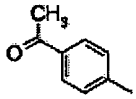
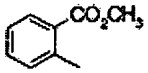
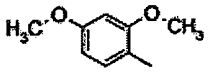
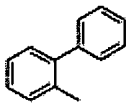
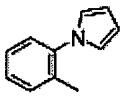
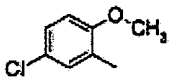
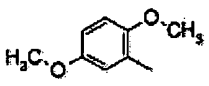
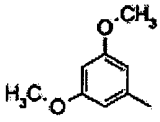
[Tabela 100]



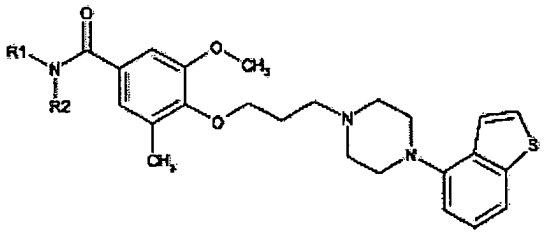
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 831 | -$CH_3$ |  | 564 |
| 832 | -H |  | 562 |
| 833 | -H |  | 562 |
| 834 | -H |  | 584 |
| 835 | -H |  | 600 |
| 836 | -H |  | 572 |
| 837 | -H |  | 550 |
| 838 | -H |  | 546 |
| 839 | -H |  | 546 |
| 840 | -H |  | 546 |
| 841 | -H |  | 550 |

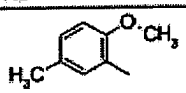
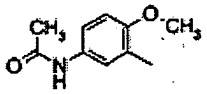
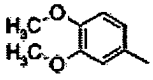
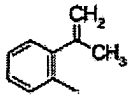
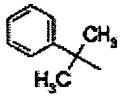
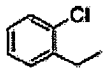
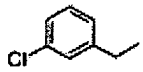
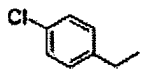
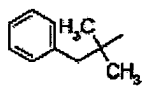
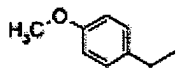
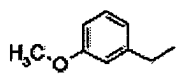
[Tabela 101]



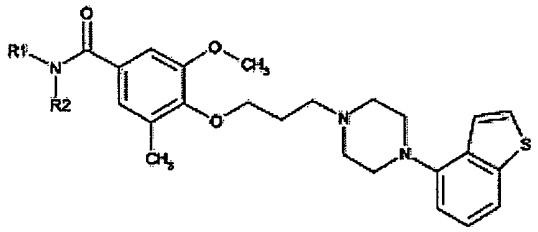
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 842 | -H |  | 550 |
| 843 | -H |  | 530 |
| 844 | -H |  | 558 |
| 845 | -H |  | 574 |
| 846 | -H |  | 576 |
| 847 | -H |  | 592 |
| 848 | -H |  | 581 |
| 849 | -H |  | 580 |
| 850 | -H |  | 576 |
| 851 | -H |  | 576 |

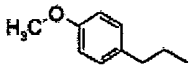
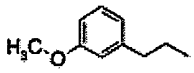
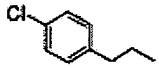
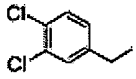
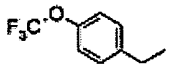
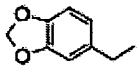
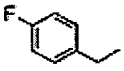
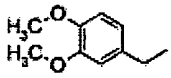
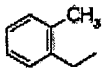
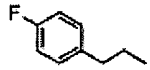
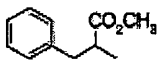
[Tabela 102]



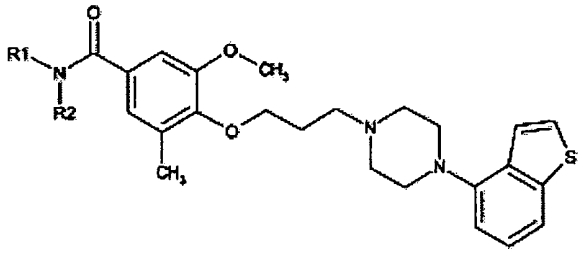
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 852 | -H |  | 560 |
| 853 | -H |  | 603 |
| 854 | -H |  | 576 |
| 855 | -H |  | 556 |
| 856 | -H |  | 558 |
| 857 | -H |  | 564 |
| 858 | -H |  | 564 |
| 859 | -H |  | 564 |
| 860 | -H |  | 572 |
| 861 | -H |  | 560 |
| 862 | -H |  | 560 |

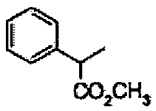
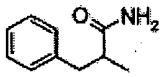
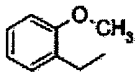
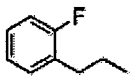
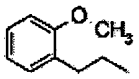
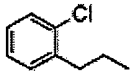
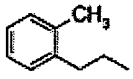
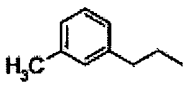
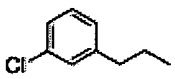
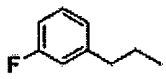
[Tabela 103]



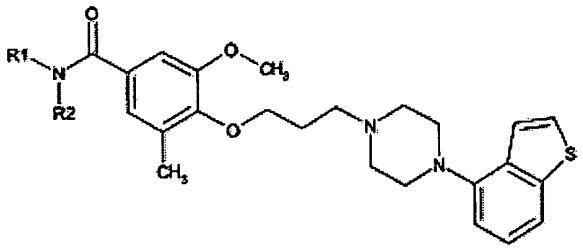
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 863 | -H |  | 574 |
| 864 | -H |  | 574 |
| 865 | -H |  | 578 |
| 866 | -H |  | 598 |
| 867 | -H |  | 614 |
| 868 | -H |  | 574 |
| 869 | -H |  | 548 |
| 870 | -H |  | 590 |
| 871 | -H |  | 544 |
| 872 | -H |  | 562 |
| 873 | -H |  | 602 |

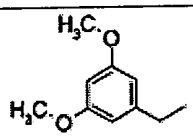
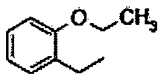
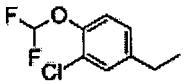
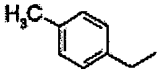
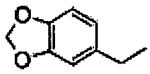
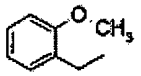
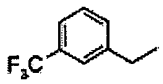
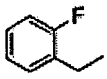
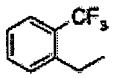
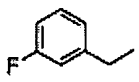
[Tabela 104]



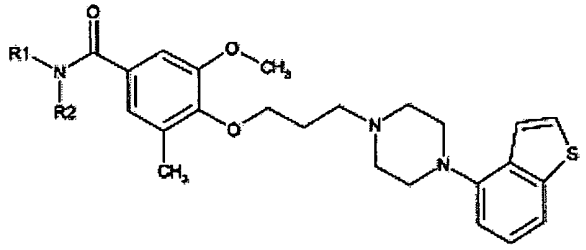
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 874 | -H |  | 588 |
| 875 | -H |  | 587 |
| 876 | -H |  | 560 |
| 877 | -H |  | 562 |
| 878 | -H |  | 574 |
| 879 | -H |  | 578 |
| 880 | -H |  | 558 |
| 881 | -H |  | 558 |
| 882 | -H |  | 578 |
| 883 | -H |  | 562 |

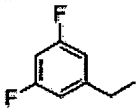
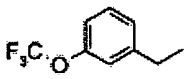
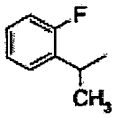
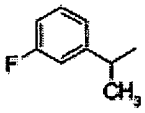
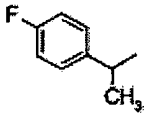
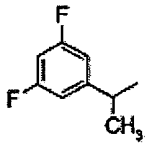
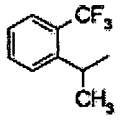
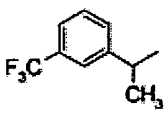
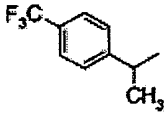
[Tabela 105]



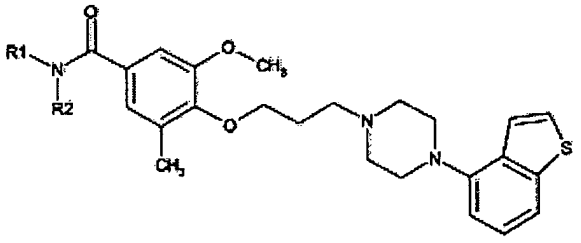
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 884 | -H |  | 590 |
| 885 | -H |  | 574 |
| 886 | -H |  | 630 |
| 887 | -CH3 |  | 558 |
| 888 | -CH3 |  | 588 |
| 889 | -CH3 |  | 574 |
| 890 | -H |  | 598 |
| 891 | -H |  | 548 |
| 892 | -H |  | 598 |
| 893 | -H |  | 548 |

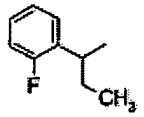
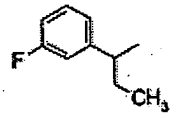
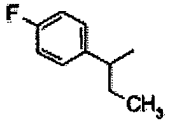
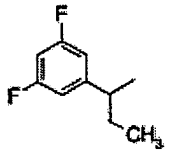
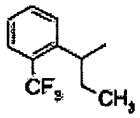
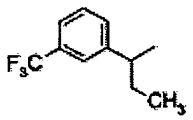
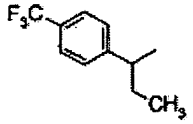
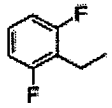
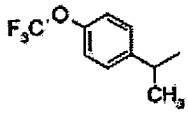
[Tabela 106]



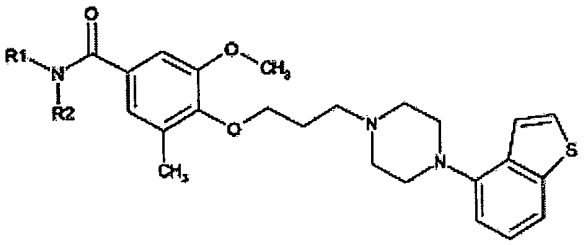
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 894 | -H |  | 566 |
| 895 | -H |  | 614 |
| 896 | -H |  | 562 |
| 897 | -H |  | 562 |
| 898 | -H |  | 562 |
| 899 | -H |  | 580 |
| 900 | -H |  | 612 |
| 901 | -H |  | 612 |
| 902 | -H |  | 612 |

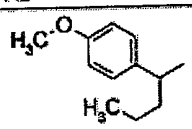
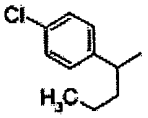
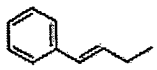
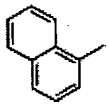
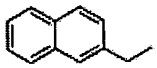
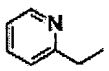
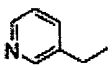
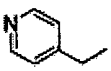
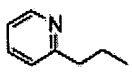
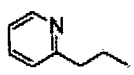
[Tabela 107]



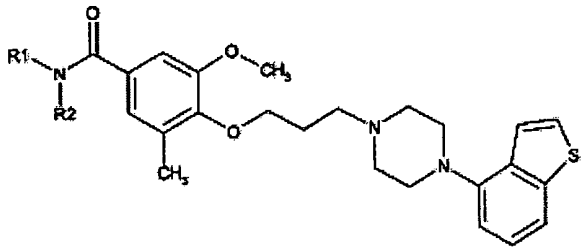
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 903 | -H |  | 576 |
| 904 | -H |  | 576 |
| 905 | -H |  | 576 |
| 906 | -H |  | 594 |
| 907 | -H |  | 626 |
| 908 | -H |  | 626 |
| 909 | -H |  | 626 |
| 910 | -H |  | 566 |
| 911 | -H |  | 628 |

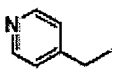
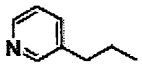
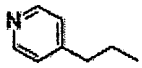
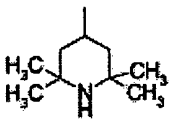
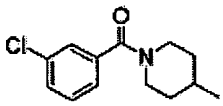
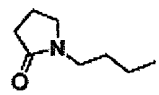
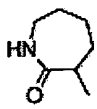
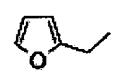
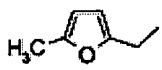
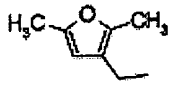
[Tabela 108]



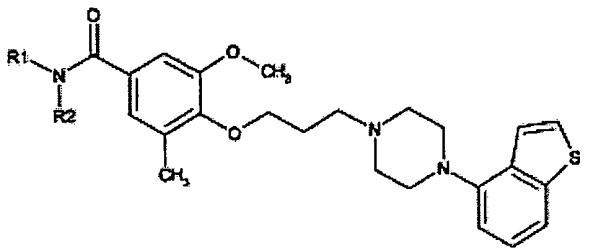
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 912 | -H |  | 602 |
| 913 | -H |  | 606 |
| 914 | $-C_2H_5$ |  | 584 |
| 915 | -H |  | 566 |
| 916 | -H |  | 580 |
| 917 | -H |  | 531 |
| 918 | -H |  | 531 |
| 919 | -H |  | 531 |
| 920 | -H |  | 545 |
| 921 | $-C_2H_5$ |  | 573 |

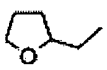
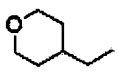
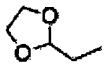
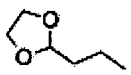
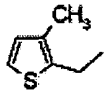
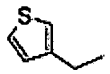
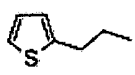
[Tabela 109]



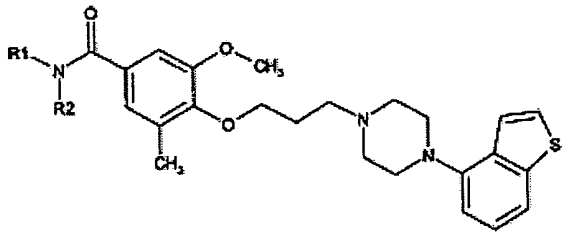
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 922 | $-C_2H_5$ |  | 559 |
| 923 | -H |  | 545 |
| 924 | -H |  | 545 |
| 925 | -H |  | 579 |
| 926 | $-CH_3$ |  | 675 |
| 927 | -H |  | 565 |
| 928 | -H |  | 551 |
| 929 | -H |  | 520 |
| 930 | -H |  | 534 |
| 931 | -H |  | 548 |

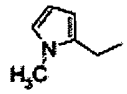
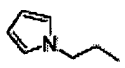
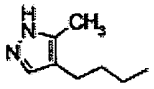
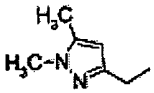
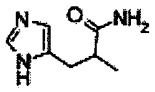
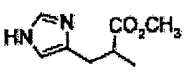
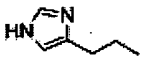
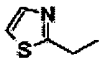
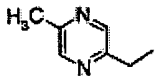
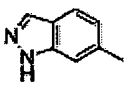
[Tabela 110]



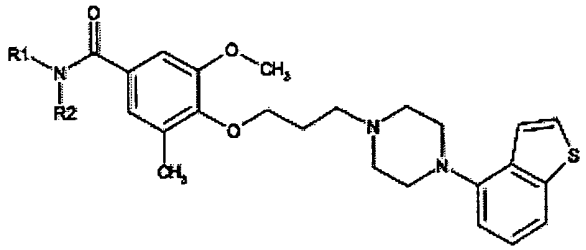
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 932 | -H |  | 520 |
| 933 | -H |  | 524 |
| 934 | -H |  | 524 |
| 935 | -H |  | 538 |
| 936 | -H |  | 526 |
| 937 | -H |  | 540 |
| 938 | -H |  | 536 |
| 939 | -H |  | 550 |
| 940 | -H |  | 536 |
| 941 | -H |  | 550 |

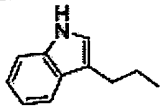
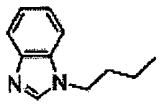
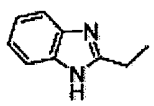
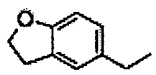
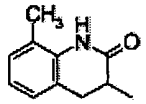
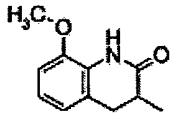
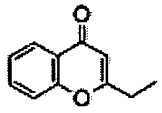
[Tabela 111]



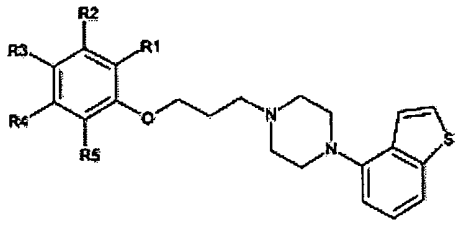
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 942 | -H |  | 533 |
| 943 | -H |  | 533 |
| 944 | -H |  | 562 |
| 945 | -H |  | 548 |
| 946 | -H |  | 548 |
| 947 | -H |  | 577 |
| 948 | -H |  | 592 |
| 949 | -H |  | 534 |
| 950 | -H |  | 537 |
| 951 | -H |  | 546 |
| 952 | -H |  | 556 |

[Tabela 112]



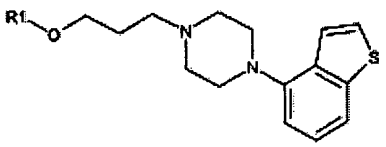
| Exemplo | R1 | R2 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|
| 953 | -H |  | 583 |
| 954 | -H |  | 598 |
| 955 | -H |  | 570 |
| 956 | -H |  | 572 |
| 957 | -H |  | 599 |
| 958 | -H |  | 615 |
| 959 | -H |  | 598 |

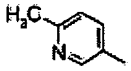
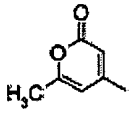
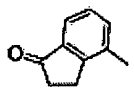
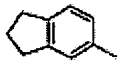
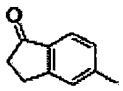
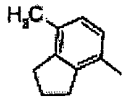
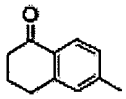
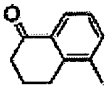
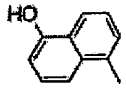
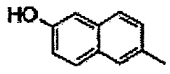
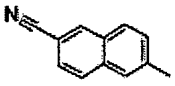
[Tabela 113]



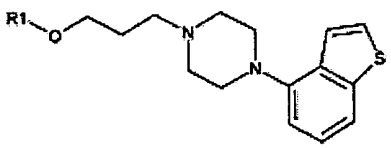
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS (M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 960 | -H | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | 410 |
| 961 | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | -H | 410 |
| 962 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 383 |
| 963 | -H | -H | -Cl | -H | -H | 387 |
| 964 | -H | -H | $-CH_3$ | -H | -H | 367 |
| 965 | -H | -H | $-CF_3$ | -H | -H | 421 |
| 966 | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | 437 |
| 967 | -H | -H | $-SCH_3$ | -H | -H | 399 |
| 968 | -H | -H | $-C_6H_5$ | -H | -H | 429 |
| 969 | -H | -H | $-OCH_2C_6H_5$ | -H | -H | 459 |
| 970 | -H | -H | $-NO_2$ | -H | -H | 398 |
| 971 | -H | -H | $-COCH_3$ | -H | -H | 395 |
| 972 | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 413 |
| 973 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | 413 |
| 974 | -H | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | 413 |
| 975 | -H | $-CH_3$ | -H | -H | -H | 367 |
| 976 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | $-CH_3$ | 381 |
| 977 | -F | -H | -H | -H | -H | 371 |
| 978 | -H | -F | -H | -H | -H | 371 |
| 979 | -H | -H | -F | -H | -H | 371 |
| 980 | -F | -H | -F | -H | -H | 389 |
| 981 | -H | -F | -H | -H | -F | 389 |
| 982 | -F | -H | -H | -H | -F | 389 |
| 983 | -F | -H | -H | $-CH_3$ | -H | 385 |
| 984 | -H | -H | $-CH_2CO_2CH_3$ | -H | -H | 425 |
| 985 | $-CH_3$ | -H | $-COCH_3$ | -H | -H | 409 |
| 986 | -H | $-OC_6H_5$ | -H | -H | -H | 445 |
| 987 |  | -H | -H | -H | -H | 420 |
| 988 | -H | -H |  | -H | -H | 419 |

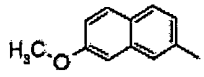
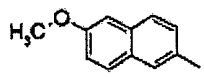
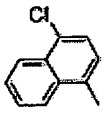
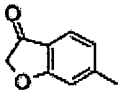
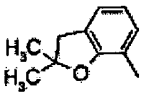
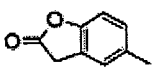
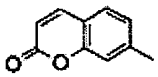
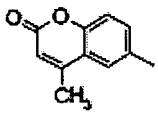
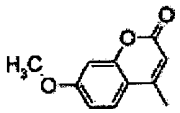
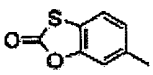
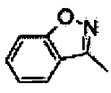
[Tabela 114]



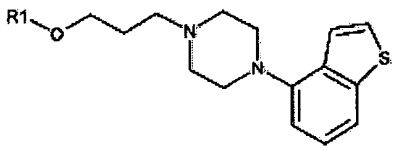
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 989 | -3-PYRIDYL | 354 |
| 990 |  | 368 |
| 991 |  | 385 |
| 992 |  | 407 |
| 993 |  | 393 |
| 994 |  | 407 |
| 995 |  | 407 |
| 996 |  | 421 |
| 997 |  | 421 |
| 998 |  | 419 |
| 999 |  | 419 |
| 1000 |  | 428 |

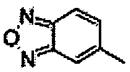
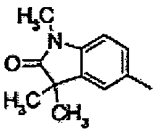
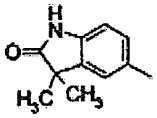
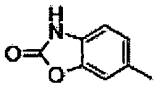
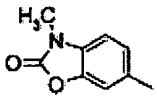
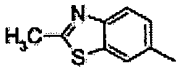
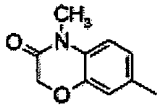
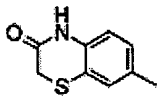
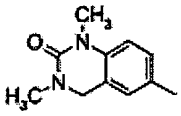
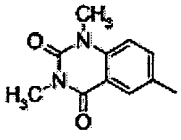
[Tabela 115]



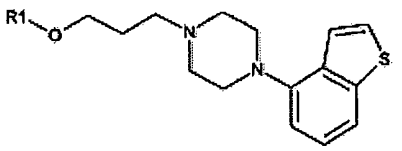
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 1001 |  | 433 |
| 1002 |  | 433 |
| 1003 |  | 437 |
| 1004 |  | 409 |
| 1005 |  | 423 |
| 1006 |  | 409 |
| 1007 |  | 421 |
| 1008 |  | 435 |
| 1009 |  | 451 |
| 1010 |  | 427 |
| 1011 |  | 394 |

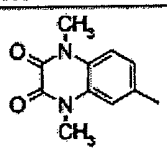
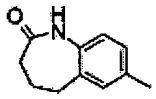
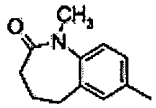
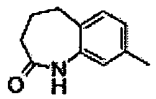
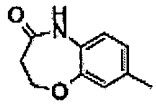
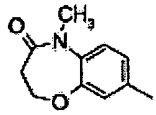
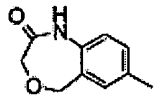
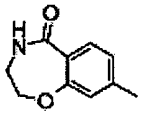
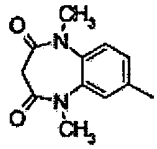
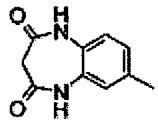
[Tabela 116]



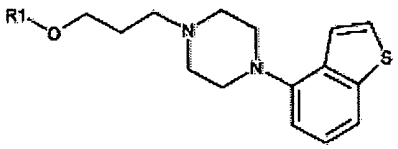
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 1012 |  | 395 |
| 1013 |  | 450 |
| 1014 |  | 436 |
| 1015 |  | 410 |
| 1016 |  | 424 |
| 1017 |  | 424 |
| 1018 | -2-BENZTHIAZOLYL | 410 |
| 1019 |  | 438 |
| 1020 |  | 440 |
| 1021 |  | 451 |
| 1022 |  | 465 |

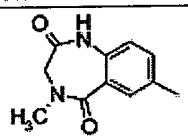
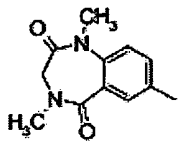
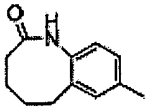
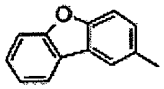
[Tabela 117]



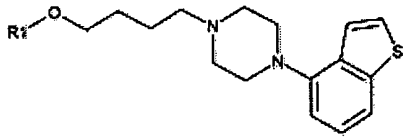
| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 1023 |  | 465 |
| 1024 |  | 436 |
| 1025 |  | 450 |
| 1026 |  | 436 |
| 1027 |  | 438 |
| 1028 |  | 452 |
| 1029 |  | 438 |
| 1030 |  | 438 |
| 1031 |  | 479 |
| 1032 |  | 451 |

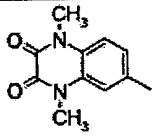
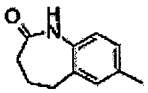
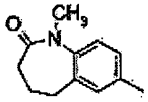
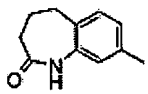
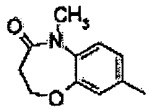
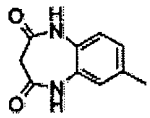
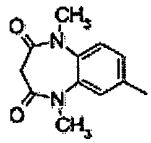
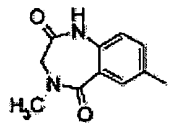
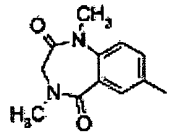
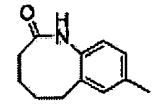
[Tabela 118]



| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 1033 |  | 465 |
| 1034 |  | 479 |
| 1035 |  | 450 |
| 1036 |  | 443 |

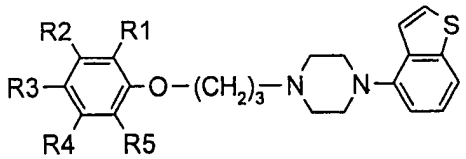
[Tabela 119]



| Exemplo | R1 | MS (M+1) |
|---|---|---|
| 1046 |  | 479 |
| 1047 |  | 450 |
| 1048 |  | 464 |
| 1049 |  | 450 |
| 1050 |  | 466 |
| 1051 |  | 465 |
| 1052 |  | 493 |
| 1053 |  | 479 |
| 1054 |  | 493 |
| 1055 |  | 464 |

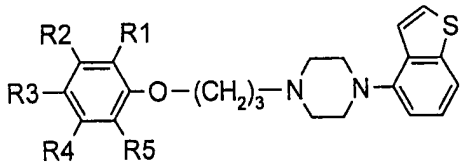
[Tabela 120]

[Tabela 121]



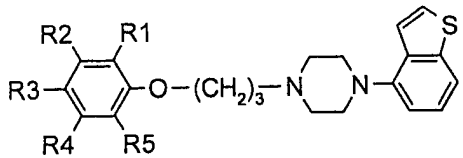
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1056 | $-OCH_3$ | -H | $-NHSO_2C_2H_5$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 235.5-237.5 | Cloridrato |
| 1057 | $-CH_3$ | -H | $-CONHCH_3$ | -H | -OH | Pó branco Acetato de etila) | 246.5 (dec) | Cloridrato |
| 1058 | $-CH_3$ | -H | -Br | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Etanol/ Acetato de etila) | 265.0 (dec) | Cloridrato |
| 1059 | $-OCH_3$ | -H | $-NHCOCH_2NHCO_2C(CH_3)_3$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico | 140.5-142.5 | -- |
| 1060 | $-CH_3$ | -H | $-NHCOCH_2NH_2$ | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Metanol/água) | 268.0 (dec) | Dicloridrato |
| 1061 | $-OCH_3$ | -H | $-NHCOCH_2NHCOCH_3$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico | 167.5-170.5 | -- |
| 1062 | $-OCH_3$ | -H | $-NHCOCH_2NHCO_2CH_3$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico | 157.0-159.5 | -- |
| 1063 | $-CH_3$ | -H | $-NHCOCH_2NHCHO$ | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Diclorometano/água) | 235.5 (dec) | Cloridrato |

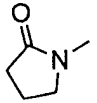
[Tabela 122]

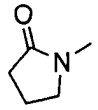
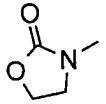
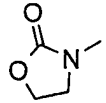
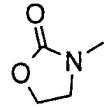
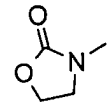


| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1064 | $-CH_3$ | -H | $-CONHCH_3$ | -H | $-O(CH_2)_2N(CH_3)_2$ | Pó branco (Acetato de etila) | 235,5-240,5 (dec) | Dicloridrato |
| 1065 | $-CH_3$ | -H | $-CONHCH_3$ | -H | $-O(CH_2)_2OCH_3$ | Pó branco (Álcool isopropílico/ éter isopropílico) | 194,0-197,5 | Cloridrato |
| 1066 | $-CH_3$ | -H | $-CONHCH_3$ | -H | $-OCH_2CF_3$ | Pó amarelo claro (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 156,0-157,5 | Cloridrato |

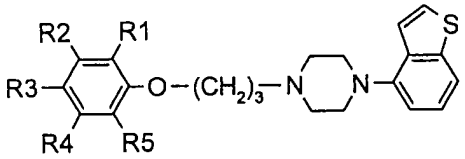
[Tabela 123]

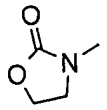
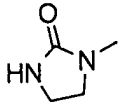
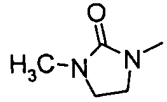
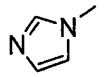


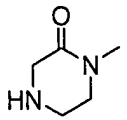
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1067 | -H | -H |  | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 114,0-115,5 | – |

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1068 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Etanol/ acetato de etila) | 245,0 (dec) | Cloridrato |
| 1069 | -H | -H |  | -H | -H | Pó branco (Acetato de etila) | 217,0-224,5 (dec) | Cloridrato |
| 1070 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | -CHO | Pó branco (Etanol) | 218,0 (dec) | Cloridrato |
| 1071 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_2OH$ | Pó branco (Etanol) | 224,0-226,5 (dec) | Cloridrato |
| 1072 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_2OCH_3$ | Pó branco (Etanol) | 224,0-226,0 | Cloridrato |

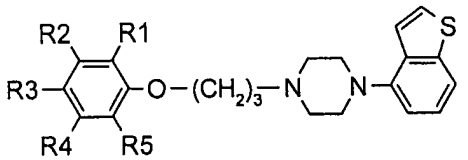
[Tabela 124]

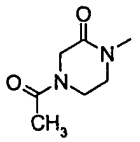
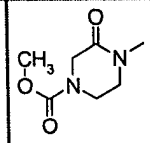
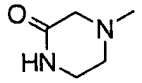
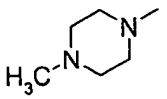


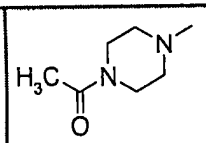
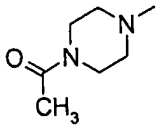
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1073 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_2N(CH_3)_2$ | Pó branco (Etanol/éter) | 151,0-152,0 | Difumarato |
| 1074 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_3$ | Pó amarelo claro Etanol/água□ | 264,0 (dec) | Cloridrato |
| 1075 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_3$ | Pó amarelo claro Acetato de etila/ éter isopropílico□ | 143,5-151,0 | -- |
| 1076 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_3$ | Pó branco Acetato de etila) | 246,5-249,0 (dec) | Cloridrato |
| 1077 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_3$ | Pó amarelo claro Acetato de etila□ | 234,0-240,0 (dec) | Dicloridrato |

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1078 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | Pó branco Metanol/água□ | 286,5 (dec) | Dicloridrato |

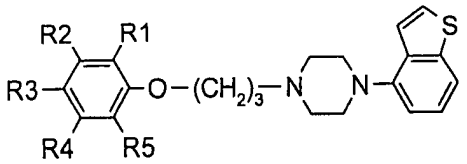
[Tabela 125]

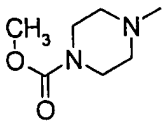
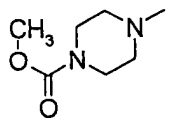
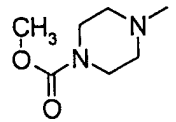


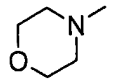
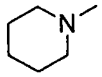
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1079 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | Pó branco Etanol/água | 218,0-221,5 | Cloridrato |
| 1080 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | Pó branco Etanol/acetato de etila | 223,0-228,0 | Cloridrato |
| 1081 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | Pó branco Acetato de etila/ Éter isopropílico | 139,5-142,0 | — |
| 1082 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | Pó branco Acetato de etila) | 270,0 (dec) | TriCloridrato |

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1083 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | Pó branco Acetato de etila) | 257,0-261,0 (dec) | Cloridrato |
| 1084 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_2OH$ | Pó branco Acetato de etila□ | 217,5-221,0 | Cloridrato |

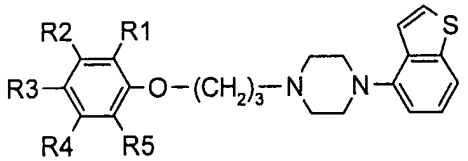
[Tabela 126]



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1085 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila□ | 250,0 (dec) | Cloridrato |
| 1086 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -CHO | Pó amarelo claro □Acetato de etila□ | 225,0 (dec) | Cloridrato |
| 1087 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_2OH$ | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico□ | 128,0-130,0 | – |

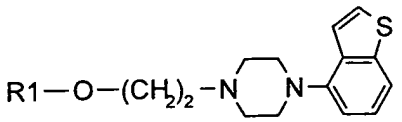
| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1088 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 246,0 (dec) | Cloridrato |
| 1089 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 248,0-251,0 (dec) | Dicloridrato |

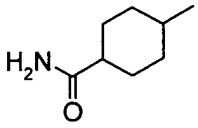
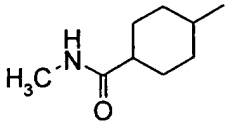
[Tabela 127]



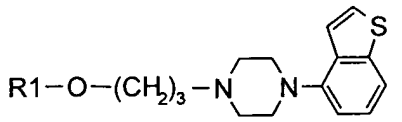
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1090 | -$NH_2$ | -H | -$CONHC_2H_5$ | -H | -H | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,23 (3H, t, J=7,4 Hz), 2,00-2,15 (2H, m), 2,67 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,75 (4H, brs), 3,21 (4H, brs), 3,40-3,50 (2H, m), 3,50-4,30 (2H, br), 4,13 (2H, t, J=6,5 Hz), 5,99 (1H, brs), 6,80 (1H, d, J=8,4 Hz), 6,90 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,08 (1H, dd, J=2,1, 8,3 Hz), 7,19 (1H, d, J=2,1 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz). | -- |

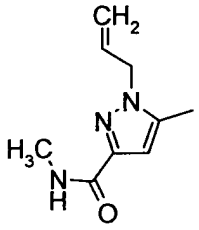
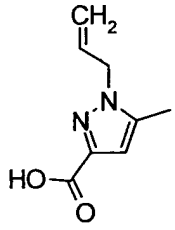
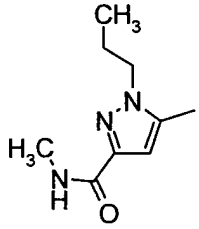
[Tabela 128]

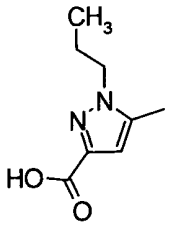
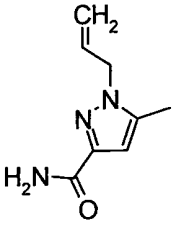
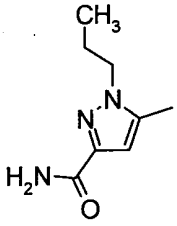


| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 1091 |  | Pó branco (etanol/ acetato de etila) | 166,0-171,0 | – |
| 1092 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 138,5-141,0 | – |

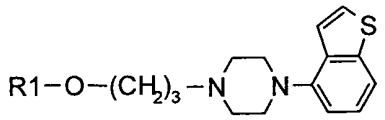
[Tabela 129]

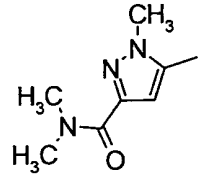
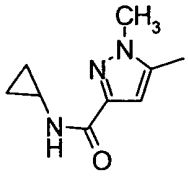
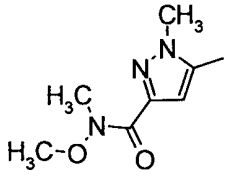


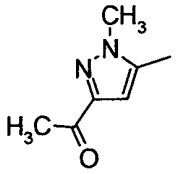
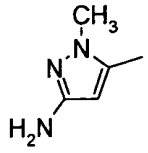
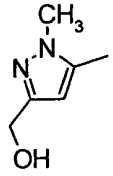
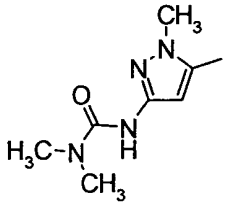
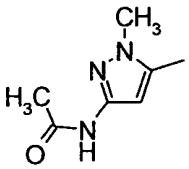
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 1093 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 138,5-140,5 | – |
| 1094 |  | Pó branco (Etanol) | 233,5 (dec) | Cloridrato |
| 1095 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 147,0-148,5 | – |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 1096 |  | Pó branco (água) | 115,0-121,0 | – |
| 1097 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 129,0-130,5 | – |
| 1098 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 139,0-140,5 | – |

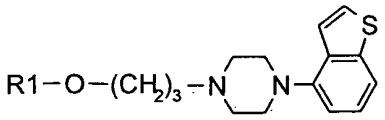
[Tabela 130]

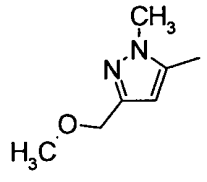
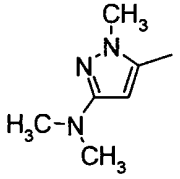


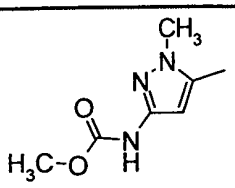
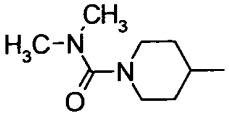
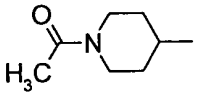
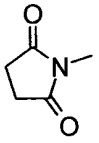
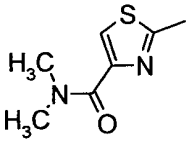
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 1099 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 128,5-131,5 | – |
| 1100 |  | Pó branco (Álcool isopropílico/ acetato de etila) | 227,0 (dec) | Cloridrato |
| 1101 |  | Pó branco (Etanol/ acetato de etila) | 211,0-213,5 | Cloridrato |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 1102 |  | Pó branco (Etanol/água) | 245,0 (dec) | Cloridrato |
| 1103 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 112,0-113,0 | – |
| 1104 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 123,5-126,0 | – |
| 1105 |  | Pó amarelo claro (Acetato de etila) | 174,0-176,5 | Cloridrato |
| 1106 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 137,0-139,0 | – |

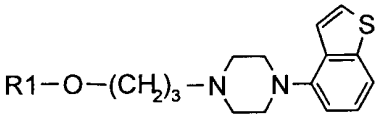
[Tabela 131]

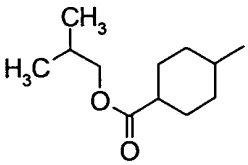
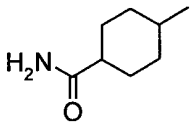
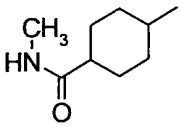
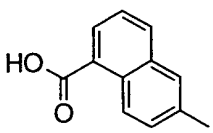


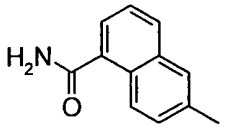
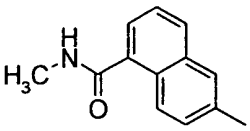
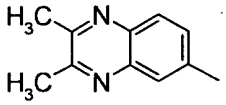
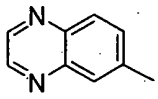
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 1107 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 194,0-196,0 | Cloridrato |
| 1108 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 173,0-177,0 | Dicloridrato |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 1109 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 162,5-165,0 | – |
| 1110 |  | Pó branco (Metanol) | 202-205 | Cloridrato |
| 1111 |  | Pó branco (Metanol) | 208-210 | Cloridrato |
| 1112 |  | Pó branco (Etanol) | 255,0-257,0 | Cloridrato |
| 1113 |  | Pó branco (Metanol) | 178-182 | Cloridrato |

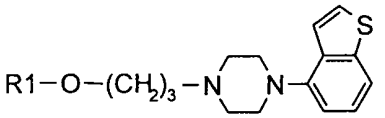
[Tabela 132]

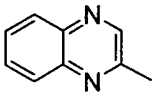
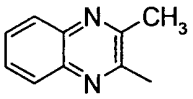
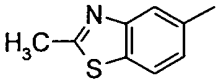
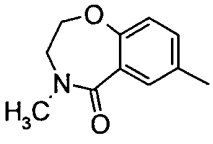
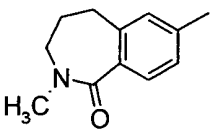


| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 1114 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 199,0-201,5 | Cloridrato |
| 1115 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 107,5-108,5 | – |
| 1116 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 110,0-112,0 | – |
| 1117 |  | Pó branco (água) | 203,0-210,0 | – |

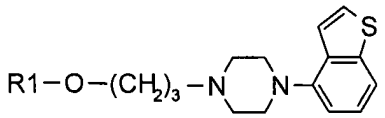
| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 1118 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 167,0-169,0 | – |
| 1119 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 138,0-140,0 | – |
| 1120 |  | Pó branco (Acetato de etila/hexano) | 115 | – |
| 1121 |  | Pó marrom claro (Etanol) | 134,7 | – |

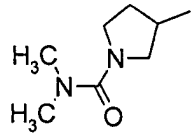
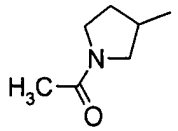
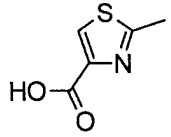
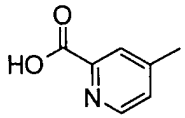
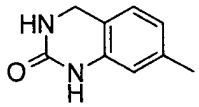
[Tabela 133]



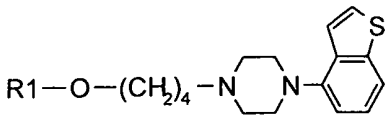
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 1122 |  | Pó branco (Etanol) | 131,3 | -- |
| 1123 |  | Pó branco (Etanol) | 107,1 | -- |
| 1124 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 231,3-232,8 | Cloridrato |
| 1125 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 218,9-221,0 | Cloridrato |
| 1126 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 259,0-260,2 | Cloridrato |

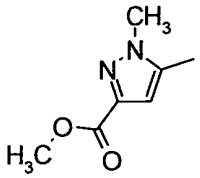
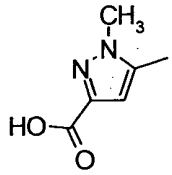
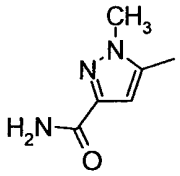
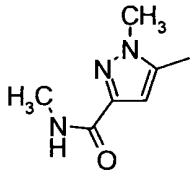
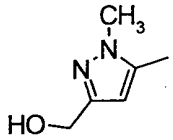
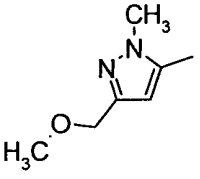
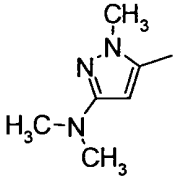
[Tabela 134]

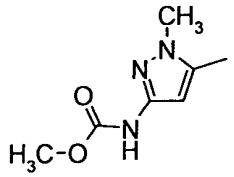


| Exemplo | R1 | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|
| 1127 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm:: 1,80-2,10 (4H, m), 2,74 (6H, s), 3,10-3,70 (16H, m), 4,00-4,10 (1H, m), 6,97 (1H, d, J=7,5 Hz), 7,32 (1H, t, J=7,9 Hz), 7,49 (1H, d, J=5,6 Hz), 7,71 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,77 (1H, d, J=5,5 Hz), 10,91 (1H, brs). | Cloridrato |
| 1128 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,80-2,10 (4H, m), 1,93 (3H, s), 3,10-3,60 (16H, m), 3,90-4,10 (1H, m), 6,95 (1H, d, J=7,5 Hz), 7,30 (1H, t, J=7,9 Hz), 7,47 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,68 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,75 (1H, d, J=5,5 Hz), 11,30 (1H, brs). | Cloridrato |
| 1129 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 2,20-2,40 (2H, m), 2,70-3,70 (10H, m), 4,55 (2H, t, J=5,9 Hz), 6,98 (1H, d, J=7,5 Hz), 7,32 (1H, t, J=7,9Hz), 7,50 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,71 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,77 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,89 (1H, s), 10,97 (1H, brs), 12,93 (1H, brs). | Cloridrato |
| 1130 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 2,25-2,35 (2H, m), 3,20-4,00 (10H, m), 4,30 (2H, t, J=5,8 Hz), 6,97 (1H, d, J=7,5 Hz), 7,24 (1H, dd, J=5,5, 2,8 Hz), 7,31 (1H, t, J=7,8 Hz), 7,49 (1H, d, J=5,4 Hz), 7,59 (1H, d, J=2,5 Hz), 7,70 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,76 (1H, d, J=5,5 Hz), 8,53 (1H, d, J=5,7 Hz), 10,99 (1H, brs). | Cloridrato |
| 1131 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,89-2,13 (2H, m), 2,52-2,83 (6H, m), 3,03-3,3-(4H, m), 4,01 (2H, t, J = 6,3 Hz), 4,46 (2H, brs), 5,30 (1H, brs), 6,51 (1H, dd, J = 8,3, 2,3 Hz), 6,83-6,96 (2H, m), 7,19-7,45 (3H, m), 7,48 (1H, brs), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz). | fumarato |

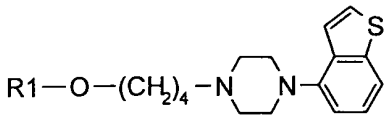
[Tabela 135]

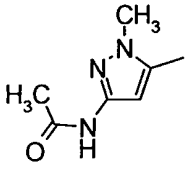
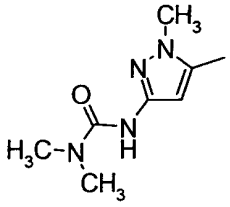
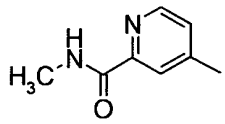
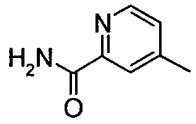
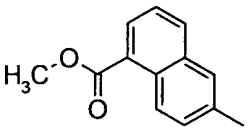
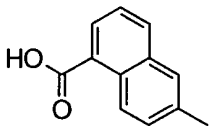
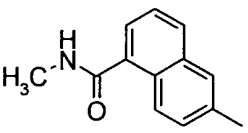


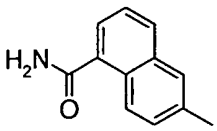
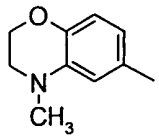
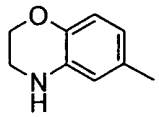
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 1132 |  | Pó marrom claro (Etanol/acetato de etila) | 103,5-106,0 | — |
| 1133 |  | Pó marrom claro (Diclorometano/água) | 140,5-144,0 | — |
| 1134 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 143,0-144,5 | — |
| 1135 |  | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 211,0-213,5 | Cloridrato |
| 1136 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 207,5-209,5 | Cloridrato |
| 1137 |  | Pó branco (Etanol) | 167,0-168,5 | Cloridrato |
| 1138 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 156,5-158,5 | Cloridrato |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 1139 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 157,5-161,5 | – |

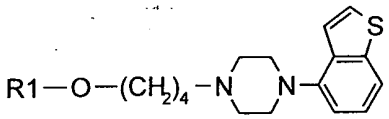
[Tabela 136]

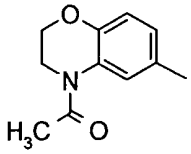
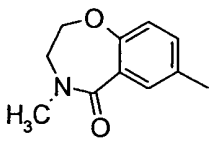
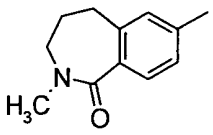
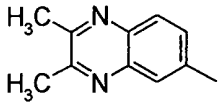
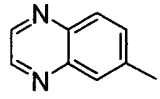
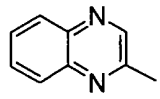


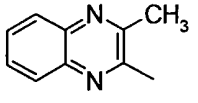
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 1140 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 203,5-206,0 | Cloridrato |
| 1141 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 186,0-187,5 | Cloridrato |
| 1142 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 203,0-207,0 | Cloridrato |
| 1143 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 146,5-148,0 | – |
| 1144 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 96,5-97,0 | – |
| 1145 |  | Pó branco (ácido acético) | 254,0 (dec) | Dicloridrato |
| 1146 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 124,0-126,5 | – |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 1147 |  | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 181,5-183,5 | – |
| 1148 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 230,2-231,5 | Cloridrato |
| 1149 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 207,4-209,6 | Cloridrato |

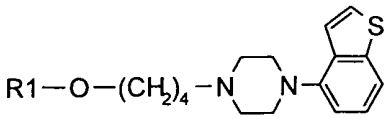
[Tabela 137]

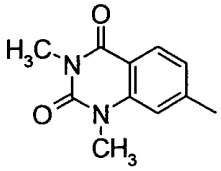


| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 1150 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 213,8-215,2 | Cloridrato |
| 1151 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 217,0-218,0 | Cloridrato |
| 1152 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 231,6-232,9 | Cloridrato |
| 1153 |  | Pó amarelo claro (Etanol) | 135,7 | – |
| 1154 |  | Pó marrom claro (Etanol) | 238,1-240,1 | Cloridrato |
| 1155 |  | Pó branco (Etanol) | 210,4 | Cloridrato |

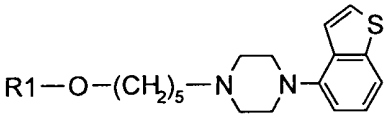
| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 1156 |  | Pó branco (Etanol) | 94,1 | — |

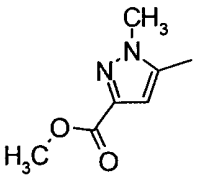
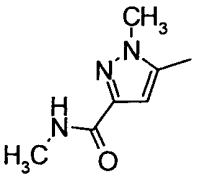
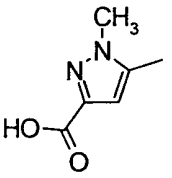
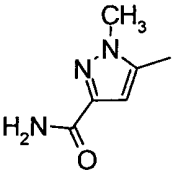
[Tabela 138]



| Exemplo | R1 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|
| 1157 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,72-1,83 (2H, m), 1,83-1,98 (2H, m), 2,48-2,59 (2H, m), 2,64-2,81 (4H, m), 3,12-3,28 (4H, m), 3,46 (3H, s), 3,58 (3H, s), 4,13 (2H, t, J = 6,3 Hz), 6,62 (1H, d, J = 2,1 Hz), 6,80 (1H, dd, J = 8,8, 2,1 Hz), 6,90 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,20-7,31 (1H, m), 7,35-7,43 (2H, m), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 8,15 (1H, d, J = 8,8 Hz). | -- |

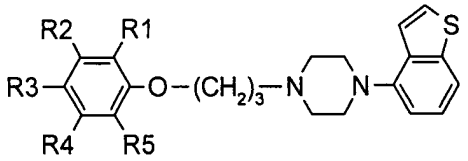
[Tabela 139]



| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 1158 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 200,5-201,5 | Cloridrato |
| 1159 |  | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 225,0-230,0 | Cloridrato |
| 1160 |  | Pó branco (Diclorometano/água) | 156,0-158,5 | — |
| 1161 |  | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 169,0-171,5 | — |

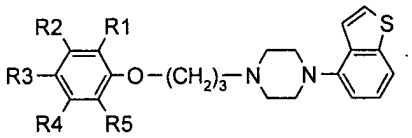
5

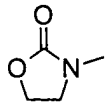
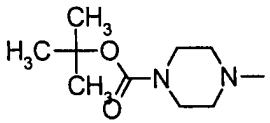
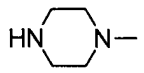
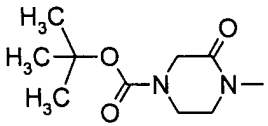
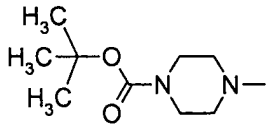
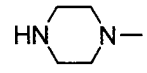
[Tabela 140]



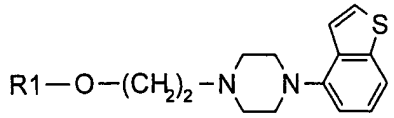

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1162 | $-OCH_3$ | -H | $-NHCO2C(CH_3)_3$ | -H | $-CH_3$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,51(9H, s), 1,95-2,10 (2H, m), 2,24(3H, s), 2,66-2,81(6H, m), 3,14-3,31(2H, m), 3,84(3H, s), 3,95(2H, t, J=6,3Hz), 6,36(1H, br), 6,60(1H, d, J=2,5Hz), 6,87-6,92(1H, m), 7,01 (1H, d, J=2,0Hz), 7,24-7,31(1H, m), 7,37-7,44(2H, m), 7,55(1H, d, J=8,0Hz) |
| 1163 | $-OCH_3$ | -H | -I | -H | $-CH_3$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,92-2,10 (2H, m), 2,23(3H, s), 2,57-2,86(6H, m), 3,11-3,31(4H, m), 3,82(3H, s), 3,98(2H, t, J=6,4Hz), 6,90(1H, d, J=7,6Hz), 7,03(1H, d, J=2,0Hz), 7,13(1H, d, J=1,6Hz), 7,22-7,34(1H, m), 7,40 (1H, dd, J=5,5Hz, 9,3Hz), 7,55(1H, d, J=8,0Hz). |
| 1164 | $-OCH_3$ | -H | $-NHCONH(CH_2)_2Cl$ | -H | $-CH_3$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,94-2,13 (2H, m), 2,26(3H, s), 2,60-2,90(6H, m), 3,12-3,33(4H, m), 3,49-3,75(4H, m), 3,83(3H, s), 3,97(2H, t, J=6,4Hz), 5,22(1H, br), 6,25(1H, br), 6,59(1H, d, J=2,3Hz), 6,86(1H, d, J=2,3Hz), 6,91(1H, d, J=7,4Hz), 7,21-7,33(1H, m), 7,41 (1H, dd, J=5,6Hz, 7,6Hz), 7,56(1H, d, J=8,0Hz). |
| 1165 | $-OCH_3$ | -H | $-NH(CH_2)_2NH_2$ | -H | $-CH_3$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,91-2,08 (2H, m), 2,22(3H, s), 2,62-2,81(6H, m), 2,95(2H, t, J=5,7Hz), 3,08-3,27(6H, m), 3,80(3H, s), 3,91(2H, t, J=6,4Hz), 6,05(1H, d, J=2,6Hz), 6,10(1H, d, J=2,6Hz), 6,90(1H, d, J=7,5Hz), 7,20-7,32(1H, m), 7,34-7,46 (2H, m), 7,55(1H, d, J=8,0Hz). |
| 1166 | $-OCH_3$ | -H | $-NH(CH_2)_2NHCOCH_2Cl$ | -H | $-CH_3$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,91-2,11 (2H, m), 2,23(3H, s), 2,60-2,84(6H, m), 3,11-3,26(4H, m), 3,26-3,36(2H, m), 3,45-3,63(2H, m), 3,81(3H, s), 3,91(2H, t, J=6,4Hz), 4,06(2H, s), 6,04(1H, d, J=2,5Hz), 6,10(1H, d, J=2,5Hz), 6,78-6,96(2H, m), 7,21-7,33(1H, m), 7,35-7,47 (2H, m), 7,55(1H, d, J=8,1Hz). |

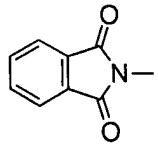
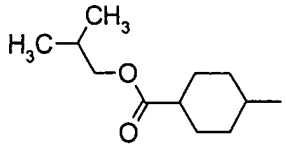
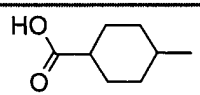
[Tabela 141]



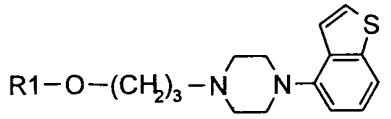
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1167 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_2Cl$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,00-2,17 (2H, m), 2,63-2,83(6H, m), 3,14-3,28(2H, m), 3,89(3H, s), 3,98-4,17(4H, m), 4,40-4,54(2H, m), 4,69(2H, m), 6,77(1H, d, J=2,5Hz), 6,91(1H, d, J=2,5Hz), 7,21-7,32(1H, m), 7,35-7,46(2H, m), 7,55(1H, d, J=9,3Hz) |
| 1168 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,48(9H, s), 1,93-2,12 (2H, m), 2,26(3H, s), 2,60-2,86(6H, m), 2,95-3,12(4H, m), 3,14-3,31(4H, m), 3,50-3,67(4H, m), 3,83(3H, s), 3,94(2H, t, J=6,3Hz), 6,33(1H, d, J=2,5Hz), 6,38(1H, d, J=2,5Hz), 6,90(1H, d, J=7,5Hz), 7,19-7,33(1H, m), 7,41 (2H, dd, J=5,5Hz, 9,3Hz), 7,55(1H, d, J=8,0Hz). |
| 1169 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,92-2,09 (2H, m), 2,26(3H, s), 2,61-2,81(6H, m), 2,98-3,12(8H, m), 3,14-3,25(4H, m), 3,83(3H, s), 3,94(2H, t, J=6,4Hz), 6,33(1H, d, J=2,5Hz), 6,38(1H, d, J=2,5Hz), 6,90(1H, d, J=7,0Hz), 7,20-7,33(1H, m), 7,34-7,45 (2H, m), 7,55(1H, d, J=8,0Hz). |
| 1170 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,50(9H, s), 1,95-2,11 (2H, m), 2,27(3H, s), 2,59-2,82(6H, m), 3,12-3,27(4H, m), 3,63-3,81(4H, m), 3,83(3H, s), 4,01(2H, t, J=6,4Hz), 4,24(2H, s), 6,61-6,71(2H, m), 6,90(1H, d, J=7,6Hz), 7,21-7,33(1H, m), 7,41 (2H, dd, J=5,5Hz, 9,8Hz), 7,55(1H, d, J=8,1Hz). |
| 1171 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -CHO | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,49(9H, s), 1,96-2,12 (2H, m), 2,60-2,82(6H, m), 3,04-3,16(4H, m), 3,16-3,28(4H, m), 3,52-3,64(4H, m), 3,89(3H, s), 4,14(2H, t, J=6,3Hz), 6,78(1H, d, J=2,8Hz), 6,86-6,96(2H, m), 7,20-7,33(1H, m), 7,35-7,46 (2H, m), 7,55(1H, d, J=8,0Hz), 10,44(1H, s). |
| 1172 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -CHO | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,97-2,13 (2H, m), 2,59-2,83(6H, m), 2,96-3,09(4H, m), 3,09-3,17(4H, m), 3,17-3,28(4H, m), 3,89(3H, s), 4,13(2H, t, J=6,5Hz), 6,79(1H, d, J=2,7Hz), 6,86-6,96(2H, m), 7,20-7,34(1H, m), 7,36-7,45 (2H, m), 7,55(1H, d, J=8,1Hz), 10,44(1H, s). |

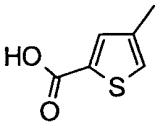
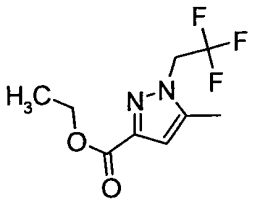
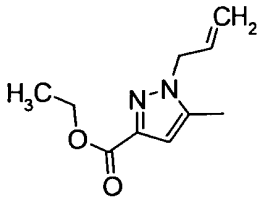
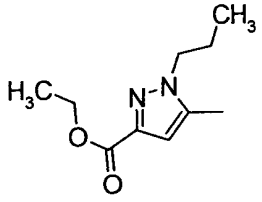
[Tabela 142]



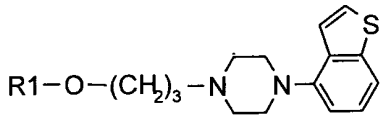
| Exemplo | R1 | RMN |
|---|---|---|
| 1173 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,70-2,87(4H, m), 2,95(2H, t, J=5,1Hz), 2,99-3,14(4H, m), 4,42(2H, t, J=5,1Hz), 6,78(1H, dd, J=0,6Hz, 7,6Hz), 7,18-7,30(1H, m), 7,38 (2H, s), 7,54(1H, d, J=8,0Hz), 7,69-7,80(2H, m), 7,80-7,89(2H, m). |
| 1174 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 0,93(6H, d, J=6,7Hz), 1,41-1,75(5H, m), 1,75-2,02 (4H, m), 2,23-2,48(1H, m), 2,65-2,87(6H, m), 3,06-3,25(4H, m), 3,42-3,54(1H, m), 3,62(2H, t, J=6,2Hz), 3,85(2H, d, J=6,5Hz), 6,89(1H, d, J=7,6Hz), 7,20-7,34(1H, m), 7,34-7,46 (2H, m), 7,54(1H, d, J=8,0Hz). |
| 1175 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,41-1,75(4H, m), 1,75-2,01 (4H, m), 2,18-2,44(1H, m), 2,72-3,04(6H, m), 3,14-3,31(4H, m), 3,44-3,54(1H, m), 3,64(2H, t, J=6,0Hz), 6,88(1H, d, J=7,6Hz), 7,20-7,31(1H, m), 7,31-7,44 (2H, m), 7,55(1H, d, J=8,0Hz). |

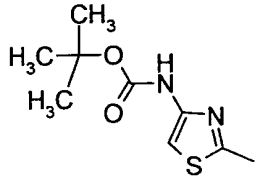
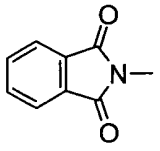
[Tabela 143]

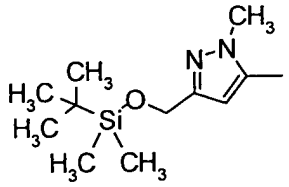
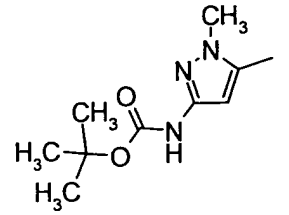


| Exemplo | R1 | RMN |
|---|---|---|
| 1176 |  | RMN-$^1$H (DMSO-$d_6$) δppm: 1,85-1,95 (2H, m), 2,57 (2H, t, J=7,1 Hz), 2,60-2,75 (4H, m), 3,05-3,15 (4H, m), 4,03 (2H, t, J=6,3 Hz), 6,85-6,95 (2H, m), 7,20-7,31 (2H, m), 7,35-7,41 (1H, m), 7,60 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,68 (1H, d, J=5,5 Hz). |
| 1177 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,39 (3H, t, J= 7,0Hz), 2,00-2,11 (2H, m), 2,60 (2H, t, J=7,0Hz), 2,63-2,80 (4H, m), 3,09-3,25 (4H, m), 4,24 (2H, t, J=6,3Hz), 4,40 (2H, q, J=7,0 Hz), 4,64 (2H, q, J=8,3Hz), 6,12 (1H, s), 6,90 (1H, dd, J=0,5Hz, 7,5Hz), 7,25-7,31 (1H, m), 7,38-7,43 (2H, m), 7,56 (1H, d, J=8,1 Hz). |
| 1178 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,39 (3H, t, J= 7,0Hz), 2,00-2,06 (2H, m), 2,60 (2H, t, J=7,5Hz), 2,67-2,83 (4H, m), 3,13-3,28 (4H, m), 4,18 (2H, t, J=6,3Hz), 4,39 (2H, q, J=7,0 Hz), 4,61 (2H, m), 5,08-5,23 (2H, m), 5,87-6,09 (1H, m), 6,11 (1H, s), 6,75 (1H, dd, J=0,6Hz, 7,5Hz), 7,25-7,37 (1H, m), 7,40-7,43 (2H, m), 7,65 (1H, d, J=8,0 Hz). |
| 1179 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 0,91 (3H, t, J=7,5Hz), 1,38 (3H, t, J= 7,0Hz), 1,72-1,93 (2H, m), 1,98-2,13 (2H, m), 2,61 (2H, t, J=7,3Hz), 2,67-2,83 (4H, m), 3,09-3,28 (4H, m), 4,01 (2H, t, J=7,0Hz), 4,18 (2H, t, J=6,3Hz), 4,39 (2H, q, J=7,0 Hz), 6,08 (1H, s), 6,90 (1H, dd, J=0,7Hz, 7,5Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,37-7,43 (2H, m), 7,56 (1H, d, J=8,0 Hz). |

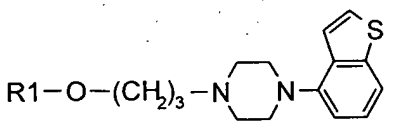
[Tabela 144]

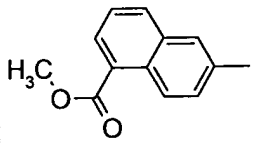
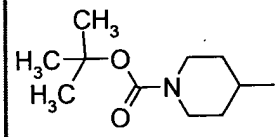
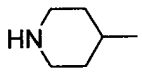
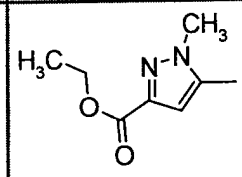
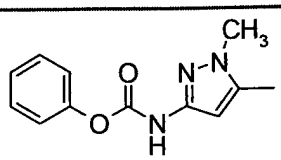


| Exemplo | R1 | RMN |
|---|---|---|
| 1180 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,51(9H, s), 1,97-2,12 (2H, m), 2,52-2,67(2H, m), 2,67-2,80(4H, m), 3,07-3,29(4H, m), 4,38(2H, t, J=6,3Hz), 6,52(1H, br), 6,90(1H, d, J=7,6Hz), 7,03(1H, br), 7,21-7,33(1H, m), 7,40(2H, dd, J=5,6Hz, 7,3Hz), 7,55(1H, d, J=8,0Hz). |
| 1181 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,95-2,13 (2H, m), 2,65-2,83(6H, m), 3,09-3,27(4H, m), 4,33(2H, t, J=6,4Hz), 6,89(1H, d, J=7,6Hz), 7,20-7,32(1H, m), 7,40 (1H, dd, J=5,6Hz, 9,0Hz), 7,54(1H, d, J=8,0Hz), 7,71-7,80(2H, m), 7,80-7,90(2H, m). |

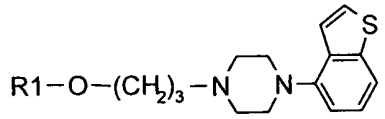
| | | |
|---|---|---|
| 1182 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 0,10(6H, s), 0,92(9H, s), 1,93-2,13 (2H, m), 2,62 (2H, t, J=7,5Hz), 2,70-2,83 (4H, m), 3,09-3,28 (4H, m), 3,59(3H, s), 4,13 (2H, t, J=6,3Hz), 4,60 (2H, s), 5,54 (1H, s), 6,90 (1H, dd, J=0,7Hz, 7,5Hz), 7,20-7,33 (1H, m), 7,35-7,48 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz). |
| 1183 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,50 (9H, s), 1,94-2,12 (2H, m), 2,60 (2H, t, J=7,0Hz), 2,66-2,80 (4H, m), 3,10-3,27 (4H, m), 3,52(3H, s), 4,15 (2H, t, J=6,4Hz), 5,85 (1H, s), 6,81-6,97 (2H, m), 7,20-7,33 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz). |

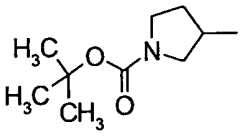
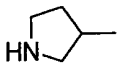
[Tabela 145]



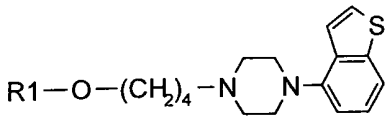
| Exemplo | R1 | RMN |
|---|---|---|
| 1184 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 2,01-2,20 (2H, m), 2,62-2,87 (6H, m), 3,10-3,30 (4H, m), 3,99(3H, s), 4,20 (2H, t, J=6,3Hz), 6,91 (1H, dd, J=0,7Hz, 7,6Hz), 7,20(1H, d, J=2,6Hz), 7,22-7,34 (2H, m), 7,35-7,50 (3H, m), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz), 7,90(1H, d, J=8,1Hz), 8,03(1H, dd, J=1,2Hz, 7,3Hz), 8,83(1H, d, J=9,4Hz). |
| 1185 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,46 (9H, s), 1,45-1,60 (2H, m), 1,75-1,90 (4H, m), 2,50-2,60 (2H, m), 2,65-2,80 (4H, m), 3,05-3,25 (6H, m), 3,40-3,50 (1H, m), 3,53 (2H, t, J=6,4 Hz), 3,70-3,80 (2H, m), 6,89 (1H, dd, J=7,6, 0,7 Hz), 7,20-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,54 (1H, d, J=8,0 Hz), 8,02 (1H, s). |
| 1186 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,30-1,60 (2H, m), 1,75-2,00 (4H, m), 2,50-2,75 (4H, m), 3,05-3,25 (6H, m), 3,30-3,40 (1H, m), 3,55 (2H, t, J=6,5 Hz), 6,90 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,20-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,1 Hz). |
| 1187 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,38 (3H, t, J=7,1 Hz), 2,00-2,10 (2H, m), 2,60 (2H, t, J=7,1 Hz), 2,65-2,75 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3,72 (3H, s), 4,17 (2H, t, J=6,4 Hz), 4,38 (2H, q, J=7,1 Hz), 6,08 (1H, s), 6,89 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,20-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,54 (1H, d, J=8,1 Hz). |
| 1188 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,94-2,10 (2H, m), 2,60 (2H, t, J=7,1Hz), 2,65-2,78 (4H, m), 3,10-3,25 (4H, m), 3,57(3H, s), 4,15 (2H, t, J=6,3Hz), 5,93 (1H, s), 6,89(1H, d, J=7,5Hz), 7,12-7,32 (3H, m), 7,33-7,45 (4H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,93(1H, br). |

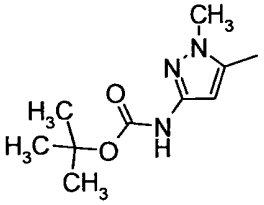
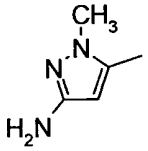
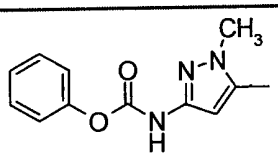
[Tabela 146]



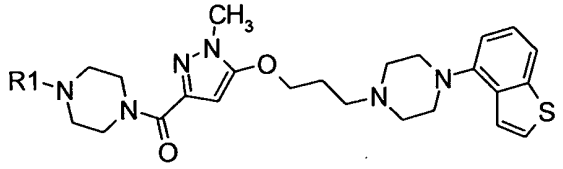
| Exemplo | R1 | RMN |
|---|---|---|
| 1189 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,75-2,00 (4H, m), 2,50-2,60 (2H, m), 2,70-2,75 (4H, m), 3,15-3,25 (4H, m), 3,35-3,80 (6H, m), 4,00-4,05 (1H, m), 6,91 (1H, dd, J=7,6, 0,5 Hz), 7,25-7,35 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,56 (1H, d, J=8,0 Hz). |
| 1190 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm: 1,75-1,95 (4H, m), 2,51 (2H, t, J=7,1 Hz), 2,50-2,75 (8H, m), 3,10-3,20 (4H, m), 3,46 (2H, t, J=6,3 Hz), 4,00-4,10 (1H, m), 6,88 (1H, d, J=7,1 Hz), 7,20-7,30 (1H, m), 7,30-7,45 (2H, m), 7,53 (1H, d, J=8,0 Hz). |

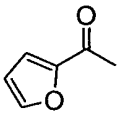
[Tabela 147]



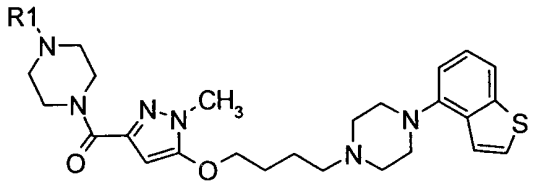
| Exemplo | R1 | RMN |
|---|---|---|
| 1191 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm:: 1,50 (9H, s), 1,59-1,77(2H, m), 1,77-1,93 (2H, m), 2,50 (2H, t, J=7,3Hz), 2,61-2,80 (4H, m), 3,11-3,27 (4H, m), 3,54(3H, s), 4,09 (2H, t, J=6,3Hz), 5,85 (1H, s), 6,90 (1H, d, J=7,5Hz), 7,23-7,32 (1H, m), 7,36-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,80(1H, br). |
| 1192 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm:: 1,64-1,93 (4H, m), 2,51 (2H, t, J=7,3Hz), 2,61-2,79 (4H, m), 3,11-3,29 (4H, m), 3,46(3H, s), 3,49(2H, br), 4,02 (2H, t, J=6,2Hz), 4,94 (1H, s), 6,90 (1H, dd, J=0,7hz, 7,6Hz), 7,22-7,33 (1H, m), 7,35-7,46 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz). |
| 1193 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$) δppm:: 1,64-1,78(2H, m), 1,78-1,94 (2H, m), 2,50 (2H, t, J=7,3Hz), 2,61-2,81 (4H, m), 3,10-3,28 (4H, m), 3,57(3H, s), 4,09 (2H, t, J=6,3Hz), 5,92 (1H, s), 6,77-6,98(4H, m), 7,11-7,32 (2H, m), 7,32-7,47 (4H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz), 8,47(1H, br). |

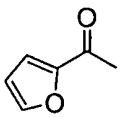
[Tabela 148]



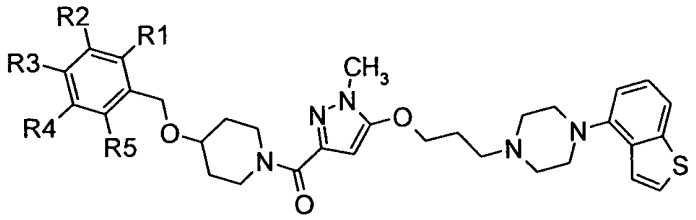
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1194 | $-CO_2CH_2C_6H_5$ | 603 |
| 1195 | $-CO_2C_2H_5$ | 541 |
| 1196 | $-COCH_3$ | 511 |
| 1197 | $-CO_2C(CH_3)_3$ | 569 |
| 1198 | $-COC_6H_5$ | 573 |
| 1199 | $-COC_3H_7$ | 539 |
| 1200 |  | 563 |

[Tabela 149]



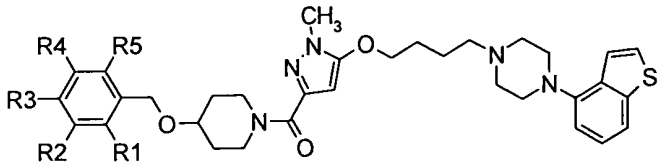
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1201 | $-CO_2CH_2C_6H_5$ | 617 |
| 1202 | $-CO_2C_2H_5$ | 555 |
| 1203 | $-COCH_3$ | 525 |
| 1204 | $-CO_2C(CH_3)_3$ | 583 |
| 1205 | $-COC_6H_5$ | 587 |
| 1206 | $-COC_3H_7$ | 553 |
| 1207 |  | 577 |

[Tabela 150]



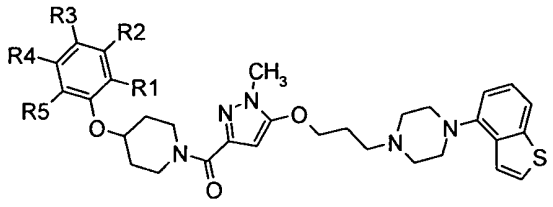

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1208 | -H | -H | -H | -Cl | -H | 608 |
| 1209 | -H | -H | -H | -H | -F | 592 |
| 1210 | -H | -H | -H | -H | -Cl | 608 |
| 1211 | -H | -H | -Cl | -Cl | -H | 642 |
| 1212 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | 604 |
| 1213 | -H | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | -H | 634 |
| 1214 | -H | -H | $-CH_3$ | -H | -H | 588 |
| 1215 | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | 588 |
| 1216 | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | 588 |
| 1217 | -H | -H | -F | -H | -H | 592 |
| 1218 | -H | -H | -H | -F | -H | 592 |
| 1219 | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | 658 |
| 1220 | -H | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | 658 |
| 1221 | -H | -H | -H | -H | $-OCF_3$ | 658 |
| 1222 | -H | -H | $-OCH_3$ | -Cl | -H | 638 |
| 1223 | -H | -H | -H | -Br | -H | 652 |
| 1224 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 604 |
| 1225 | -H | -H | -H | -H | -H | 574 |

[Tabela 151]



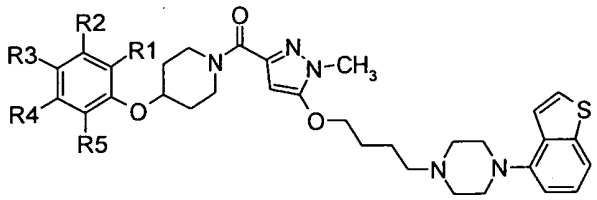

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1226 | -H | -H | -H | -Cl | -H | 622 |
| 1227 | -H | -H | -H | -H | -F | 606 |
| 1228 | -H | -H | -H | -H | -Cl | 622 |
| 1229 | -H | -H | -Cl | -Cl | -H | 656 |
| 1230 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | 618 |
| 1231 | -H | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | -H | 648 |
| 1232 | -H | -H | $-CH_3$ | -H | -H | 602 |
| 1233 | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | 602 |
| 1234 | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | 602 |
| 1235 | -H | -H | -F | -H | -H | 606 |
| 1236 | -H | -H | -H | -F | -H | 606 |
| 1237 | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | 672 |
| 1238 | -H | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | 672 |
| 1239 | -H | -H | -H | -H | $-OCF_3$ | 672 |
| 1240 | -H | -H | $-OCH_3$ | -Cl | -H | 652 |
| 1241 | -H | -H | -H | -Br | -H | 666 |
| 1242 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 618 |
| 1243 | -H | -H | -H | -H | -H | 588 |

[Tabela 152]



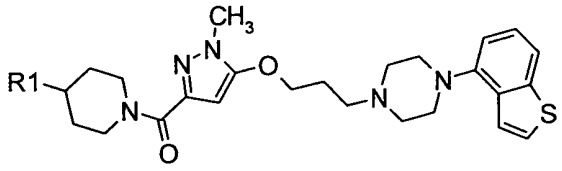

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1244 | -H | -H | -CN | -H | -H | 585 |
| 1245 | -H | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | 590 |
| 1246 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | 590 |
| 1247 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 590 |
| 1248 | -H | -H | -H | -H | -H | 560 |
| 1249 | -H | -H | -H | -H | -Cl | 594 |
| 1250 | -H | -H | -H | -Cl | -H | 594 |
| 1251 | -H | -H | -Cl | -H | -H | 594 |
| 1252 | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | 574 |
| 1253 | -H | -H | $-CH_3$ | -H | -H | 574 |
| 1254 | -H | -H | -F | -H | -H | 578 |
| 1255 | -H | -H | $-CF_3$ | -H | -H | 628 |

[Tabela 153]



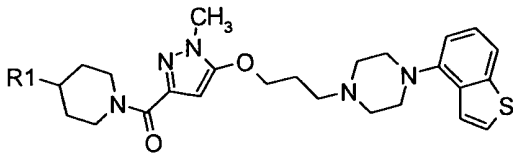
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1256 | -H | -H | -CN | -H | -H | 599 |
| 1257 | -H | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | 604 |
| 1258 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | 604 |
| 1259 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 604 |
| 1260 | -H | -H | -H | -H | -H | 574 |
| 1261 | -H | -H | -H | -H | -Cl | 608 |
| 1262 | -H | -H | -H | -Cl | -H | 608 |
| 1263 | -H | -H | -Cl | -H | -H | 608 |
| 1264 | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | 588 |
| 1265 | -H | -H | $-CH_3$ | -H | -H | 588 |
| 1266 | -H | -H | -F | -H | -H | 592 |
| 1267 | -H | -H | $-CF_3$ | -H | -H | 642 |

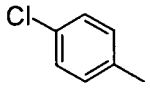
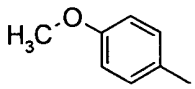
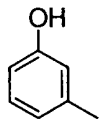
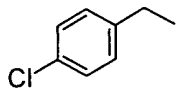
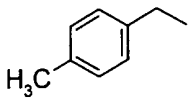
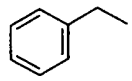
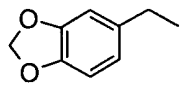
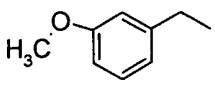
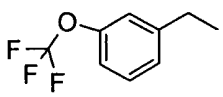
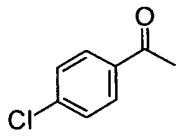
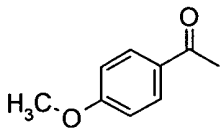
[Tabela 154]



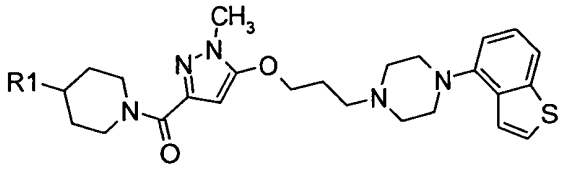
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1268 | $-OCH_3$ | 498 |
| 1269 | $-CH_2CONHC_2H_5$ | 553 |
| 1270 | -OH | 484 |
| 1271 | $-CO_2C_2H_5$ | 540 |
| 1272 | $-CONH_2$ | 511 |
| 1273 | $-CH_2OH$ | 498 |
| 1274 | $-N(CH_3)CO_2C(CH_3)_3$ | 597 |
| 1275 | $-NHCO_2C(CH_3)_3$ | 583 |
| 1276 | $-CO_2C(CH_3)_3$ | 568 |
| 1277 | $-NHCOCH_3$ | 525 |
| 1278 | $-N(CH_3)COCH_3$ | 539 |
| 1279 | -COOH | 512 |
| 1280 | $-N(CH_3)CO(CH_2)_2CH_3$ | 567 |
| 1281 | $-NHCO(CH_2)_2CH_3$ | 553 |

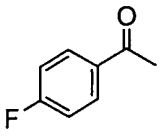
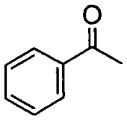
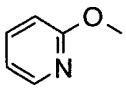
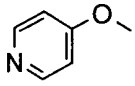
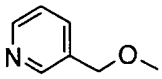
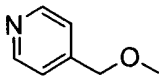
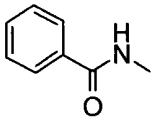
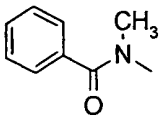
[Tabela 155]



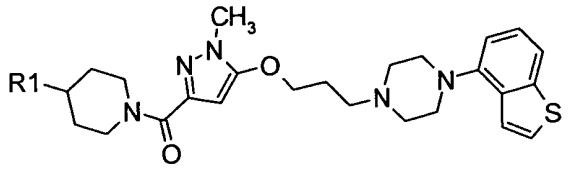
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1282 |  | 578 |
| 1283 |  | 574 |
| 1284 |  | 560 |
| 1285 |  | 592 |
| 1286 |  | 572 |
| 1287 |  | 558 |
| 1288 |  | 602 |
| 1289 |  | 588 |
| 1290 |  | 642 |
| 1291 |  | 606 |
| 1292 |  | 602 |

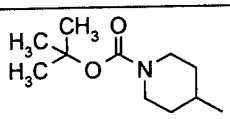
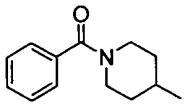
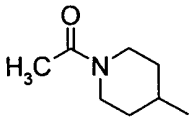
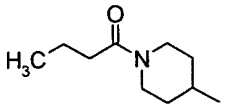
[Tabela 156]



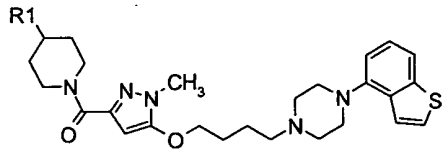
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1293 |  | 590 |
| 1294 |  | 572 |
| 1295 |  | 545 |
| 1296 |  | 561 |
| 1297 |  | 561 |
| 1298 |  | 575 |
| 1299 |  | 575 |
| 1300 |  | 587 |
| 1301 |  | 601 |

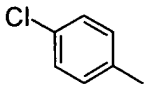
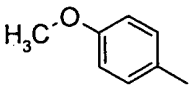
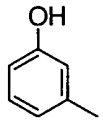
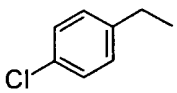
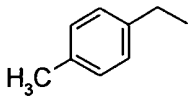
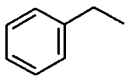
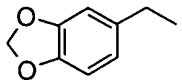
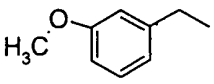
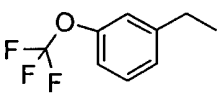
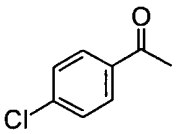
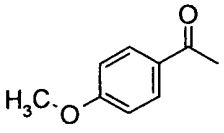
[Tabela 157]



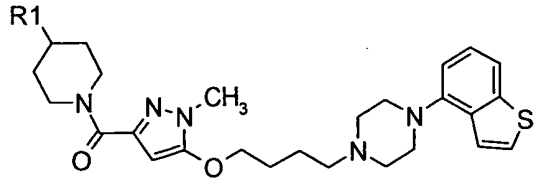
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1302 |  | 651 |
| 1303 |  | 655 |
| 1304 |  | 593 |
| 1305 |  | 621 |

[Tabela 158]



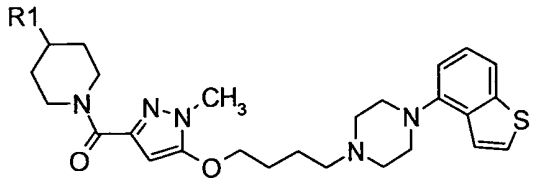
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1306 |  | 592 |
| 1307 |  | 588 |
| 1308 |  | 574 |
| 1309 |  | 606 |
| 1310 |  | 586 |
| 1311 |  | 572 |
| 1312 |  | 616 |
| 1313 |  | 602 |
| 1314 |  | 656 |
| 1315 |  | 620 |
| 1316 |  | 616 |

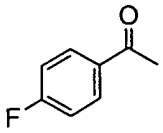
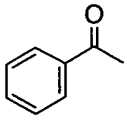
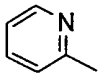
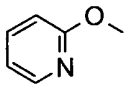
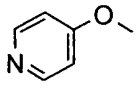
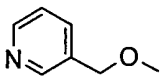
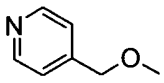
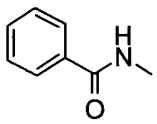
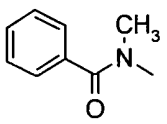
[Tabela 159]



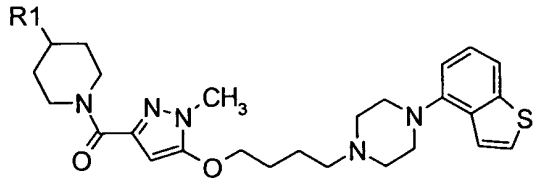
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1317 | $-OCH_3$ | 512 |
| 1318 | $-CH_2CONHC_2H_5$ | 567 |
| 1319 | -OH | 498 |
| 1320 | $-CO_2C_2H_5$ | 554 |
| 1321 | $-CONH_2$ | 525 |
| 1322 | $-CH_2OH$ | 512 |
| 1323 | $-N(CH_3)CO_2C(CH_3)_3$ | 611 |
| 1324 | $-NHCO_2C(CH_3)_3$ | 597 |
| 1325 | $-CO_2C(CH_3)_3$ | 582 |
| 1326 | $-NHCOCH_3$ | 539 |
| 1327 | $-N(CH_3)COCH_3$ | 553 |
| 1328 | $-N(CH_3)CO(CH_2)_2CH_3$ | 581 |
| 1329 | $-NHCO(CH_2)_2CH_3$ | 567 |
| 1330 | -COOH | 526 |

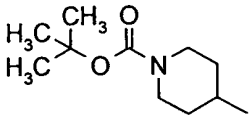
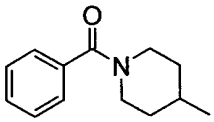
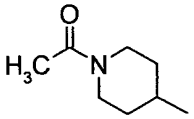
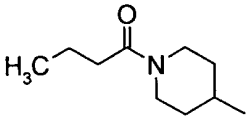
[Tabela 160]



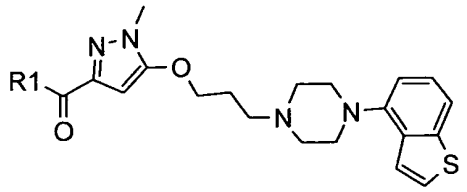
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1331 |  | 604 |
| 1332 |  | 586 |
| 1333 |  | 559 |
| 1334 |  | 575 |
| 1335 |  | 575 |
| 1336 |  | 589 |
| 1337 |  | 589 |
| 1338 |  | 601 |
| 1339 |  | 615 |

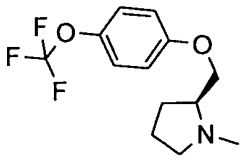
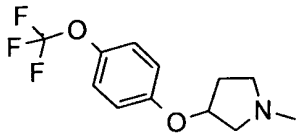
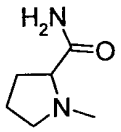
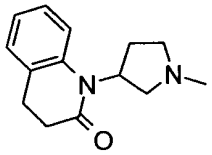
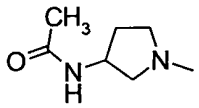
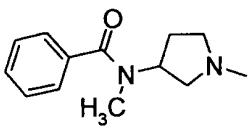
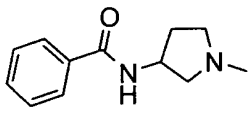
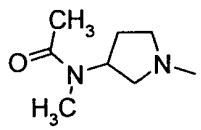
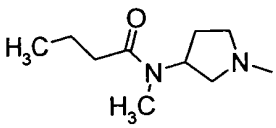
[Tabela 161]

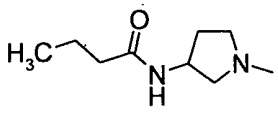


| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1340 |  | 665 |
| 1341 |  | 669 |
| 1342 |  | 607 |
| 1343 |  | 635 |

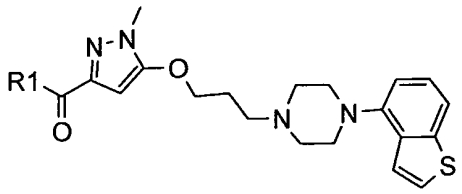
[Tabela 162]

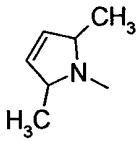
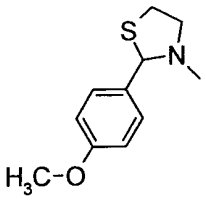
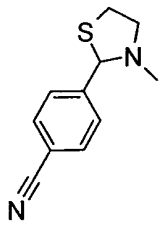
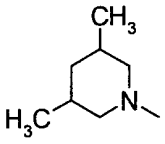
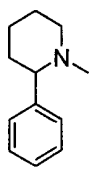
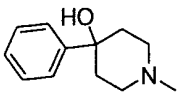
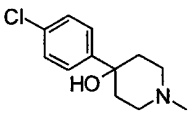


| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1344 |  | 644 |
| 1345 |  | 630 |
| 1346 |  | 497 |
| 1347 |  | 599 |
| 1348 |  | 511 |
| 1349 |  | 587 |
| 1350 |  | 573 |
| 1351 |  | 525 |
| 1352 |  | 553 |

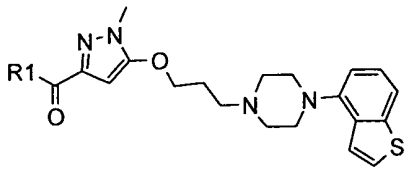
| | | |
|---|---|---|
| 1353 |  | 539 |

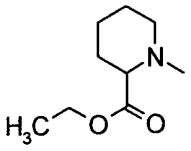
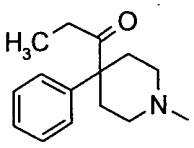
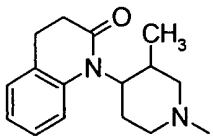
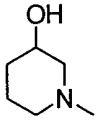
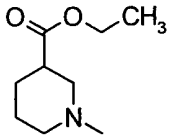
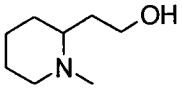
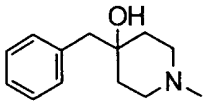
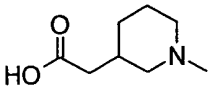
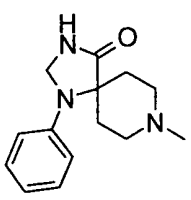
[Tabela 163]



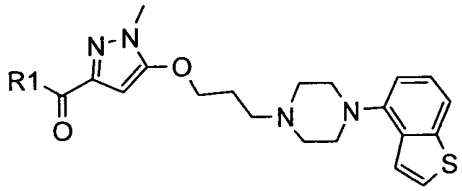
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1354 |  | 480 |
| 1355 |  | 472 |
| 1356 |  | 578 |
| 1357 |  | 573 |
| 1358 |  | 496 |
| 1359 |  | 544 |
| 1360 |  | 560 |
| 1361 |  | 594 |

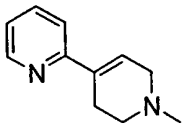
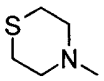
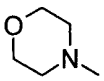
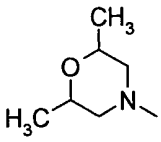
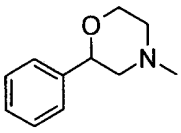
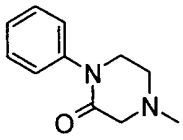
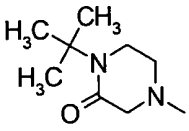
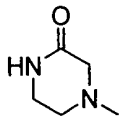
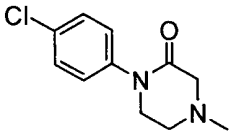
[Tabela 164]

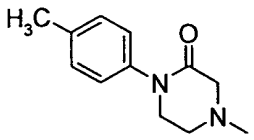


| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1362 |  | 540 |
| 1363 |  | 600 |
| 1364 |  | 627 |
| 1365 |  | 484 |
| 1366 |  | 540 |
| 1367 |  | 512 |
| 1368 |  | 574 |
| 1369 |  | 526 |
| 1370 |  | 614 |

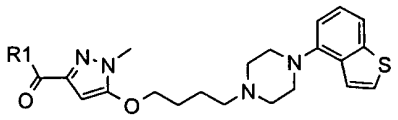
[Tabela 165]

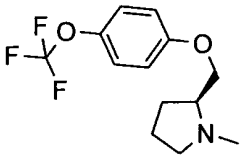
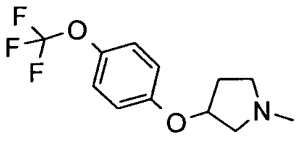
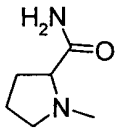
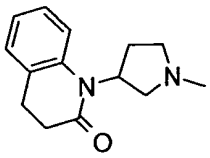
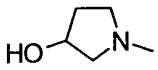
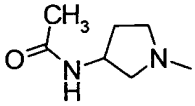
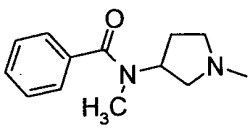
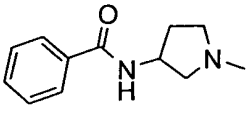


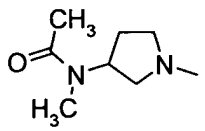
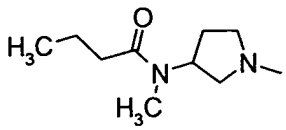
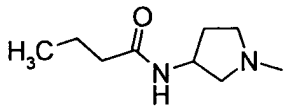
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1371 |  | 543 |
| 1372 |  | 486 |
| 1373 |  | 470 |
| 1374 |  | 498 |
| 1375 |  | 546 |
| 1376 |  | 559 |
| 1377 |  | 539 |
| 1378 |  | 483 |
| 1379 |  | 593 |

| | | |
|---|---|---|
| 1380 |  | 573 |

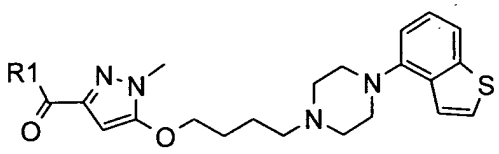
[Tabela 166]

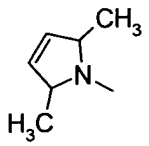
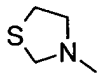
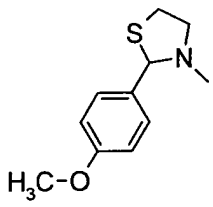
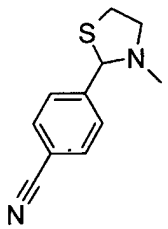
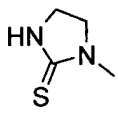


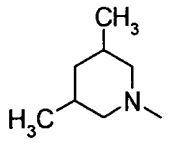
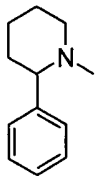
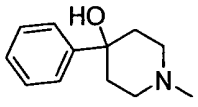
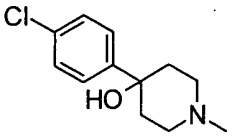
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1381 |  | 468 |
| 1382 |  | 658 |
| 1383 |  | 644 |
| 1384 |  | 511 |
| 1385 |  | 613 |
| 1386 |  | 484 |
| 1387 |  | 525 |
| 1388 |  | 601 |
| 1389 |  | 587 |

| | | |
|---|---|---|
| 1390 |  | 539 |
| 1391 |  | 567 |
| 1392 |  | 553 |

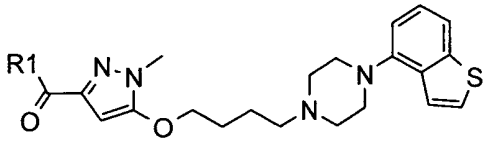
[Tabela 167]

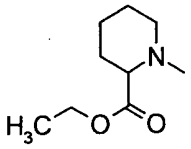
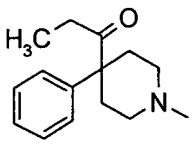
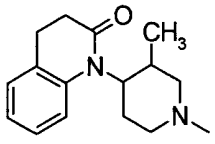
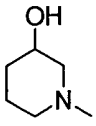


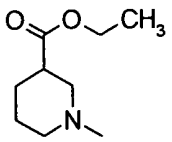
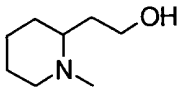
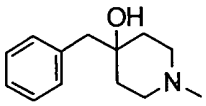
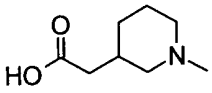
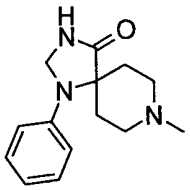
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1393 |  | 494 |
| 1394 |  | 486 |
| 1395 |  | 592 |
| 1396 |  | 587 |
| 1397 |  | 499 |

| | | |
|---|---|---|
| 1398 |  | 510 |
| 1399 |  | 558 |
| 1400 |  | 574 |
| 1401 |  | 608 |

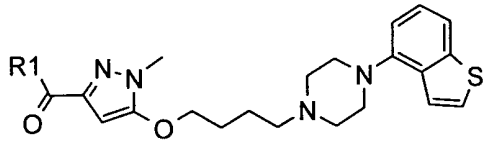
[Tabela 168]

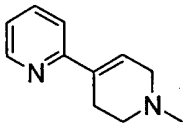
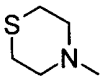
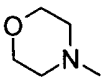
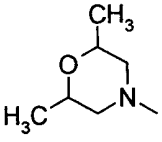


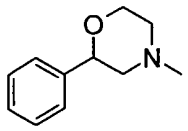
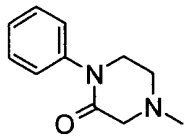
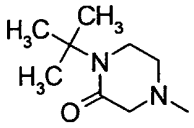
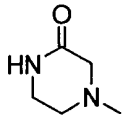
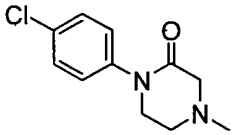
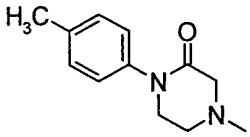
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1402 |  | 554 |
| 1403 |  | 614 |
| 1404 |  | 641 |
| 1405 |  | 498 |

| | | |
|---|---|---|
| 1406 |  | 554 |
| 1407 |  | 526 |
| 1408 |  | 588 |
| 1409 |  | 540 |
| 1410 |  | 628 |

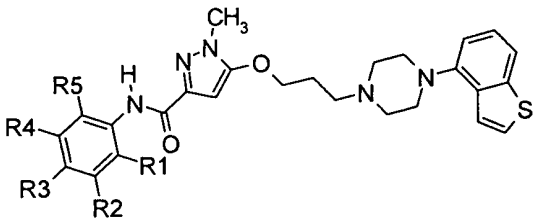
[Tabela 169]



| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 1411 |  | 557 |
| 1412 |  | 500 |
| 1413 |  | 484 |
| 1414 |  | 512 |

| | | |
|---|---|---|
| 1415 |  | 560 |
| 1416 |  | 573 |
| 1417 |  | 553 |
| 1418 |  | 497 |
| 1419 |  | 607 |
| 1420 |  | 587 |

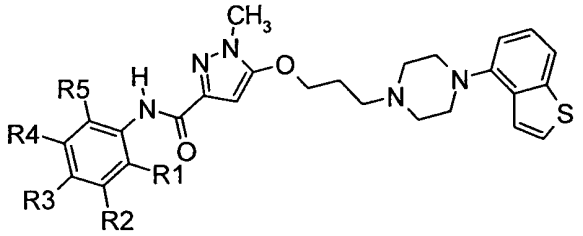
[Tabela 170]

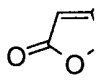
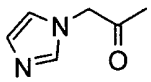
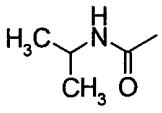
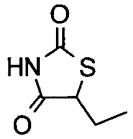


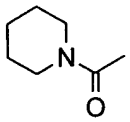
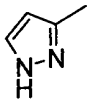
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1421 | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | 560 |
| 1422 | -H | -H | -H | -H | $-SO_2NH_2$ | 555 |
| 1423 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 506 |
| 1424 | -H | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | 506 |
| 1425 | -H | -H | $-COCH_3$ | -H | -H | 518 |
| 1426 | -H | -H | -H | -H | $-CO_2CH_3$ | 534 |
| 1427 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | 536 |
| 1428 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | 536 |
| 1429 | -H | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | -H | 536 |
| 1430 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | 563 |

| | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1431 | -H | -H | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | 536 |
| 1432 | -H | -H | $-N(CH_3)_2$ | -H | -H | 519 |
| 1433 | -H | -H | -H | $-COCH_3$ | -H | 518 |
| 1434 | -H | -H | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | 533 |
| 1435 | -H | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | 533 |
| 1436 | -H | -CN | -H | -H | -H | 501 |
| 1437 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-CO_2CH_3$ | -H | 564 |
| 1438 | -H | -H | $-OC_6H_5$ | -H | -H | 568 |
| 1439 | -H | $-CO_2CH_3$ | -H | $-CO_2CH_3$ | -H | 592 |
| 1440 | -H | -H | -OH | -Cl | -H | 526 |
| 1441 | -Cl | -H | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | 567 |
| 1442 | -H | -CN | -H | -H | -Cl | 535 |
| 1443 | -Cl | -H | -H | $-CONH_2$ | -H | 553 |
| 1444 | -H | -H | $-NO_2$ | -H | -H | 521 |
| 1445 | -H | -H | -CN | -H | -H | 501 |

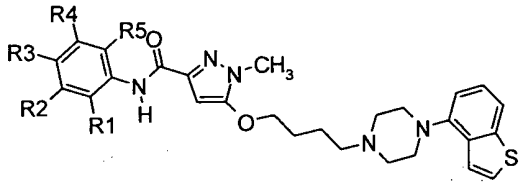
[Tabela 171]




| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1446 | -H | -H |  | -H | -H | 558 |
| 1447 | -H | -H |  | -H | -H | 584 |
| 1448 | -H | -H |  | -H | -H | 561 |
| 1449 | -H | -H |  | -H | -H | 605 |

| | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1450 | -H | -H | -H |  | -H | 587 |
| 1451 | -H | -H | -H |  | -H | 542 |

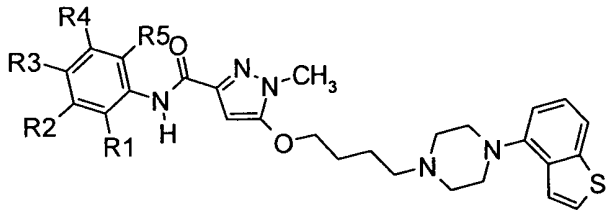
[Tabela 172]

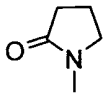
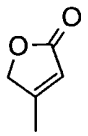
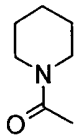
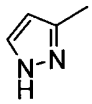


| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1452 | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | 574 |
| 1453 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 520 |
| 1454 | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 520 |
| 1455 | -H | -H | $-COCH_3$ | -H | -H | 532 |
| 1456 | $-CO_2CH_3$ | -H | -H | -H | -H | 548 |
| 1457 | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 550 |
| 1458 | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | 550 |
| 1459 | -H | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | -H | 550 |
| 1460 | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | 577 |
| 1461 | -H | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | 550 |
| 1462 | -H | -H | $-N(CH_3)_2$ | -H | -H | 533 |
| 1463 | -H | $-COCH_3$ | -H | -H | -H | 532 |
| 1464 | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | -H | 547 |
| 1465 | -H | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | 547 |
| 1466 | -H | $-CO_2CH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | 578 |
| 1467 | -H | -H | $-OC_6H_5$ | -H | -H | 582 |
| 1468 | -H | $-CO_2CH_3$ | -H | $-CO_2CH_3$ | -H | 606 |
| 1469 | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 550 |
| 1470 | -H | -Cl | -OH | -H | -H | 540 |
| 1471 | -H | $-OCH_2C_6H_5$ | -H | -H | -H | 596 |
| 1472 | -H | -H | $-NHSO_2CH_3$ | -H | -H | 583 |
| 1473 | -H | -H | $-CONHC_6H_5$ | -H | -H | 609 |
| 1474 | -H | -H | $-CONHCH_3$ | -H | -H | 547 |
| 1475 | -H | -H | $-NHC_6H_5$ | -H | -H | 581 |
| 1476 | -H | -H | $-CH_2CH_2OH$ | -H | -H | 534 |
| 1477 | -H | -H | -CCH | -H | -H | 514 |

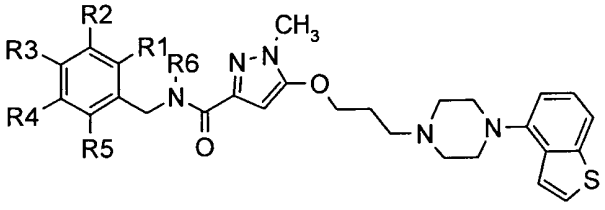
| | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1478 | -H | -H | $-COC_3H_7$ | -H | -H | 560 |
| 1479 | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | -H | -H | 547 |
| 1480 | -H | $-CONHCH_3$ | -H | -H | -H | 547 |

[Tabela 173]



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1481 | -H | -H |  | -H | -H | 573 |
| 1482 | -H | -H |  | -H | -H | 572 |
| 1483 | -H |  | -H | -H | -H | 601 |
| 1484 | -H |  | -H | -H | -H | 556 |
| 1485 | -H |  | -H | -H | -H | 557 |

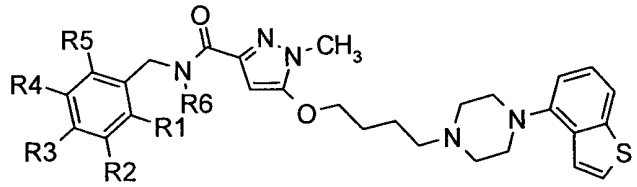
[Tabela 174]



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1486 | -H | -H | -H | -H | -H | -H | 490 |
| 1487 | -Cl | -H | -H | -H | -H | -H | 524 |
| 1488 | -H | -Cl | -H | -H | -H | -H | 524 |

| | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1489 | -H | -H | -Cl | -H | -H | -H | 524 |
| 1490 | -H | -H | -H | -H | -H | $-CH_2CONHCH_3$ | 561 |
| 1491 | -H | -H | $-OC_2H_5$ | -H | -H | $-CH_3$ | 548 |
| 1492 | -H | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | 564 |
| 1493 | -H | -H | $-OC_2H_5$ | -H | -H | $-C_2H_5$ | 562 |
| 1494 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 520 |
| 1495 | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | 520 |
| 1496 | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | 588 |
| 1497 | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | -H | 574 |
| 1498 | -H | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 550 |
| 1499 | -H | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | $-C_2H_5$ | 578 |
| 1500 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | 520 |
| 1501 | -H | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 550 |
| 1502 | -H | $-OC_4H_9$ | -H | $-OC_4H_9$ | -H | -H | 634 |
| 1503 | $-OC_2H_5$ | -H | -H | -H | -H | -H | 534 |
| 1504 | -H | -H | -H | -H | -H | $-(CH_2)_3OH$ | 548 |
| 1505 | -H | -Cl | $-OCHF_2$ | -H | -H | -H | 590 |
| 1506 | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | -H | -H | 574 |
| 1507 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | 534 |

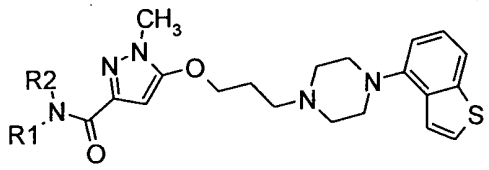
[Tabela 175]




| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1508 | -H | -H | -H | -H | -H | -H | 504 |
| 1509 | -Cl | -H | -H | -H | -H | -H | 538 |
| 1510 | -H | -Cl | -H | -H | -H | -H | 538 |
| 1511 | -H | -H | -Cl | -H | -H | -H | 538 |
| 1512 | -H | -H | -H | -H | -H | $-CH_2CONHCH_3$ | 575 |
| 1513 | -H | -H | $-OC_2H_5$ | -H | -H | $-CH_3$ | 562 |
| 1514 | -H | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | 578 |
| 1515 | -H | -H | $-OC_2H_5$ | -H | -H | $-C_2H_5$ | 576 |
| 1516 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 534 |
| 1517 | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | 534 |
| 1518 | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | 602 |
| 1519 | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | -H | 588 |
| 1520 | -H | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 564 |

| | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 1521 | -H | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | $-C_2H_5$ | 592 |
| 1522 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | 534 |
| 1523 | -H | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 564 |
| 1524 | -H | $-OC_4H_9$ | -H | $-OC_4H_9$ | -H | -H | 648 |
| 1525 | $-OC_2H_5$ | -H | -H | -H | -H | -H | 548 |
| 1526 | -H | -H | -H | -H | -H | $-(CH_2)_3OH$ | 562 |
| 1527 | -H | -Cl | $-OCHF_2$ | -H | -H | -H | 604 |
| 1528 | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | -H | -H | 588 |
| 1529 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | 548 |

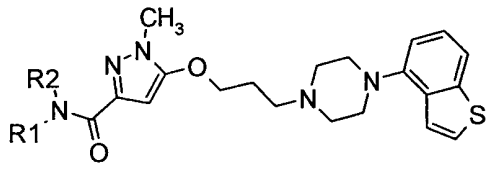
[Tabela 176]




| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1530 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | $-CH_3$ | 496 |
| 1531 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | -H | 482 |
| 1532 | $-CH_2CH(CH_3)_2$ | $-CH_2CH(CH_3)_2$ | 512 |
| 1533 | $-CH_2CH_2OH$ | $-CH_2CH_2OH$ | 488 |
| 1534 | $-CH_2CH_2OH$ | $-C_2H_5$ | 472 |
| 1535 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | $-CH_2CH_2OH$ | 526 |
| 1536 | $-CH_2CH_2OCH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 516 |
| 1537 | $-C_2H_5$ | $-C_2H_5$ | 456 |
| 1538 | $-C_4H_9$ | -H | 456 |
| 1539 | $-C(CH_3)_3$ | -H | 456 |
| 1540 | -ciclo-$C_3H_5$ | -H | 440 |
| 1541 | $-CH_3$ | -H | 414 |
| 1542 | $-C_2H_5$ | -H | 428 |
| 1543 | $-CH_2CH(CH_3)_2$ | -H | 456 |
| 1544 | $-CH_2CH_2OCH_3$ | -H | 458 |
| 1545 | $-CH_2CH_2OC_2H_5$ | -H | 472 |
| 1546 | $-(CH_2)_3OC_2H_5$ | -H | 486 |
| 1547 | $-(CH_2)_2OC_6H_5$ | -H | 520 |
| 1548 | $-CH_2$-ciclo-$C_3H_5$ | -H | 454 |
| 1549 | $-(CH_2)_2NHCOCH_3$ | -H | 485 |
| 1550 | $-(CH_2)_5OH$ | -H | 486 |
| 1551 | $-(CH_2)_2C_6H_5$ | -H | 504 |
| 1552 | $-CH_2CO_2CH_3$ | -H | 472 |
| 1553 | $-CH_2CONH_2$ | -H | 457 |

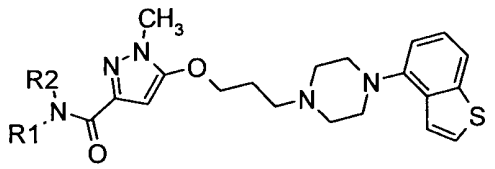
| | | | |
|---|---|---|---|
| 1554 | $-CH(CO_2C_2H_5)_2$ | -H | 558 |
| 1555 | $-CH(CH_3)CO_2C_2H_5$ | -H | 500 |
| 1556 | $-CH_2CO_2CH_3$ | $-CH_3$ | 486 |
| 1557 | $-CH_2CCH$ | -H | 438 |
| 1558 | $-(CH_2)_2CH(CH_3)_2$ | -H | 470 |
| 1559 | $-(CH_2)_3CO_2C_2H_5$ | $-CH_3$ | 528 |
| 1560 | $-(CH_2)_4CO_2C_2H_5$ | -H | 528 |
| 1561 | $-CH(CONH_2)_2$ | -H | 500 |
| 1562 | $-CH_2CF_3$ | -H | 482 |
| 1563 | $-NHCH_2CF_3$ | -H | 497 |
| 1564 | $-CH_3$ | $-CH_3$ | 428 |
| 1565 | $-(CH_2)_3OCH(CH_3)_2$ | -H | 500 |

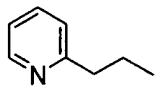
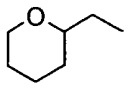
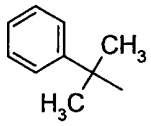
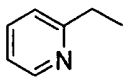
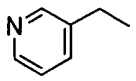
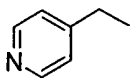
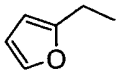
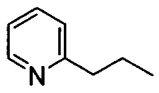
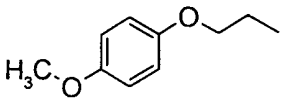
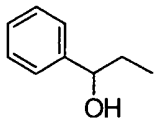
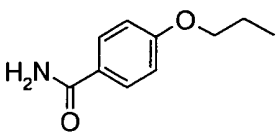
[Tabela 177]

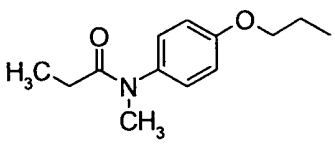



| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1566 | $-CH_2CN$ | -H | 439 |
| 1567 | $-(CH_2)_2OCH(CH_3)_2$ | -H | 486 |
| 1568 | $-CH(C_2H_5)CH_2OCH_3$ | -H | 486 |
| 1569 | $-CH(CH_3)CH_2OCH_3$ | -H | 472 |
| 1570 | $-CH_2CH_2F$ | -H | 446 |
| 1571 | $-CH_2CH(OH)CH_2OH$ | -H | 474 |
| 1572 | $-CH_2CONHCH_3$ | -H | 471 |
| 1573 | $-(CH_2)_2SCH_3$ | -H | 474 |
| 1574 | $-CH_2CH_2OH$ | -H | 444 |
| 1575 | $-C_6H_{13}$ | -H | 484 |
| 1576 | $-CH_2CON(CH_3)_2$ | $-CH_3$ | 499 |
| 1577 | $-(CH_2)_2N(CH_3)COCH_3$ | -H | 499 |
| 1578 | $-(CH_2)_2N(CH_3)CO(CH_2)_2CH_3$ | -H | 527 |

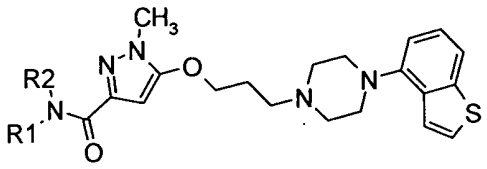
[Tabela 178]

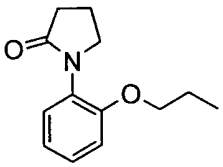
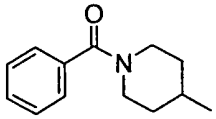
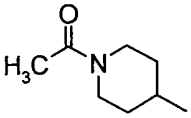
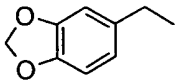
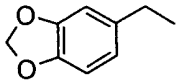
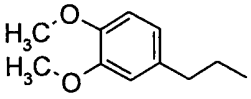
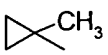
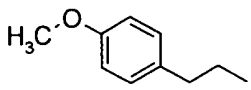
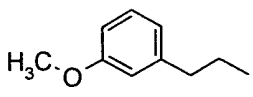
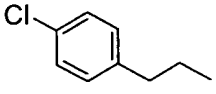


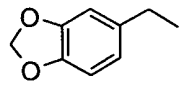
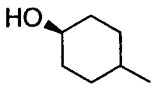
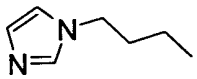
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1579 |  | $-CH_3$ | 519 |
| 1580 |  | $-C_2H_5$ | 526 |
| 1581 |  | -H | 518 |
| 1582 |  | -H | 491 |
| 1583 |  | -H | 491 |
| 1584 |  | -H | 491 |
| 1585 |  | -H | 480 |
| 1586 |  | $-C_2H_5$ | 533 |
| 1587 |  | $-C_2H_5$ | 578 |
| 1588 |  | $-CH_3$ | 534 |
| 1589 |  | $-C_2H_5$ | 591 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1590 |  | $-C_2H_5$ | 633 |

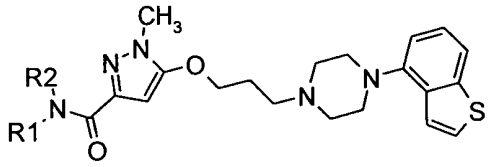
[Tabela 179]

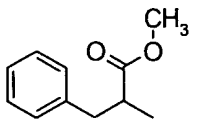
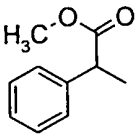
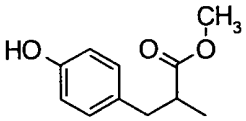
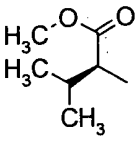
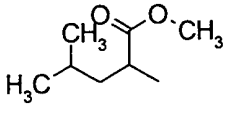
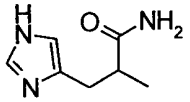
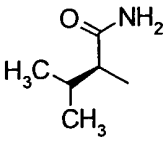


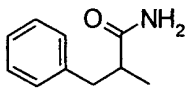
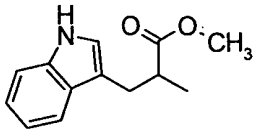
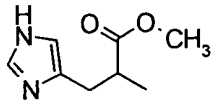
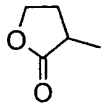
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1591 |  | $-C_2H_5$ | 631 |
| 1592 |  | $-CH_3$ | 601 |
| 1593 |  | $-CH_3$ | 539 |
| 1594 |  | $-CH_3$ | 548 |
| 1595 |  | $-C_2H_5$ | 562 |
| 1596 |  | $-C_2H_5$ | 592 |
| 1597 |  | -H | 454 |
| 1598 |  | -H | 534 |
| 1599 |  | -H | 534 |
| 1600 |  | -H | 538 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1601 |  | -H | 534 |
| 1602 |  | -H | 498 |
| 1603 |  | -H | 508 |

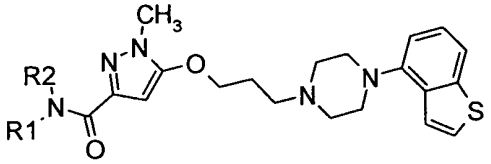
[Tabela 180]

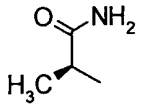
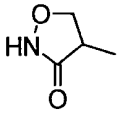
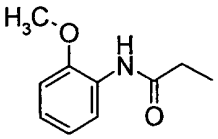
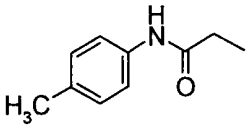
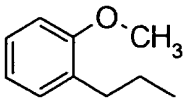
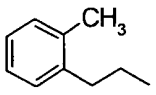


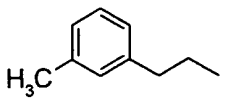
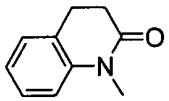
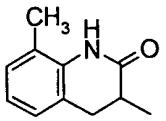
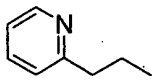
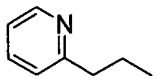
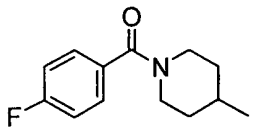
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1604 |  | -H | 562 |
| 1605 |  | -H | 548 |
| 1606 |  | -H | 578 |
| 1607 |  | -H | 514 |
| 1608 |  | -H | 528 |
| 1609 |  | -H | 537 |
| 1610 |  | -H | 499 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1611 |  | -H | 547 |
| 1612 |  | -H | 601 |
| 1613 |  | -H | 552 |
| 1614 |  | -H | 484 |

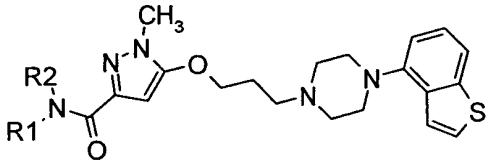
[Tabela 181]

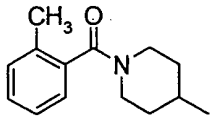
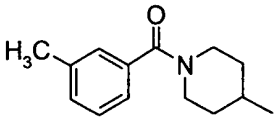
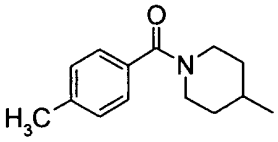


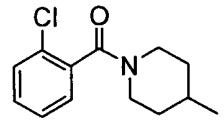
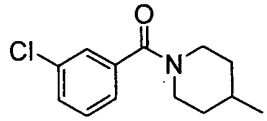
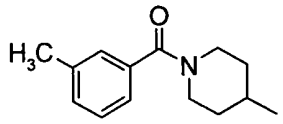
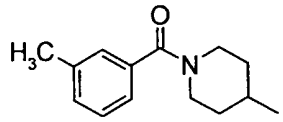
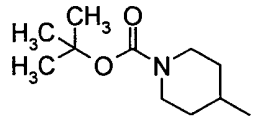
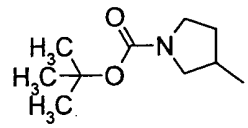
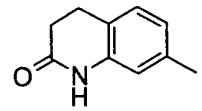
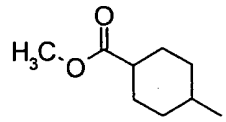
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1615 |  | -H | 471 |
| 1616 |  | -H | 485 |
| 1617 |  | $-CH_3$ | 577 |
| 1618 |  | $-CH_3$ | 561 |
| 1619 |  | -H | 534 |
| 1620 |  | -H | 518 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1621 |  | -H | 518 |
| 1622 |  | -H | 545 |
| 1623 |  | -H | 559 |
| 1624 |  | -H | 505 |
| 1625 |  | -CH(CH$_3$)$_2$ | 547 |
| 1626 |  | -CH$_3$ | 619 |

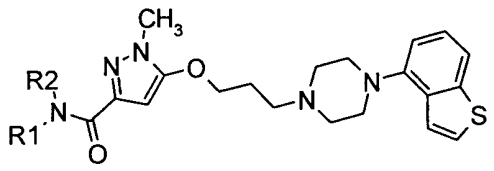
[Tabela 182]

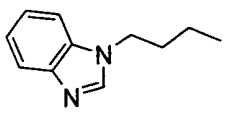


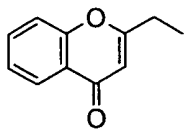
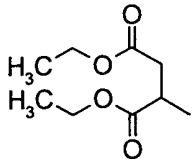
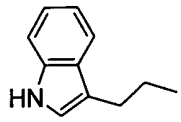
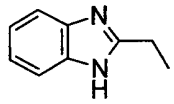
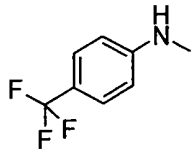
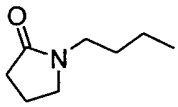
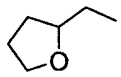
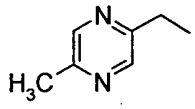
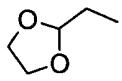
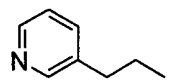
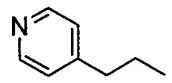
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1627 |  | -CH$_3$ | 615 |
| 1628 |  | -CH$_3$ | 615 |
| 1629 |  | -CH$_3$ | 615 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1630 |  | -$CH_3$ | 635 |
| 1631 |  | -$CH_3$ | 635 |
| 1632 |  | -$C_4H_9$ | 657 |
| 1633 |  | -$CH(CH_3)_2$ | 643 |
| 1634 |  | -H | 583 |
| 1635 |  | -H | 569 |
| 1636 |  | -$C_2H_5$ | 573 |
| 1637 |  | -H | 540 |

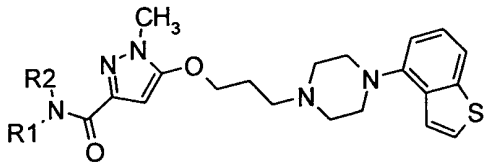
[Tabela 183]

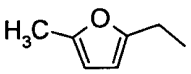
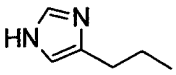
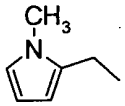
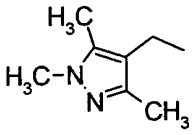
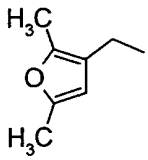
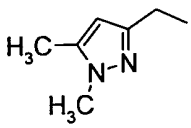
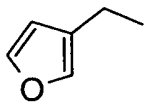
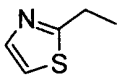
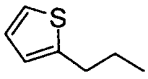
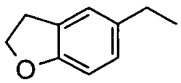
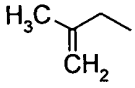


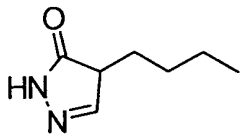
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) | MW |
|---|---|---|---|---|
| 1638 |  | -H | 558 | 557.72 |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 1639 |  | -H | 558 | 557.68 |
| 1640 |  | -H | 572 | 571.70 |
| 1641 |  | -H | 543 | 542.71 |
| 1642 |  | -H | 530 | 529.67 |
| 1643 |  | -H | 559 | 558.63 |
| 1644 |  | -H | 525 | 524.69 |
| 1645 |  | -H | 484 | 483.64 |
| 1646 |  | -H | 506 | 505.65 |
| 1647 |  | -H | 486 | 485.61 |
| 1648 |  | -H | 505 | 504.66 |
| 1649 |  | -H | 505 | 504.66 |

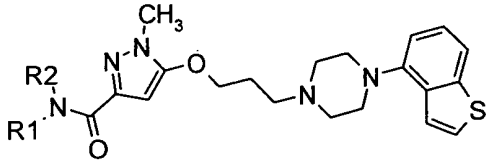
[Tabela 184]

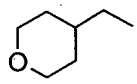
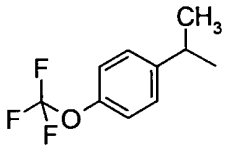
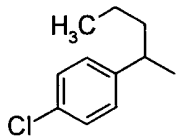
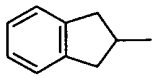
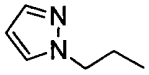
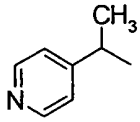
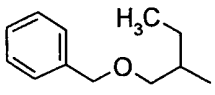
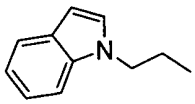
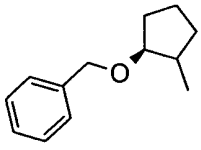


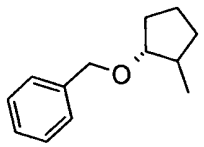
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1650 |  | -H | 494 |
| 1651 |  | -H | 494 |
| 1652 |  | -H | 493 |
| 1653 |  | -H | 522 |
| 1654 |  | -H | 508 |
| 1655 |  | -H | 508 |
| 1656 |  | -H | 480 |
| 1657 |  | -H | 497 |
| 1658 |  | -H | 510 |
| 1659 |  | -H | 532 |
| 1660 |  | -H | 454 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1661 |  | -H | 524 |

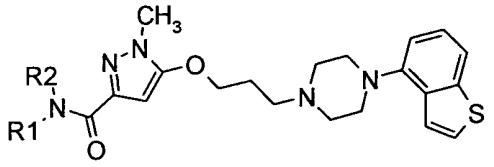
[Tabela 185]

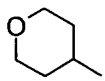
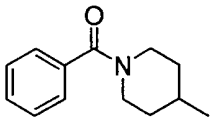
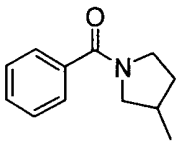
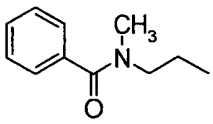
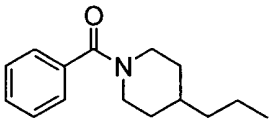
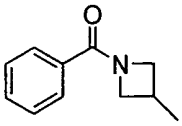
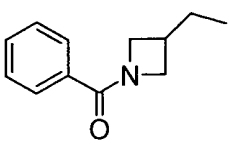
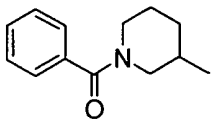


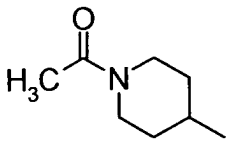
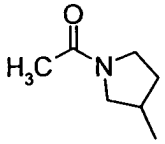
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1662 |  | -H | 498 |
| 1663 |  | -H | 588 |
| 1664 |  | -$CH_3$ | 580 |
| 1665 |  | -H | 516 |
| 1666 |  | -H | 494 |
| 1667 |  | -H | 505 |
| 1668 |  | -H | 562 |
| 1669 |  | -H | 543 |
| 1670 |  | -H | 574 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1671 |  | -H | 574 |

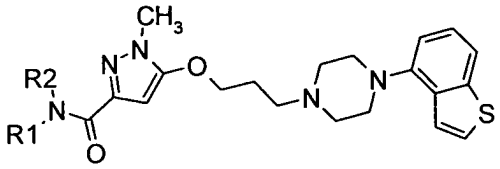
[Tabela 186]

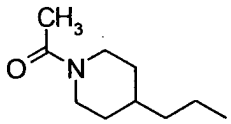
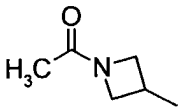
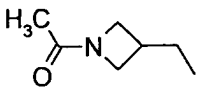
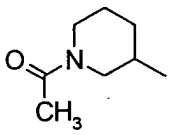
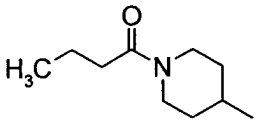
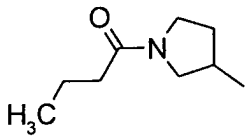
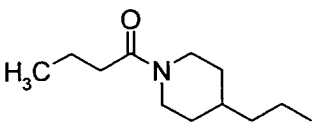


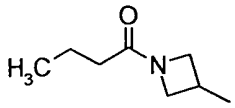
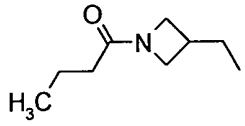
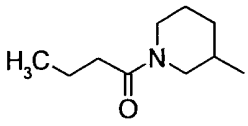
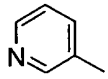
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1672 |  | -H | 484 |
| 1673 |  | -H | 587 |
| 1674 |  | -H | 573 |
| 1675 |  | -H | 561 |
| 1676 |  | -H | 615 |
| 1677 |  | -H | 559 |
| 1678 |  | -H | 573 |
| 1679 |  | -H | 587 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1680 |  | -H | 525 |
| 1681 |  | -H | 511 |

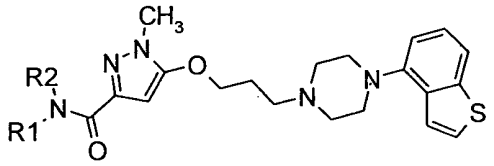
[Tabela 187]

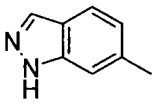
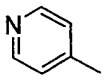
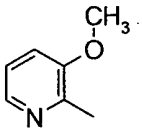
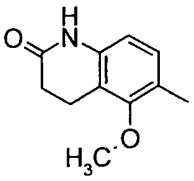
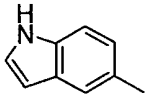


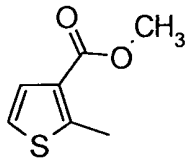
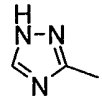
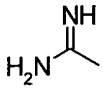
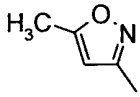
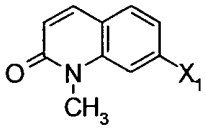
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1682 |  | -H | 553 |
| 1683 |  | -H | 497 |
| 1684 |  | -H | 511 |
| 1685 |  | -H | 525 |
| 1686 |  | -H | 553 |
| 1687 |  | -H | 539 |
| 1688 |  | -H | 581 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1689 |  | -H | 525 |
| 1690 |  | -H | 539 |
| 1691 |  | -H | 553 |
| 1692 |  | -H | 477 |

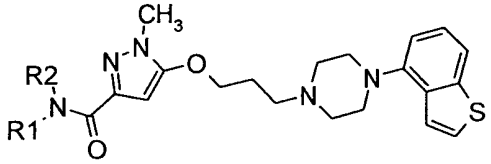
[Tabela 188]

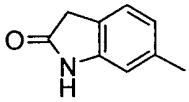
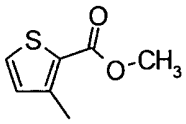
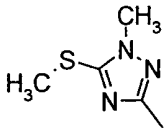
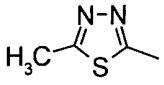
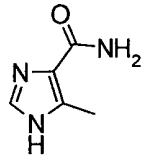


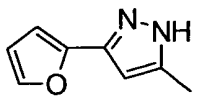
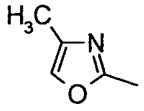
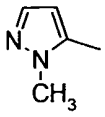
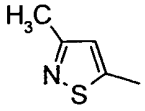
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1693 |  | -H | 516 |
| 1694 |  | -H | 477 |
| 1695 |  | -H | 507 |
| 1696 |  | -H | 575 |
| 1697 |  | -H | 515 |
| 1698 |  | -H | 483 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1699 |  | -H | 540 |
| 1700 |  | -H | 467 |
| 1701 |  | -H | 443 |
| 1702 |  | -H | 481 |
| 1703 |  | -H | 557 |

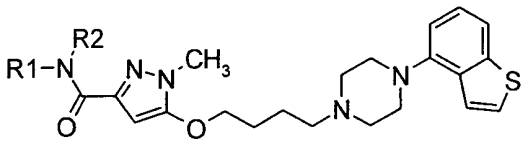
[Tabela 189]



| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1704 |  | -H | 531 |
| 1705 |  | -H | 540 |
| 1706 |  | -H | 527 |
| 1707 |  | -H | 498 |
| 1708 |  | -H | 509 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1709 |  | -H | 532 |
| 1710 |  | -H | 481 |
| 1711 |  | -H | 480 |
| 1712 |  | -H | 497 |
| 1713 |  | -H | 467 |

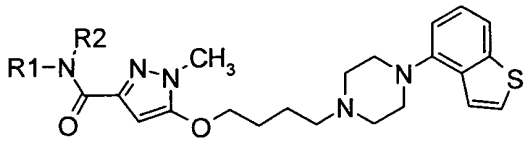
[Tabela 190]



| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1714 | $-CH_3$ | $-ciclo-C_6H_{11}$ | 510 |
| 1715 | -H | $-ciclo-C_6H_{11}$ | 496 |
| 1716 | -H | $-CH(CH_3)_2$ | 456 |
| 1717 | $-CH_2CH(CH_3)_2$ | $-CH_2CH(CH_3)_2$ | 526 |
| 1718 | $-CH_2CH_2OH$ | $-CH_2CH_2OH$ | 502 |
| 1719 | $-C_2H_5$ | $-CH_2CH_2OH$ | 486 |
| 1720 | $-CH_2CH_2OH$ | $-cyclo-C_6H_{11}$ | 540 |
| 1721 | $-CH_2CH_2OCH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 530 |
| 1722 | $-C_2H_5$ | $-C_2H_5$ | 470 |
| 1723 | -H | $-C_4H_9$ | 470 |
| 1724 | -H | $-C(CH_3)_3$ | 470 |
| 1725 | -H | $-ciclo-C_3H_5$ | 454 |
| 1726 | -H | $-CH_3$ | 428 |
| 1727 | -H | $-C_2H_5$ | 442 |
| 1728 | -H | $-C_3H_7$ | 456 |
| 1729 | -H | $-CH_2CH(CH_3)_2$ | 470 |
| 1730 | -H | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 472 |
| 1731 | -H | $-CH_2CH_2OC_2H_5$ | 486 |

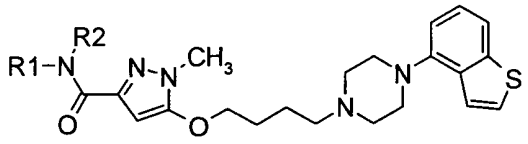
| | | | |
|---|---|---|---|
| 1732 | -H | $-(CH_2)_3OC_2H_5$ | 500 |
| 1733 | -H | $-(CH_2)_2OC_6H_5$ | 534 |
| 1734 | -H | $-CH_2$-ciclo-$C_3H_5$ | 468 |
| 1735 | -H | $-(CH_2)_2NHCOCH_3$ | 499 |
| 1736 | -H | $-(CH_2)_5OH$ | 500 |
| 1737 | -H | $-(CH_2)_2C_6H_5$ | 518 |
| 1738 | -H | $-CH_2CO_2CH_3$ | 486 |
| 1739 | -H | $-CH_2CONH_2$ | 471 |
| 1740 | -H | $-CH(CO_2C_2H_5)_2$ | 572 |
| 1741 | -H | $-CH(CH_3)CO_2C_2H_5$ | 514 |
| 1742 | $-CH_3$ | $-CH_2CO_2CH_3$ | 500 |
| 1743 | -H | $-CH_2CCH$ | 452 |
| 1744 | -H | $-(CH_2)_2CH(CH_3)_2$ | 484 |
| 1745 | $-CH_3$ | $-(CH_2)_3CO_2C_2H_5$ | 542 |
| 1746 | -H | $-(CH_2)_4CO_2C_2H_5$ | 542 |
| 1747 | -H | $-CH(CONH_2)_2$ | 514 |
| 1748 | -H | $-CH_2CF_3$ | 496 |
| 1749 | -H | $-NHCH_2CF_3$ | 511 |

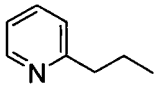
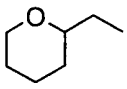
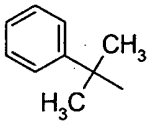
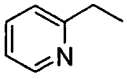
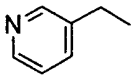
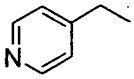
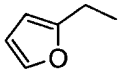
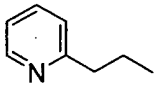
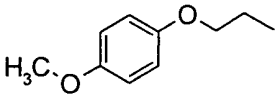
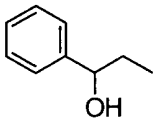
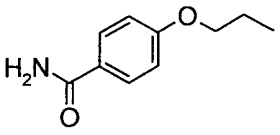
[Table 191]

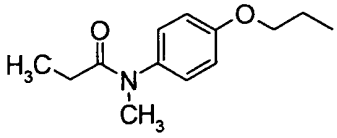


| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1750 | $-CH_3$ | $-CH_3$ | 442 |
| 1751 | -H | $-CH_2CH(OCH_3)_2$ | 502 |
| 1752 | -H | $-(CH_2)_3OCH(CH_3)_2$ | 514 |
| 1753 | -H | $-CH_2CN$ | 453 |
| 1754 | -H | $-(CH_2)_3OCH_3$ | 486 |
| 1755 | -H | $-(CH_2)_2OCH(CH_3)_2$ | 500 |
| 1756 | -H | $-CH(C_2H_5)CH_2OCH_3$ | 500 |
| 1757 | -H | $-CH(CH_3)CH_2OCH_3$ | 486 |
| 1758 | -H | $-CH_2CH_2F$ | 460 |
| 1759 | -H | $-CH_2CH(OH)CH_2OH$ | 488 |
| 1760 | -H | $-CH_2CONHCH_3$ | 485 |
| 1761 | -H | $-(CH_2)_2SCH_3$ | 488 |
| 1762 | -H | $-CH_2CH_2OH$ | 458 |
| 1763 | -H | $-C_6H_{13}$ | 498 |
| 1764 | $-CH_3$ | $-CH_2CON(CH_3)_2$ | 513 |
| 1765 | -H | $-(CH_2)_2N(CH_3)COCH_3$ | 513 |
| 1766 | -H | $-(CH_2)_2N(CH_3)CO(CH_2)_2CH_3$ | 541 |

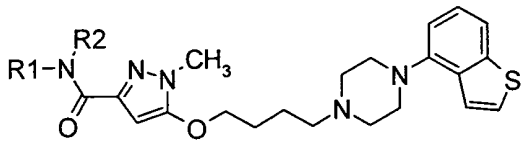
[Tabela 192]

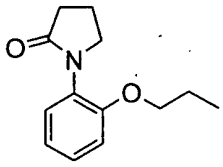
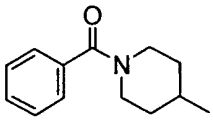
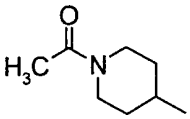
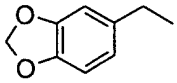
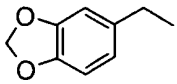
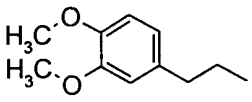
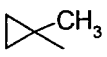
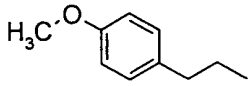
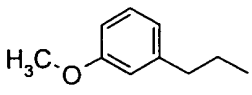
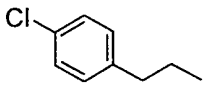


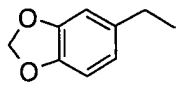
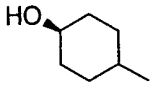
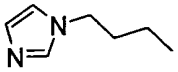
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1767 |  | -$CH_3$ | 533 |
| 1768 |  | -$C_2H_5$ | 540 |
| 1769 |  | -H | 532 |
| 1770 |  | -H | 505 |
| 1771 |  | -H | 505 |
| 1772 |  | -H | 505 |
| 1773 |  | -H | 494 |
| 1774 |  | -$C_2H_5$ | 547 |
| 1775 |  | -$C_2H_5$ | 592 |
| 1776 |  | -$CH_3$ | 548 |
| 1777 |  | -$C_2H_5$ | 605 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1778 |  | $-C_2H_5$ | 647 |

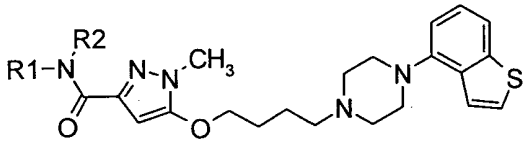
[Tabela 193]

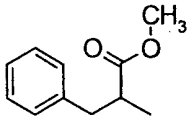
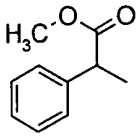
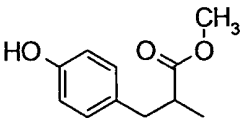
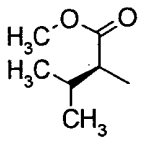
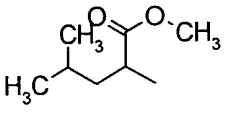
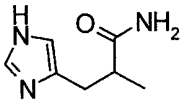
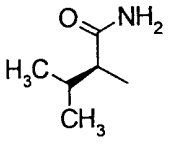


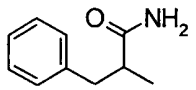
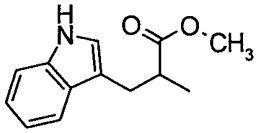
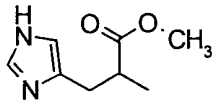
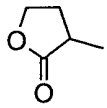
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1779 |  | $-C_2H_5$ | 645 |
| 1780 |  | $-CH_3$ | 615 |
| 1781 |  | $-CH_3$ | 553 |
| 1782 |  | $-CH_3$ | 562 |
| 1783 |  | $-C_2H_5$ | 576 |
| 1784 |  | $-C_2H_5$ | 606 |
| 1785 |  | -H | 468 |
| 1786 |  | -H | 548 |
| 1787 |  | -H | 548 |
| 1788 |  | -H | 552 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1789 |  | -H | 548 |
| 1790 |  | -H | 512 |
| 1791 |  | -H | 522 |

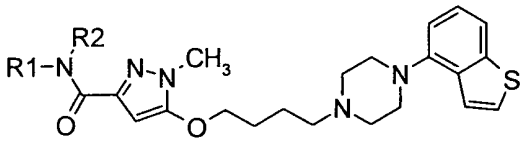
[Tabela 194]

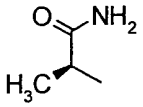
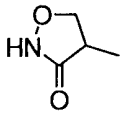
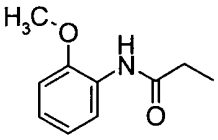
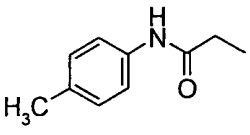
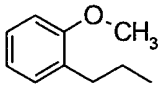
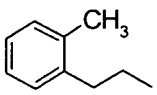


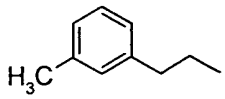
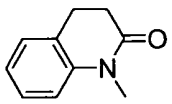
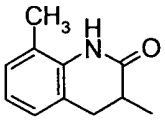
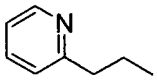
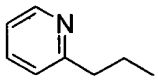
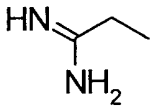
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1792 |  | -H | 576 |
| 1793 |  | -H | 562 |
| 1794 |  | -H | 592 |
| 1795 |  | -H | 528 |
| 1796 |  | -H | 542 |
| 1797 |  | -H | 551 |
| 1798 |  | -H | 513 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1799 |  | -H | 561 |
| 1800 |  | -H | 615 |
| 1801 |  | -H | 566 |
| 1802 |  | -H | 498 |

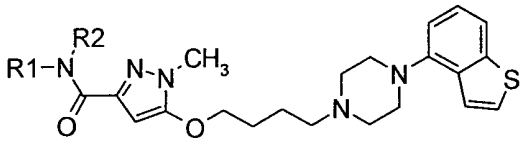
[Tabela 195]

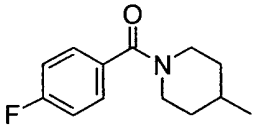
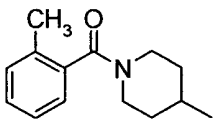
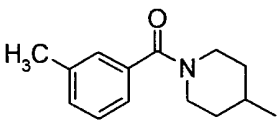
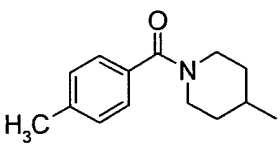


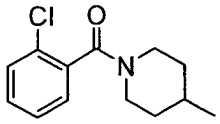
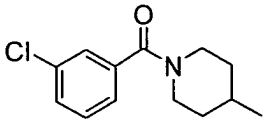
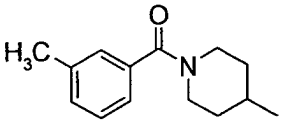
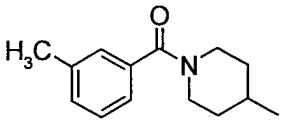
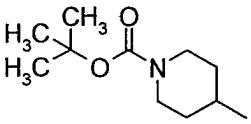
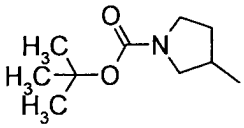
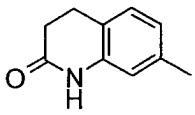
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1803 |  | -H | 485 |
| 1804 |  | -H | 499 |
| 1805 |  | -$CH_3$ | 591 |
| 1806 |  | -$CH_3$ | 575 |
| 1807 |  | -H | 548 |
| 1808 |  | -H | 532 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1809 |  | -H | 532 |
| 1810 |  | -H | 559 |
| 1811 |  | -H | 573 |
| 1812 |  | -H | 519 |
| 1813 |  | -$CH(CH_3)_2$ | 561 |
| 1814 |  | -H | 470 |

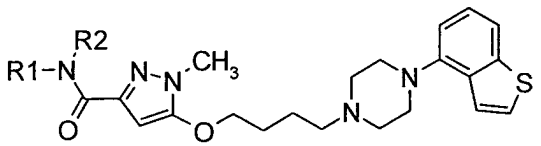
[Tabela 196]

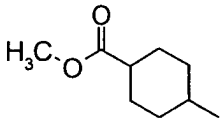
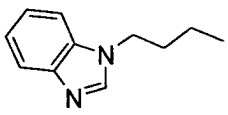
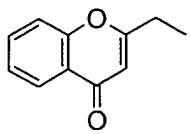


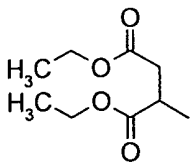
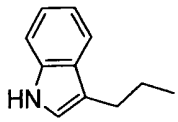
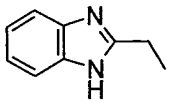
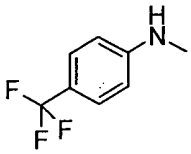
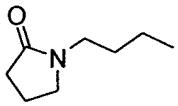
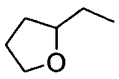
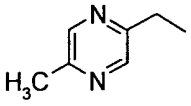
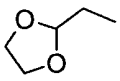
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1815 |  | -$CH_3$ | 633 |
| 1816 |  | -$CH_3$ | 629 |
| 1817 |  | -$CH_3$ | 629 |
| 1818 |  | -$CH_3$ | 629 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1819 |  | -$CH_3$ | 649 |
| 1820 |  | -$C_4H_9$ | 649 |
| 1821 |  | -$C_4H_9$ | 671 |
| 1822 |  | -$CH(CH_3)_2$ | 657 |
| 1823 |  | -H | 597 |
| 1824 |  | -H | 583 |
| 1825 |  | -$C_2H_5$ | 587 |

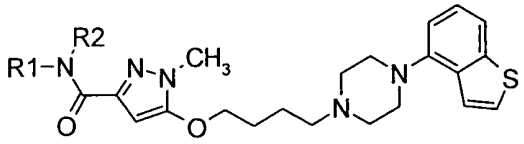
[Tabela 197]

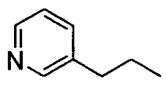
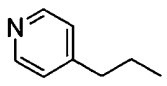
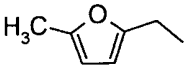


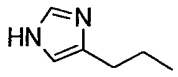
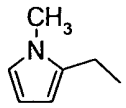
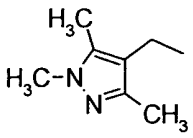
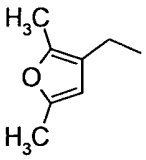
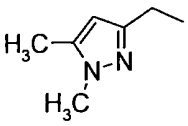
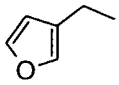
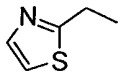
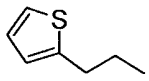
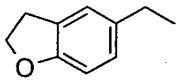
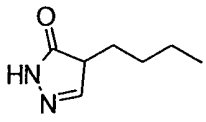
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1826 |  | -H | 554 |
| 1827 |  | -H | 572 |
| 1828 |  | -H | 572 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1829 |  | -H | 586 |
| 1830 |  | -H | 557 |
| 1831 |  | -H | 544 |
| 1832 |  | -H | 573 |
| 1833 |  | -H | 539 |
| 1834 |  | -H | 498 |
| 1835 |  | -H | 520 |
| 1836 |  | -H | 500 |

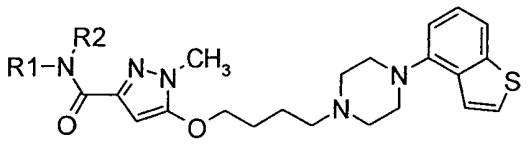
[Tabela 198]

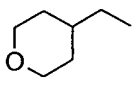


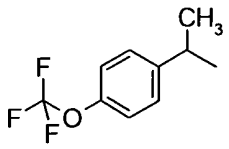
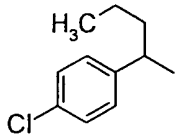
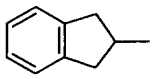
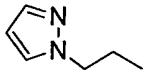
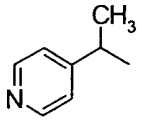
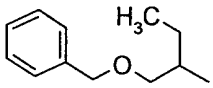
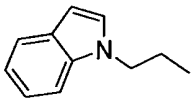
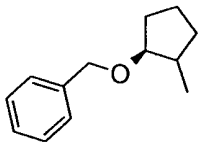
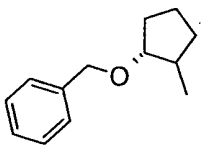
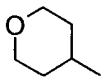
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1837 |  | -H | 519 |
| 1838 |  | -H | 519 |
| 1839 |  | -H | 508 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1840 |  | -H | 508 |
| 1841 |  | -H | 507 |
| 1842 |  | -H | 536 |
| 1843 |  | -H | 522 |
| 1844 |  | -H | 522 |
| 1845 |  | -H | 494 |
| 1846 |  | -H | 511 |
| 1847 |  | -H | 524 |
| 1848 |  | -H | 546 |
| 1849 |  | -H | 538 |

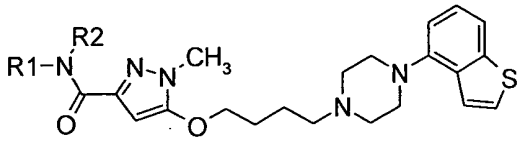
[Tabela 199]

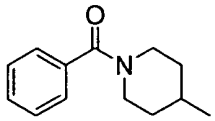
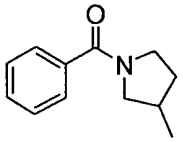
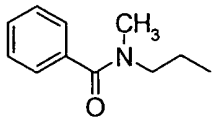
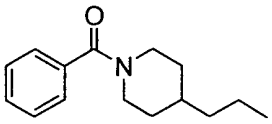
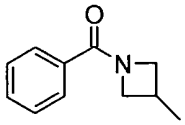
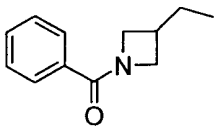
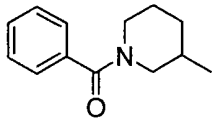
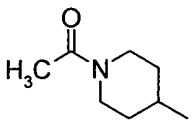
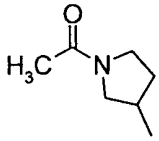


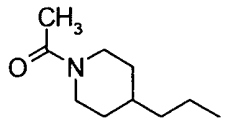
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1850 |  | -H | 512 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1851 |  | -H | 602 |
| 1852 |  | $-CH_3$ | 594 |
| 1853 |  | -H | 530 |
| 1854 |  | -H | 508 |
| 1855 |  | -H | 519 |
| 1856 |  | -H | 576 |
| 1857 |  | -H | 557 |
| 1858 |  | -H | 588 |
| 1859 |  | -H | 588 |
| 1860 |  | -H | 498 |

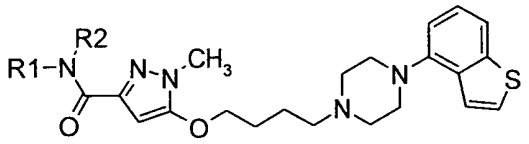
[Tabela 200]

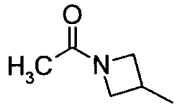
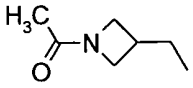
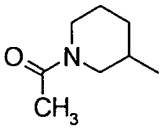
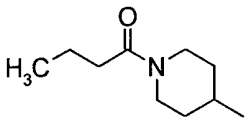
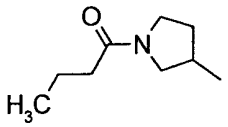
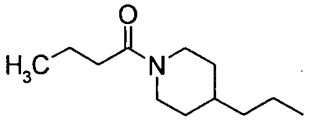
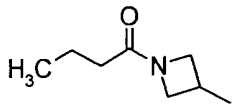
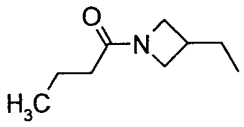
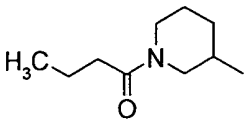


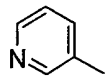
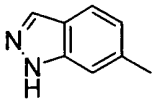
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1861 |  | -H | 601 |
| 1862 |  | -H | 587 |
| 1863 |  | -H | 575 |
| 1864 |  | -H | 629 |
| 1865 |  | -H | 573 |
| 1866 |  | -H | 587 |
| 1867 |  | -H | 601 |
| 1868 |  | -H | 539 |
| 1869 |  | -H | 525 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1870 |  | -H | 567 |

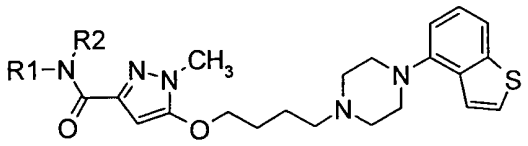
[Tabela 201]

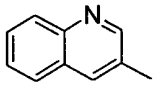
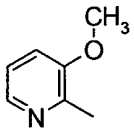
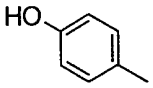
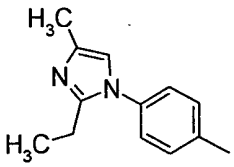
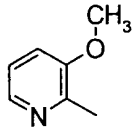
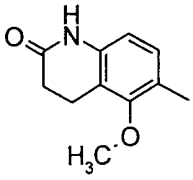
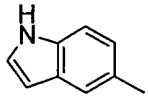
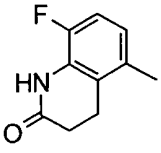


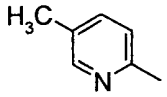
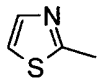
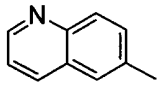
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1871 |  | -H | 511 |
| 1872 |  | -H | 525 |
| 1873 |  | -H | 539 |
| 1874 |  | -H | 567 |
| 1875 |  | -H | 553 |
| 1876 |  | -H | 595 |
| 1877 |  | -H | 539 |
| 1878 |  | -H | 553 |
| 1879 |  | -H | 567 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1880 |  | -H | 491 |
| 1881 |  | -H | 530 |

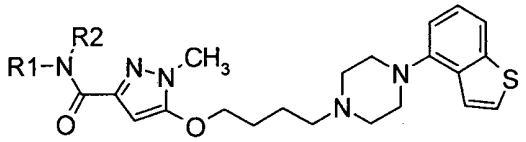
[Tabela 202]

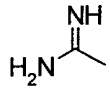
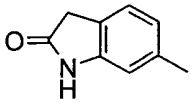
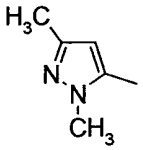
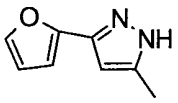
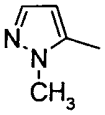
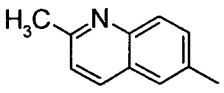


| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1882 |  | -H | 541 |
| 1883 |  | -H | 505 |
| 1884 |  | -$CH_3$ | 520 |
| 1885 |  | -$CH_3$ | 612 |
| 1886 |  | -H | 521 |
| 1887 |  | -H | 589 |
| 1888 |  | -H | 529 |
| 1889 |  | -H | 577 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1890 |  | -H | 505 |
| 1891 |  | -H | 497 |
| 1892 |  | -H | 541 |

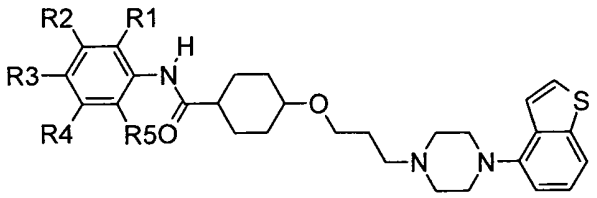
[Tabela 203]



| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1893 |  | -H | 456 |
| 1894 |  | -H | 545 |
| 1895 |  | -H | 508 |
| 1896 |  | -H | 546 |
| 1897 |  | -H | 494 |
| 1898 |  | -H | 555 |

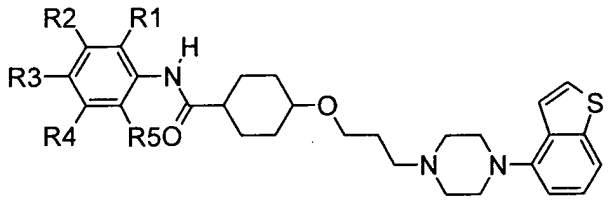
5

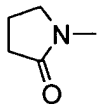
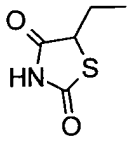
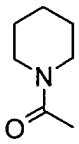
[Tabela 204]



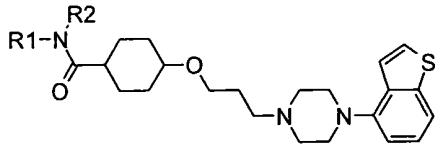

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1899 | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | 562 |
| 1900 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 508 |
| 1901 | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 508 |
| 1902 | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 538 |
| 1903 | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | 538 |
| 1904 | -H | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | -H | 538 |
| 1905 | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | 565 |
| 1906 | -H | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | 538 |
| 1907 | -H | -H | $-N(CH_3)_2$ | -H | -H | 521 |
| 1908 | -H | $-COCH_3$ | -H | -H | -H | 520 |
| 1909 | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | -H | 535 |
| 1910 | -H | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | 535 |
| 1911 | -H | -H | -H | -CN | -H | 503 |
| 1912 | -H | $-CO_2CH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | 566 |
| 1913 | -H | -H | $-OC_6H_5$ | -H | -H | 570 |
| 1914 | -H | $-CO_2CH_3$ | -H | $-CO_2CH_3$ | -H | 594 |
| 1915 | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 538 |
| 1916 | -H | -Cl | -OH | -H | -H | 528 |
| 1917 | $-CO_2C_2H_5$ | -H | -H | -H | -Cl | 584 |
| 1918 | -H | -H | -CN | -H | -H | 503 |
| 1919 | -H | $-OCH_2C_6H_5$ | -H | -H | -H | 584 |
| 1920 | -H | -H | $-NHSO_2CH_3$ | -H | -H | 571 |
| 1921 | -H | -H | $-CONHC_6H_5$ | -H | -H | 597 |
| 1922 | -H | -H | $-CONHCH_3$ | -H | -H | 535 |
| 1923 | -H | -H | $-NHC_6H_5$ | -H | -H | 569 |
| 1924 | -H | -H | $-CH_2CH_2OH$ | -H | -H | 522 |
| 1925 | -H | -H | $-C\equiv CH$ | -H | -H | 502 |
| 1926 | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | -H | -H | 535 |
| 1927 | -H | $-CONHCH_3$ | -H | -H | -H | 535 |

[Tabela 205]



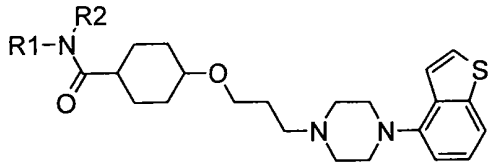
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|
| 1928 | -H | -H |  | -H | -H | 561 |
| 1929 | -H | -H |  | -H | -H | 607 |
| 1930 | -H |  | -H | -H | -H | 589 |
| 1931 | -H |  | -H | -H | -H | 545 |

[Tabela 206]



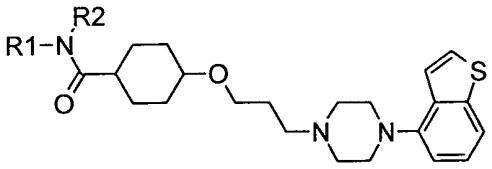
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1932 | $-CH_3$ | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 498 |
| 1933 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | -H | 484 |
| 1934 | $-C_4H_9$ | $-C_4H_9$ | 514 |
| 1935 | $-CH_2CH(CH_3)_2$ | $-CH_2CH(CH_3)_2$ | 514 |
| 1936 | $-CH_2CH_2OH$ | $-CH_2CH_2OH$ | 490 |
| 1937 | $-C_2H_5$ | $-CH_2CH_2OH$ | 474 |
| 1938 | $-CH_2CH_2OH$ | -cyclo-$C_6H_{11}$ | 528 |
| 1939 | $-CH_2CH_2OCH_3$ | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 518 |
| 1940 | $-C_3H_7$ | $-CH_2$-ciclo-$C_3H_5$ | 498 |
| 1941 | -ciclo-$C_5H_9$ | $-CH_2CH=CH_2$ | 510 |
| 1942 | $-C_2H_5$ | $-C_2H_5$ | 458 |
| 1943 | $-C_4H_9$ | -H | 458 |
| 1944 | $-C(CH_3)_3$ | -H | 458 |
| 1945 | -ciclo-$C_3H_5$ | -H | 442 |
| 1946 | $-C_2H_5$ | -H | 430 |
| 1947 | $-CH_2CH_2OCH_3$ | -H | 460 |
| 1948 | $-C_4H_9$ | $-C_2H_5$ | 486 |
| 1949 | $-CH_2CH_2OC_2H_5$ | -H | 474 |
| 1950 | $-(CH_2)_3OC_2H_5$ | -H | 488 |
| 1951 | -ciclo-$C_5H_9$ | -H | 470 |
| 1952 | $-CH_2$-ciclo-$C_3H_5$ | -H | 456 |
| 1953 | $-CH_2$-ciclo-$C_6H_{11}$ | -H | 498 |
| 1954 | $-(CH_2)_2NHCOCH_3$ | -H | 487 |
| 1955 | $-(CH_2)_5OH$ | -H | 488 |
| 1956 | $-CH_2CONH_2$ | -H | 459 |
| 1957 | $-CH_2C\equiv CH$ | -H | 440 |
| 1958 | $-CH_3$ | $-CH(CH_3)_2$ | 458 |
| 1959 | $-(CH_2)_2CH(CH_3)_2$ | -H | 472 |
| 1960 | $-CH(CH_3)C(CH_3)_3$ | -H | 486 |
| 1961 | $-CH_2C(CH_3)_3$ | -H | 472 |
| 1962 | $-CH_2CH(C_2H_5)_2$ | -H | 486 |
| 1963 | $-CH(CONH_2)_2$ | -H | 502 |
| 1964 | $-CH_2$-ciclo-$C_3H_5$ | $-CH_3$ | 470 |
| 1965 | $-CH(CONH_2)_2$ | -H | 499 |

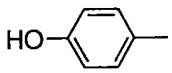
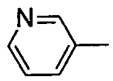
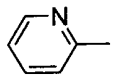
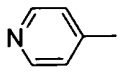
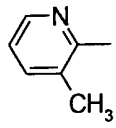
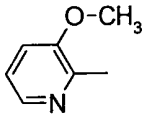
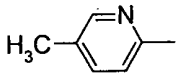
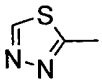
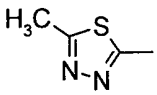
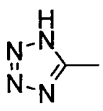
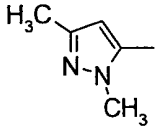
[Tabela 207]

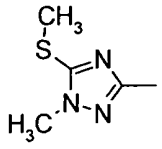


| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1966 | $-CH_3$ | $-CH_3$ | 430 |
| 1967 | $-(CH_2)_3OCH(CH_3)_2$ | -H | 502 |
| 1968 | $-CH_2CH_2C(CH_3)_3$ | -H | 486 |
| 1969 | $-CH(C_2H_5)_2$ | -H | 472 |
| 1970 | $-CH_2CN$ | -H | 441 |
| 1971 | $-(CH_2)_3OCH_3$ | -H | 474 |
| 1972 | $-(CH_2)_2OCH(CH_3)_2$ | -H | 488 |
| 1973 | $-CH(C_2H_5)CH_2OCH_3$ | -H | 488 |
| 1974 | $-CH(CH_3)CH_2OCH_3$ | -H | 474 |
| 1975 | $-CH_2CH_2F$ | -H | 448 |
| 1976 | $-CH_2CH(OH)CH_2OH$ | -H | 476 |
| 1977 | $-CH_2CONHCH_3$ | -H | 473 |
| 1978 | $-(CH_2)_2SCH_3$ | -H | 476 |
| 1979 | $-CH_2CH_2OH$ | -H | 446 |
| 1980 | $-CH_2CHF_2$ | -H | 466 |
| 1981 | $-C_6H_{13}$ | -H | 486 |
| 1982 | $-CH_2CH_2NHCONH_2$ | -H | 488 |

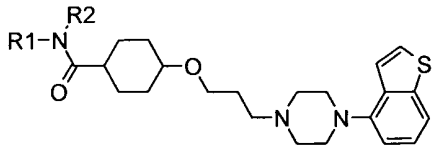
[Table 208]

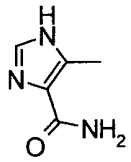
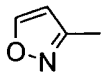
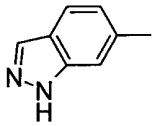
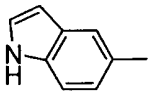
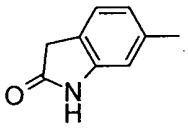
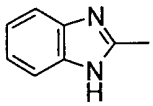
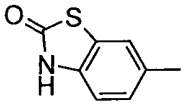
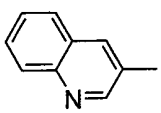
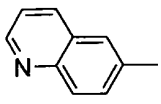


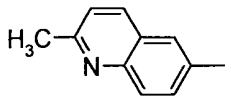
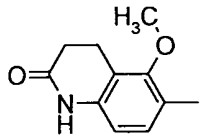
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1983 |  | -$CH_3$ | 508 |
| 1984 |  | -H | 479 |
| 1985 |  | -H | 479 |
| 1986 |  | -H | 479 |
| 1987 |  | -H | 493 |
| 1988 |  | -H | 509 |
| 1989 |  | -H | 493 |
| 1990 |  | -H | 485 |
| 1991 |  | -H | 486 |
| 1992 |  | -H | 500 |
| 1993 |  | -H | 470 |
| 1994 |  | -H | 496 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 1995 |  | -H | 529 |

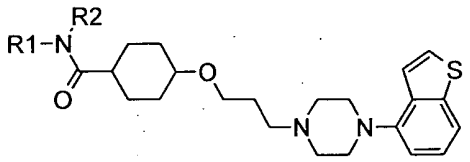
[Tabela 209]

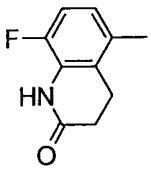
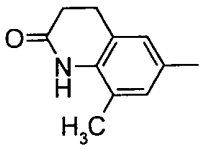
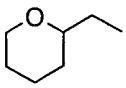
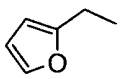
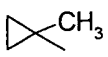
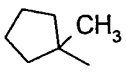
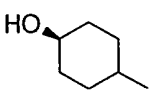
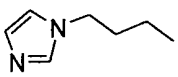


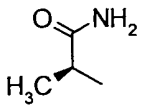
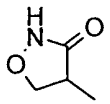
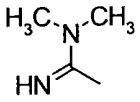
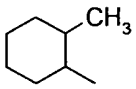
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 1996 |  | -H | 511 |
| 1997 |  | -H | 469 |
| 1998 |  | -H | 518 |
| 1999 |  | -H | 517 |
| 2000 |  | -H | 533 |
| 2001 |  | -H | 518 |
| 2002 |  | -H | 551 |
| 2003 |  | -H | 529 |
| 2004 |  | -H | 529 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 2005 |  | -H | 543 |
| 2006 |  | -H | 577 |

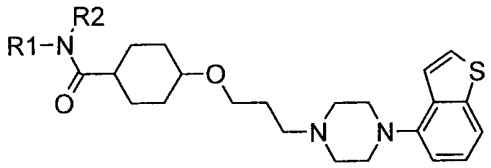
[Tabela 210]

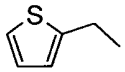
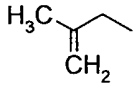
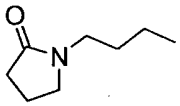
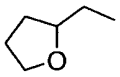
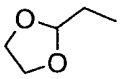
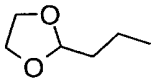
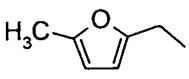
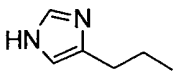


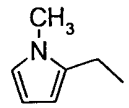
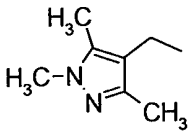
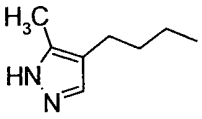
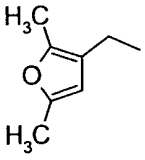
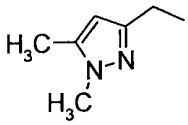
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2007 |  | -H | 565 |
| 2008 |  | -H | 561 |
| 2009 |  | -H | 444 |
| 2010 |  | $-C_2H_5$ | 528 |
| 2011 |  | -H | 482 |
| 2012 |  | -H | 456 |
| 2013 |  | -H | 484 |
| 2014 |  | -H | 500 |
| 2015 |  | -H | 510 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 2016 |  | -H | 473 |
| 2017 |  | -H | 487 |
| 2018 |  | -H | 472 |
| 2019 |  | -H | 498 |

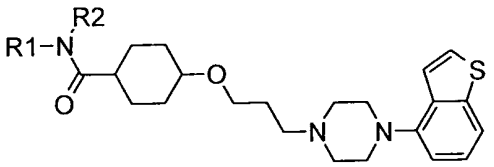
[Tabela 211]

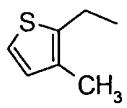
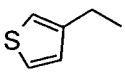
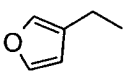
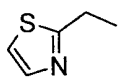
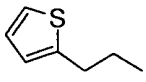


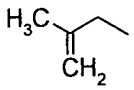
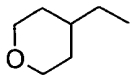
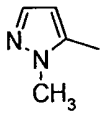
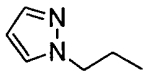
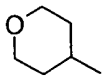
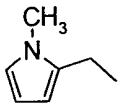
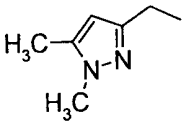
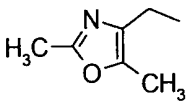
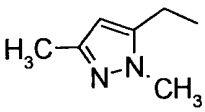
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2020 |  | -H | 498 |
| 2021 |  | $-C_2H_5$ | 484 |
| 2022 |  | -H | 527 |
| 2023 |  | -H | 486 |
| 2024 |  | -H | 488 |
| 2025 |  | -H | 502 |
| 2026 |  | -H | 496 |
| 2027 |  | -H | 496 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 2028 |  | -H | 495 |
| 2029 |  | -H | 524 |
| 2030 |  | -H | 524 |
| 2031 |  | -H | 510 |
| 2032 |  | -H | 510 |

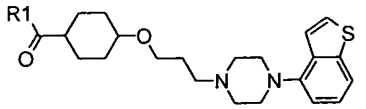
[Tabela 212]

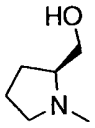
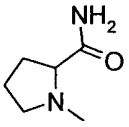
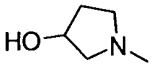
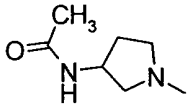
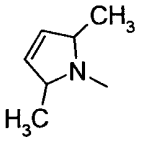
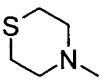
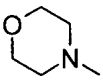
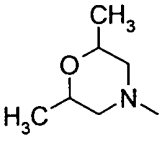
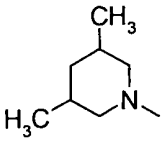


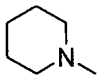
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2033 |  | -H | 512 |
| 2034 |  | -H | 498 |
| 2035 |  | -H | 482 |
| 2036 |  | -H | 499 |
| 2037 |  | -H | 512 |

| | | | |
|---|---|---|---|
| 2038 |  | -H | 456 |
| 2039 |  | -H | 500 |
| 2040 |  | -H | 482 |
| 2041 |  | -H | 496 |
| 2042 |  | -H | 486 |
| 2043 |  | -$CH_3$ | 510 |
| 2044 |  | -$CH_3$ | 524 |
| 2045 |  | -$CH_3$ | 525 |
| 2046 |  | -H | 510 |

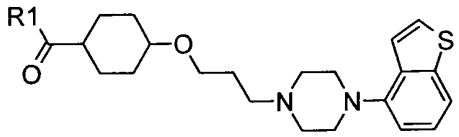
[Tabela 213]

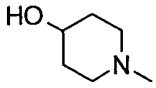
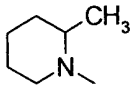
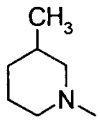
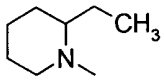
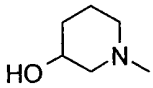
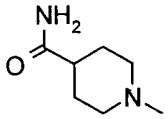
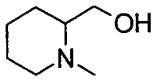
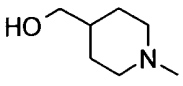
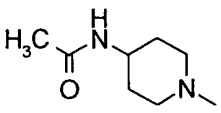
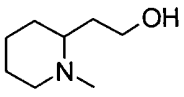


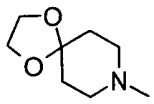
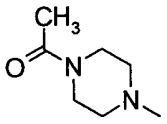
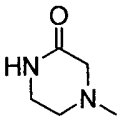
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2047 |  | 456 |
| 2048 |  | 486 |
| 2049 |  | 499 |
| 2050 |  | 472 |
| 2051 |  | 513 |
| 2052 |  | 482 |
| 2053 |  | 474 |
| 2054 |  | 488 |
| 2055 |  | 472 |
| 2056 |  | 500 |
| 2057 |  | 498 |

| | | |
|---|---|---|
| 2058 |  | 470 |

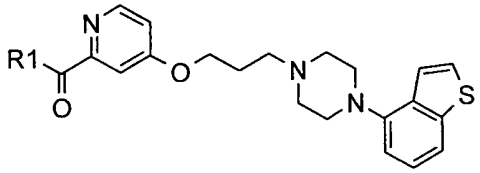
[Tabela 214]

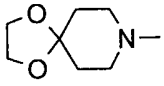
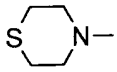
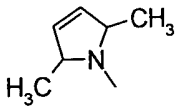
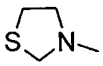
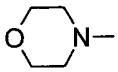
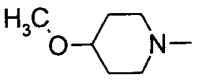
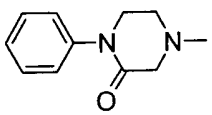
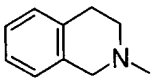


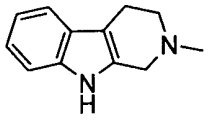
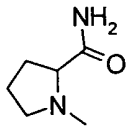
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2059 |  | 486 |
| 2060 |  | 484 |
| 2061 |  | 484 |
| 2062 |  | 498 |
| 2063 |  | 486 |
| 2064 |  | 513 |
| 2065 |  | 500 |
| 2066 |  | 500 |
| 2067 |  | 527 |
| 2068 |  | 514 |

| | | |
|---|---|---|
| 2069 |  | 528 |
| 2070 |  | 513 |
| 2071 |  | 485 |

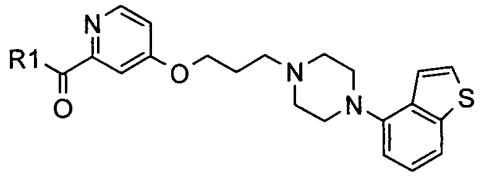
[Tabela 215]

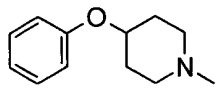
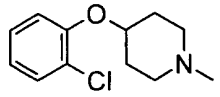
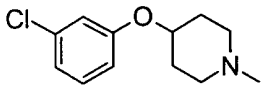
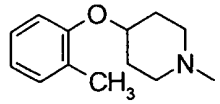
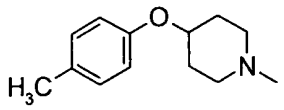
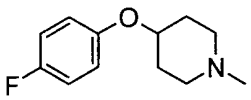
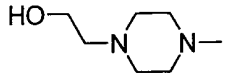
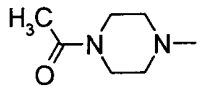
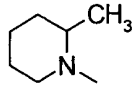
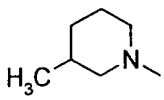


| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2072 |  | 523 |
| 2073 |  | 483 |
| 2074 |  | 477 |
| 2075 |  | 469 |
| 2076 |  | 467 |
| 2077 |  | 495 |
| 2078 |  | 556 |
| 2079 |  | 513 |

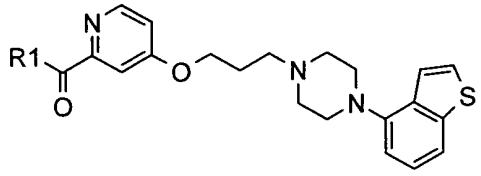
| | | |
|---|---|---|
| 2080 |  | 552 |
| 2081 |  | 494 |

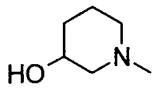
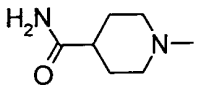
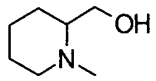
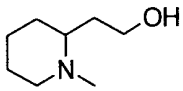
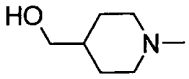
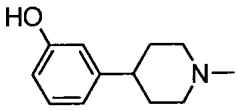
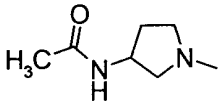
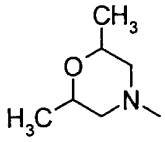
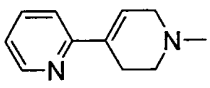
[Tabela 216]



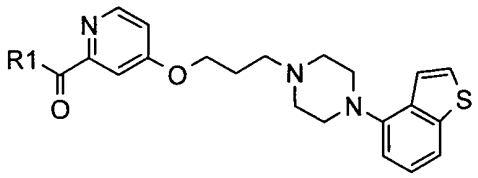
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2082 |  | 557 |
| 2083 |  | 591 |
| 2084 |  | 591 |
| 2085 |  | 571 |
| 2086 |  | 571 |
| 2087 |  | 575 |
| 2088 |  | 510 |
| 2089 |  | 508 |
| 2090 |  | 479 |
| 2091 |  | 479 |

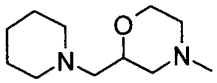
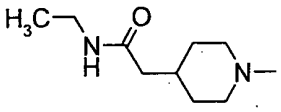
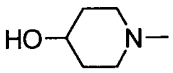
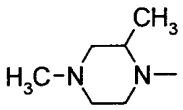
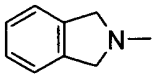
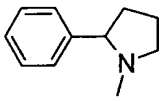
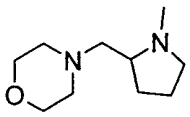
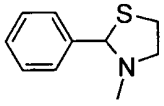
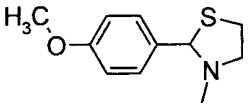
[Tabela 217]



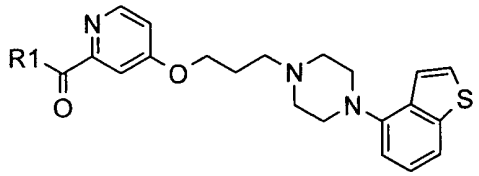
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2092 |  | 481 |
| 2093 |  | 508 |
| 2094 |  | 495 |
| 2095 |  | 509 |
| 2096 |  | 495 |
| 2097 |  | 557 |
| 2098 |  | 508 |
| 2099 |  | 495 |
| 2100 |  | 540 |

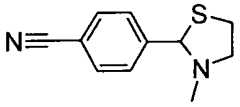
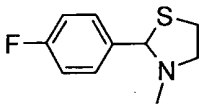
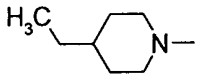
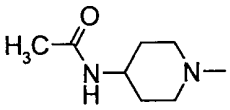
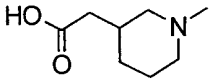
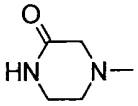
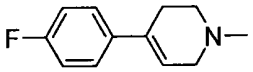
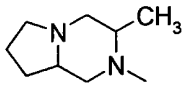
[Tabela 218]



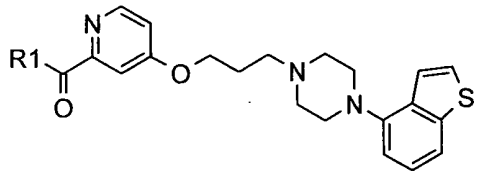
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2101 |  | 564 |
| 2102 |  | 550 |
| 2103 |  | 481 |
| 2104 |  | 494 |
| 2105 |  | 499 |
| 2106 |  | 527 |
| 2107 |  | 550 |
| 2108 |  | 545 |
| 2109 |  | 575 |

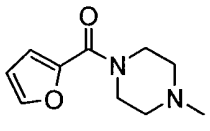
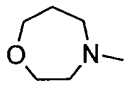
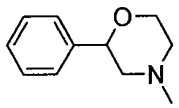
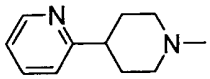
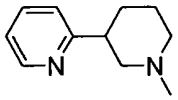
[Tabela 219]



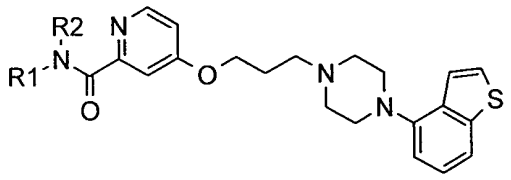
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2110 |  | 570 |
| 2111 |  | 563 |
| 2112 |  | 493 |
| 2113 |  | 522 |
| 2114 |  | 523 |
| 2115 |  | 480 |
| 2116 |  | 557 |
| 2117 |  | 520 |
| 2118 |  | 533 |

[Tabela 220]



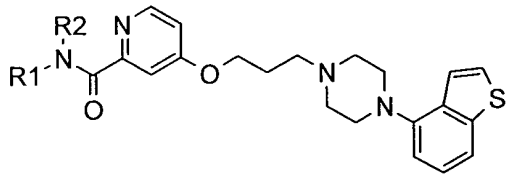
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2119 |  | 560 |
| 2120 |  | 481 |
| 2121 |  | 543 |
| 2122 |  | 542 |
| 2123 |  | 542 |

[Tabela 221]



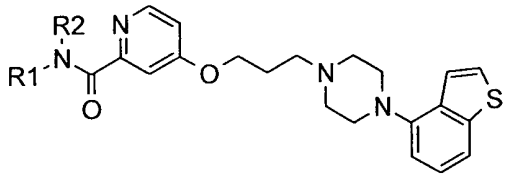
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2124 | $-CH_3$ | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 493 |
| 2125 | -H | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 479 |
| 2126 | $-CH_2CH_2OH$ | $-CH_2CH_2OH$ | 485 |
| 2127 | $-CH_3$ | $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | 482 |
| 2128 | -H | $-C_4H_9$ | 453 |
| 2129 | -H | -ciclo-$C_3H_5$ | 437 |
| 2130 | -H | $-CH_2C_6H_5$ | 487 |
| 2131 | $-CH_3$ | $-CH_2C_6H_5$ | 501 |
| 2132 | $-C_2H_5$ | $-CH(CH_3)_2$ | 467 |
| 2133 | -H | $-CH_3$ | 411 |
| 2134 | -H | $-C_2H_5$ | 425 |
| 2135 | -H | $-C_3H_7$ | 439 |
| 2136 | -H | $-CH_2CH(CH_3)_2$ | 453 |
| 2137 | -H | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 455 |
| 2138 | -H | $-CH_2CH_2OC_2H_5$ | 469 |
| 2139 | -H | $-(CH_2)_2OC_6H_5$ | 517 |
| 2140 | -H | -ciclo-$C_5H_9$ | 465 |
| 2141 | -H | $-CH_2$-ciclo-$C_6H_{11}$ | 493 |
| 2142 | -H | $-CH(CH_3)C_6H_5$ | 501 |
| 2143 | -H | $-CH_2CONH_2$ | 454 |

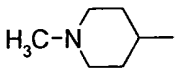
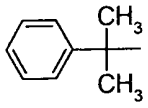
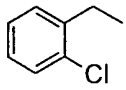
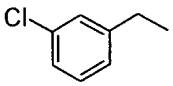
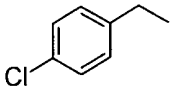
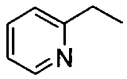
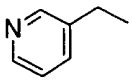
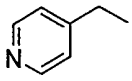
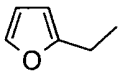
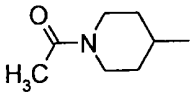
[Tabela 222]



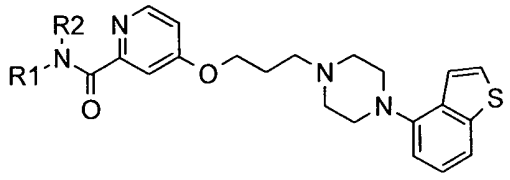
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2144 | -H | $-CH(CH_3)_2$ | 439 |
| 2145 | $-C_2H_5$ | $-C_2H_5$ | 453 |
| 2146 | -H | $-(CH_2)_5OH$ | 483 |
| 2147 | -H | $-CH_2CCH$ | 435 |
| 2148 | $-CH_3$ | $-CH(CH_3)_2$ | 453 |
| 2149 | -H | $-CH_2C(CH_3)_3$ | 467 |
| 2150 | -H | $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | 468 |
| 2151 | -H | $-CH(CONH_2)_2$ | 497 |
| 2152 | $-CH_3$ | $-CH_2$-ciclo-$C_3H_5$ | 465 |
| 2153 | $-CH_3$ | $-(CH_2)_2N(C_2H_5)_2$ | 510 |
| 2154 | -H | $-CH_2CF_3$ | 479 |
| 2155 | -H | $-NHCH_2CF_3$ | 494 |
| 2156 | $-CH_3$ | $-CH_3$ | 425 |
| 2157 | -H | $-CH_2CH(OCH_3)_2$ | 485 |
| 2158 | -H | $-(CH_2)_3OCH(CH_3)_2$ | 497 |
| 2159 | -H | $-CH(C_2H_5)_2$ | 467 |
| 2160 | -H | $-CH_2CN$ | 436 |
| 2161 | -H | $-(CH_2)_2OCH(CH_3)_2$ | 483 |
| 2162 | -H | $-CH(C_2H_5)CH_2OCH_3$ | 483 |
| 2163 | -H | $-CH_2CH_2F$ | 443 |
| 2164 | -H | $-CH_2CONHCH_3$ | 468 |
| 2165 | -H | $-(CH_2)_2SCH_3$ | 471 |
| 2166 | -H | $-CH_2CHF_2$ | 461 |
| 2167 | $-CH_3$ | $-(CH_2)_2O(CH_2)_2NHCH_3$ | 512 |

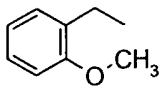
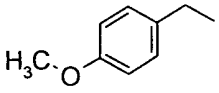
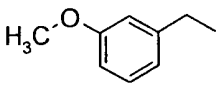
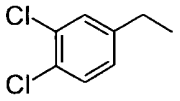
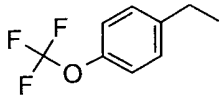
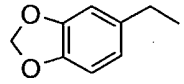
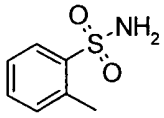
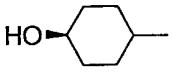
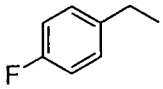
[Tabela 223]



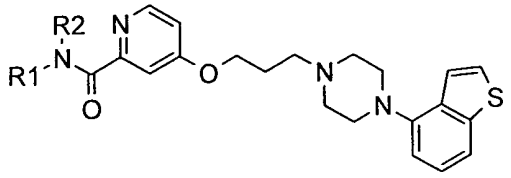
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2168 | -$CH_3$ |  | 508 |
| 2169 | -H |  | 515 |
| 2170 | -H |  | 521 |
| 2171 | -H |  | 521 |
| 2172 | -H |  | 521 |
| 2173 | -H |  | 488 |
| 2174 | -H |  | 488 |
| 2175 | -H |  | 488 |
| 2176 | -H |  | 477 |
| 2177 | -$CH_3$ |  | 536 |

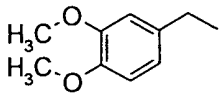
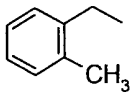
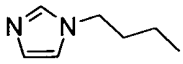
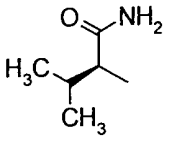
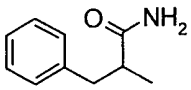
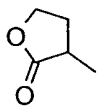
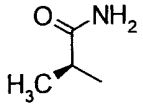
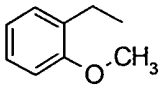
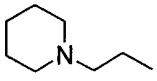
[Tabela 224]



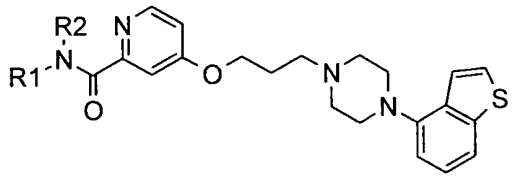
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2178 | -$CH_3$ |  | 531 |
| 2179 | -H |  | 451 |
| 2180 | -H |  | 517 |
| 2181 | -H |  | 517 |
| 2182 | -H |  | 555 |
| 2183 | -H |  | 571 |
| 2184 | -H |  | 531 |
| 2185 | -H |  | 552 |
| 2186 | -H |  | 495 |
| 2187 | -H |  | 505 |

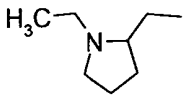
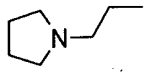
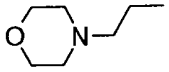
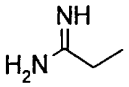
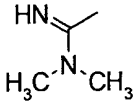
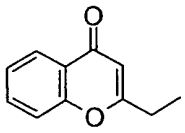
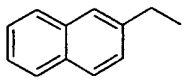
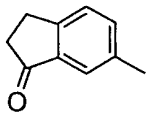
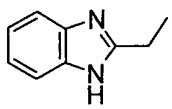
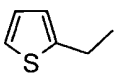
[Tabela 225]



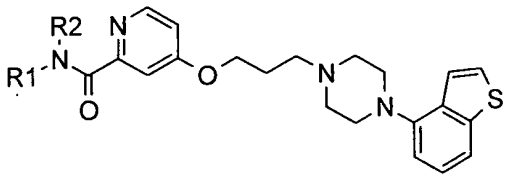
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2188 | -H |  | 547 |
| 2189 | -H |  | 501 |
| 2190 | -H |  | 505 |
| 2191 | -H |  | 496 |
| 2192 | -H |  | 544 |
| 2193 | -H |  | 481 |
| 2194 | -H |  | 468 |
| 2195 | -H |  | 517 |
| 2196 | -H |  | 508 |

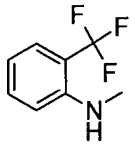
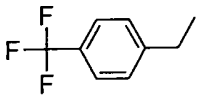
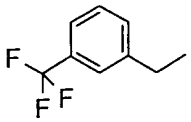
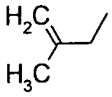
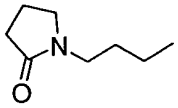
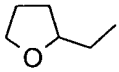
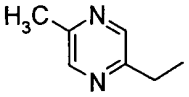
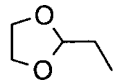
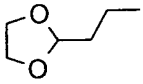
[Tabela 226]



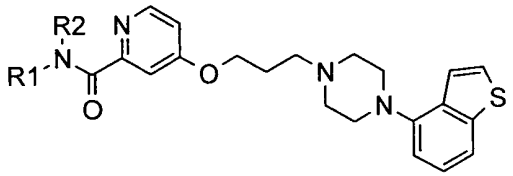
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2197 | -H |  | 508 |
| 2198 | -H |  | 494 |
| 2199 | -H |  | 510 |
| 2200 | -H |  | 453 |
| 2201 | -H |  | 467 |
| 2202 | -H |  | 555 |
| 2203 | -H |  | 537 |
| 2204 | -H |  | 527 |
| 2205 | -H |  | 527 |
| 2206 | -H |  | 493 |

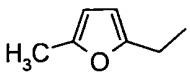
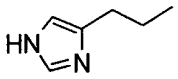
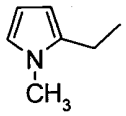
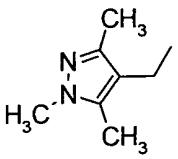
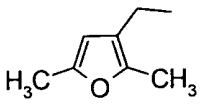
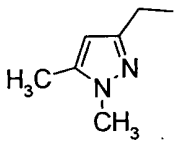
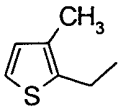
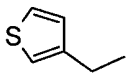
[Tabela 227]



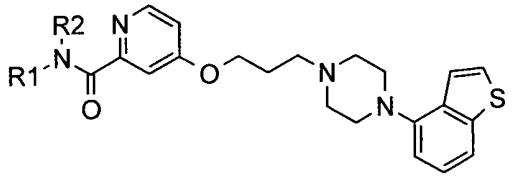
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2207 | -H |  | 556 |
| 2208 | -H |  | 555 |
| 2209 | -H |  | 555 |
| 2210 | $-C_2H_5$ |  | 479 |
| 2211 | -H |  | 522 |
| 2212 | -H |  | 481 |
| 2213 | -H |  | 503 |
| 2214 | -H |  | 483 |
| 2215 | -H |  | 497 |

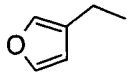
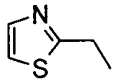
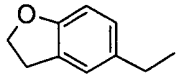
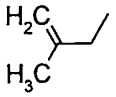
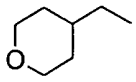
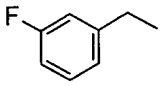
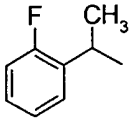
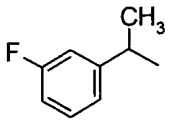
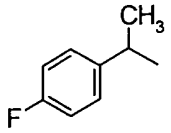
[Tabela 228]



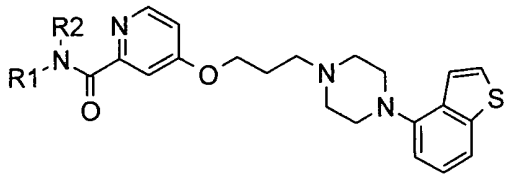
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2216 | -H |  | 491 |
| 2217 | -H |  | 491 |
| 2218 | -H |  | 490 |
| 2219 | -H |  | 519 |
| 2220 | -H |  | 505 |
| 2221 | -H |  | 505 |
| 2222 | -H |  | 507 |
| 2223 | -H |  | 493 |

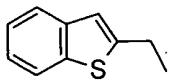
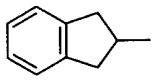
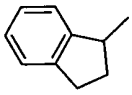
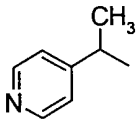
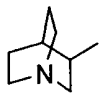
[Tabela 229]



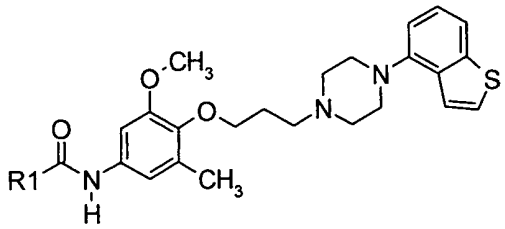
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2224 | -H |  | 477 |
| 2225 | -H |  | 494 |
| 2226 | -H |  | 529 |
| 2227 | -H |  | 451 |
| 2228 | -H |  | 495 |
| 2229 | -H |  | 505 |
| 2230 | -H |  | 519 |
| 2231 | -H |  | 519 |
| 2232 | -H |  | 519 |

[Tabela 230]



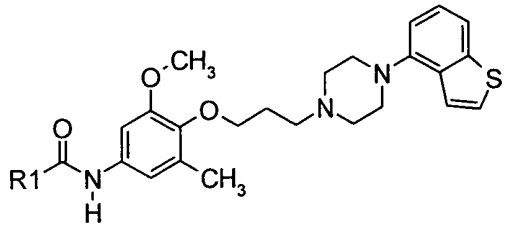
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2233 | -H |  | 537 |
| 2234 | -H |  | 543 |
| 2235 | -H |  | 513 |
| 2236 | -H |  | 513 |
| 2237 | -H |  | 502 |
| 2238 | -H |  | 506 |

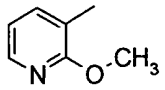
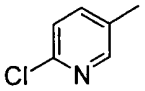
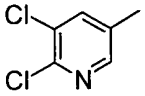
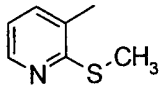
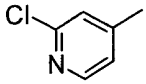
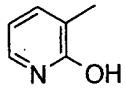
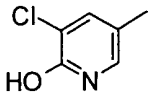
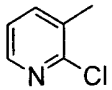
[Tabela 231]



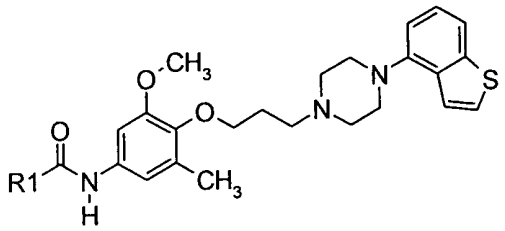
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2239 | -2-PYRIDYL | 517 |
| 2240 | -3-PYRIDYL | 517 |
| 2241 | -4-PYRIDYL | 517 |
| 2242 | -2-FURYL | 506 |
| 2243 | -2-THIENYL | 522 |
| 2244 | -3-FURYL | 506 |
| 2245 | -3-THIENYL | 522 |
| 2246 | $-CH_3$ | 454 |
| 2247 | $-C_2H_5$ | 468 |
| 2248 | $-C_3H_7$ | 482 |
| 2249 | $-CH(CH_3)_2$ | 482 |
| 2250 | -ciclo-$C_3H_5$ | 480 |
| 2251 | -ciclo-$C_5H_9$ | 508 |
| 2252 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 522 |
| 2253 | $-CH_2$-ciclo-$C_3H_5$ | 494 |
| 2254 | $-CH_2$-ciclo-$C_6H_{11}$ | 536 |
| 2255 | $-CH_2OCH_3$ | 484 |
| 2256 | $-CH_2N(CH_3)_2$ | 497 |
| 2257 | $-(CH_2)_3N(CH_3)_2$ | 525 |
| 2258 | $-(CH_2)_2N(C_2H_5)_2$ | 539 |
| 2259 | $-CH_2NHCHO$ | 497 |
| 2260 | $-CH_2N(CH_2CH_2OH)_2$ | 557 |
| 2261 | $-CH_2N(CH_3)CO_2C(CH_3)_3$ | 583 |
| 2262 | $-(CH_2)_3NHCO_2C(CH_3)_3$ | 597 |
| 2263 | $-CH_2NHCH_3$ | 483 |
| 2264 | $-(CH_2)_3NH_2$ | 497 |
| 2265 | $-CH_2NHCOCH_3$ | 511 |

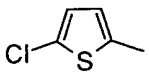
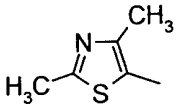
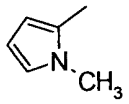
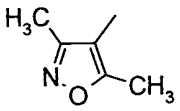
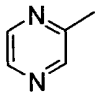
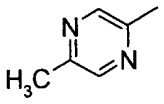
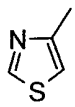
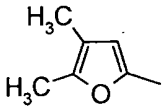
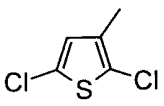
[Tabela 232]



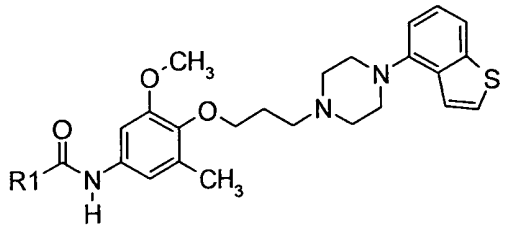
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2266 |  | 547 |
| 2267 |  | 551 |
| 2268 |  | 585 |
| 2269 |  | 563 |
| 2270 |  | 551 |
| 2271 |  | 533 |
| 2272 |  | 567 |
| 2273 |  | 551 |
| 2274 |  | 505 |

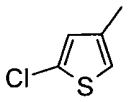
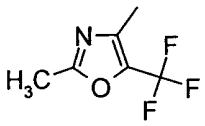
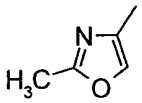
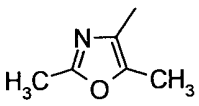
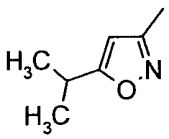
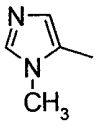
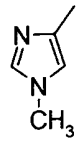
[Tabela 233]



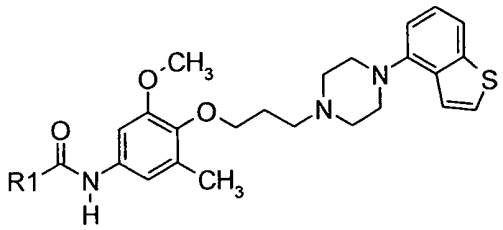
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2275 |  | 556 |
| 2276 |  | 551 |
| 2277 |  | 519 |
| 2278 |  | 535 |
| 2279 |  | 518 |
| 2280 |  | 532 |
| 2281 |  | 523 |
| 2282 |  | 534 |
| 2283 |  | 590 |

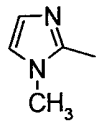
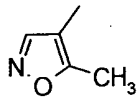
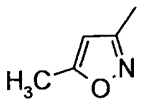
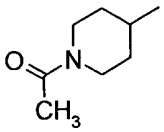
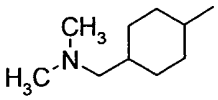
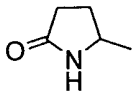
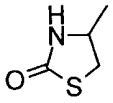
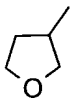
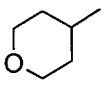
[Tabela 234]



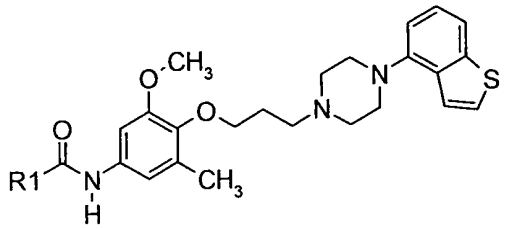
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2284 |  | 556 |
| 2285 |  | 589 |
| 2286 |  | 521 |
| 2287 |  | 523 |
| 2288 |  | 535 |
| 2289 |  | 549 |
| 2290 |  | 520 |
| 2291 |  | 520 |

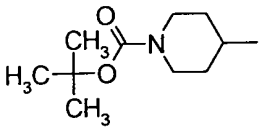
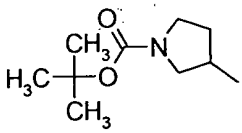
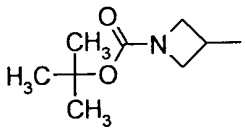
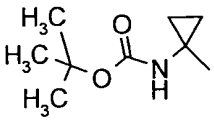
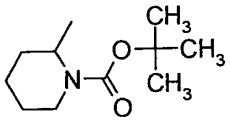
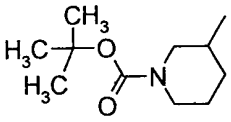
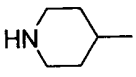
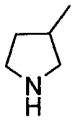
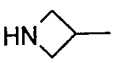
[Tabela 235]



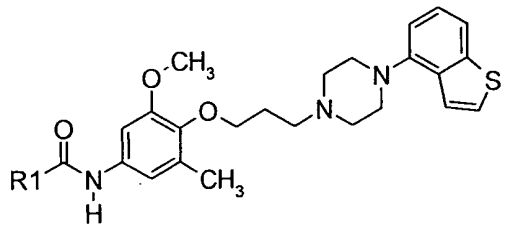
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2292 |  | 520 |
| 2293 |  | 521 |
| 2294 |  | 521 |
| 2295 |  | 565 |
| 2296 |  | 579 |
| 2297 |  | 523 |
| 2298 |  | 541 |
| 2299 |  | 510 |
| 2300 |  | 524 |

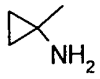
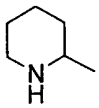
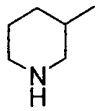
[Tabela 236]



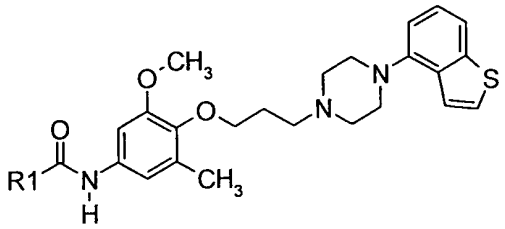
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2301 |  | 623 |
| 2302 |  | 609 |
| 2303 |  | 595 |
| 2304 |  | 595 |
| 2305 |  | 623 |
| 2306 |  | 623 |
| 2307 |  | 523 |
| 2308 |  | 509 |
| 2309 |  | 495 |

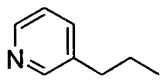
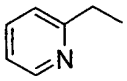
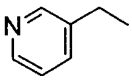
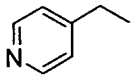
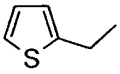
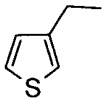
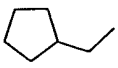
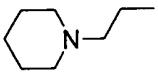
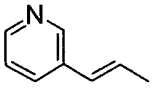
[Tabela 237]



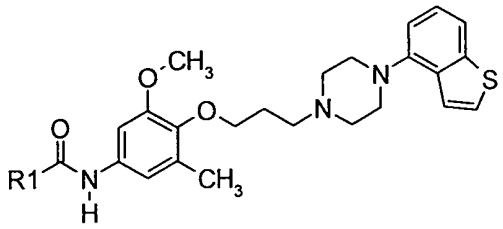
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2310 |  | 495 |
| 2311 |  | 523 |
| 2312 |  | 523 |

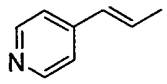
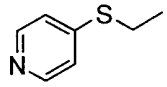
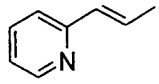
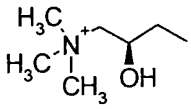
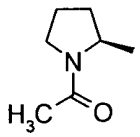
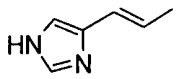
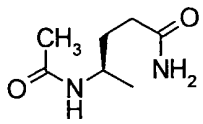
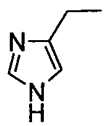
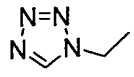
[Tabela 238]



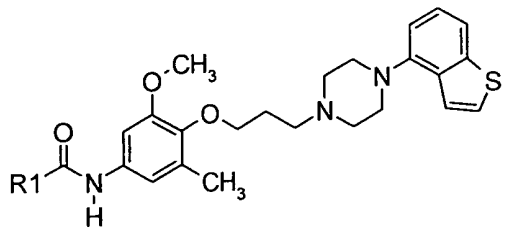
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2313 |  | 545 |
| 2314 |  | 531 |
| 2315 |  | 531 |
| 2316 |  | 531 |
| 2317 |  | 536 |
| 2318 |  | 536 |
| 2319 |  | 522 |
| 2320 |  | 551 |
| 2321 |  | 543 |

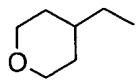
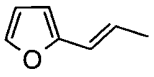
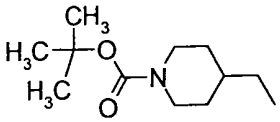
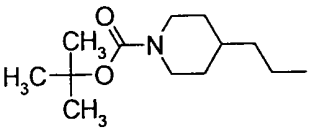
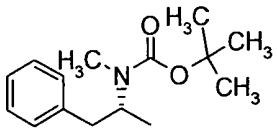
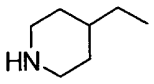
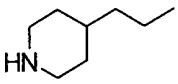
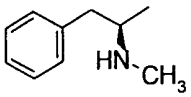
[Tabela 239]



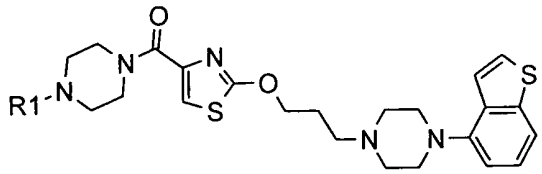
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2322 |  | 543 |
| 2323 |  | 563 |
| 2324 |  | 543 |
| 2325 |  | 556 |
| 2326 |  | 551 |
| 2327 |  | 532 |
| 2328 |  | 582 |
| 2329 |  | 520 |
| 2330 |  | 522 |

[Tabela 240]



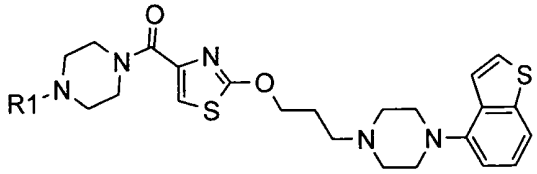
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2331 |  | 538 |
| 2332 |  | 532 |
| 2333 |  | 637 |
| 2334 |  | 651 |
| 2335 |  | 673 |
| 2336 |  | 537 |
| 2337 |  | 551 |
| 2338 |  | 573 |

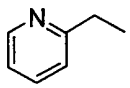
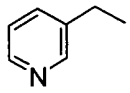
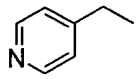
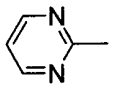
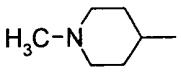
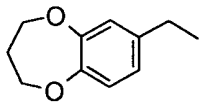
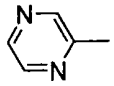
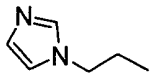
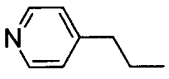
[Tabela 241]



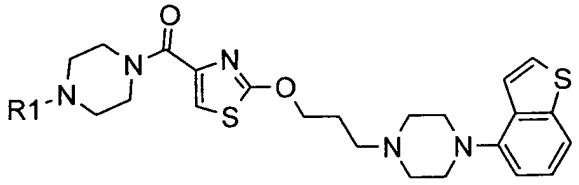
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2339 | -2-PYRIDYL | 549 |
| 2340 | $-C_4H_9$ | 528 |
| 2341 | $-CH(CH_3)_2$ | 514 |
| 2342 | $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | 543 |
| 2343 | -4-PYRIDYL | 549 |
| 2344 | $-C_6H_5$ | 548 |
| 2345 | $-C_3H_7$ | 514 |
| 2346 | $-CH_3$ | 486 |
| 2347 | -3-PYRIDYL | 549 |
| 2348 | $-C_6H_{13}$ | 556 |
| 2349 | $-C_2H_5$ | 500 |
| 2350 | $-CH_2CH_2OH$ | 516 |
| 2351 | $-COCH_3$ | 514 |
| 2352 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 554 |
| 2353 | $-SO_2C_2H_5$ | 564 |

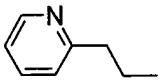
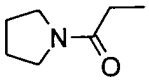
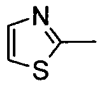
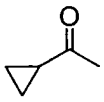
[Tabela 242]



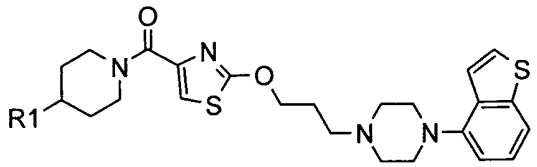
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2354 |  | 563 |
| 2355 |  | 563 |
| 2356 |  | 563 |
| 2357 |  | 550 |
| 2358 |  | 569 |
| 2359 |  | 634 |
| 2360 |  | 550 |
| 2361 |  | 566 |
| 2362 |  | 577 |

[Tabela 243]



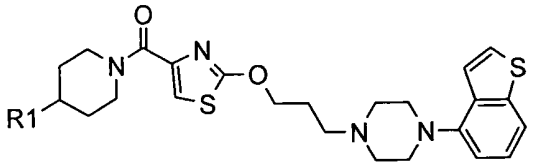
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2363 |  | 577 |
| 2364 |  | 583 |
| 2365 |  | 555 |
| 2366 |  | 540 |

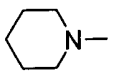
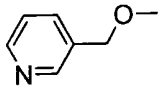
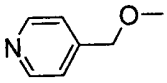
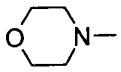
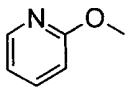
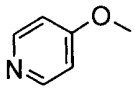
[Tabela 244]



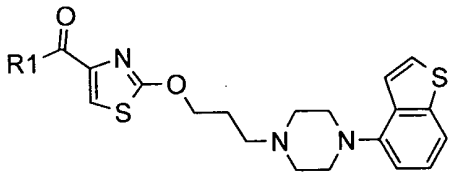
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2367 | -$OCH_3$ | 501 |
| 2368 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 553 |
| 2369 | -$C_6H_5$ | 547 |
| 2370 | -$OCH_2C_6H_5$ | 577 |
| 2371 | -$OC_6H_5$ | 563 |
| 2372 | -OH | 487 |
| 2373 | -$CONH_2$ | 514 |
| 2374 | -$CH_2OH$ | 501 |
| 2375 | -$C_2H_5$ | 499 |
| 2376 | -$NHCOCH_3$ | 528 |
| 2377 | -$COC_6H_5$ | 575 |
| 2378 | -2-PYRIDYL | 548 |

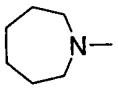
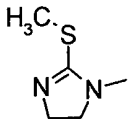
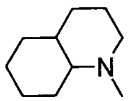
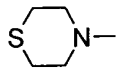
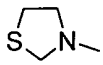
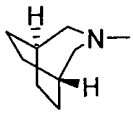
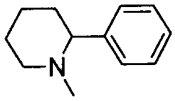
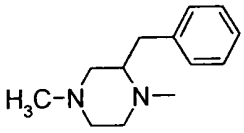
[Tabela 245]



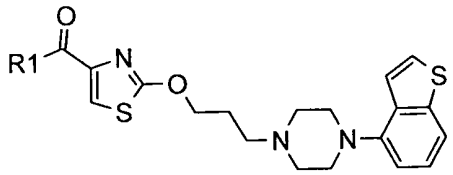
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2379 |  | 554 |
| 2380 |  | 578 |
| 2381 |  | 578 |
| 2382 |  | 556 |
| 2383 |  | 564 |
| 2384 |  | 564 |

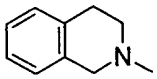
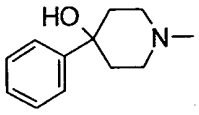
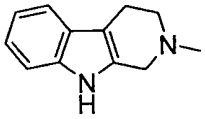
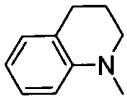
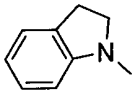
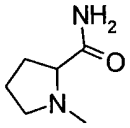
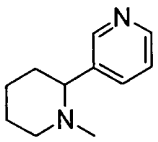
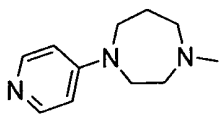
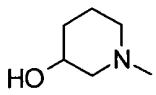
[Tabela 246]



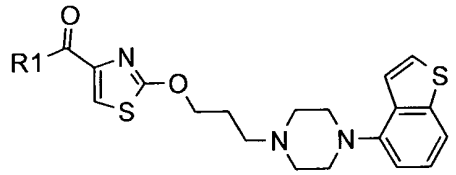
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2385 |  | 485 |
| 2386 |  | 502 |
| 2387 |  | 525 |
| 2388 |  | 489 |
| 2389 |  | 475 |
| 2390 |  | 511 |
| 2391 |  | 539 |
| 2392 |  | 547 |
| 2393 |  | 576 |

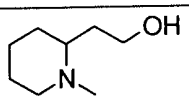
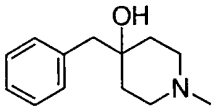
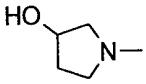
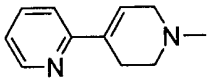
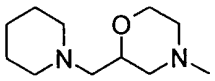
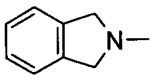
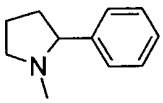
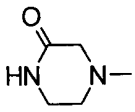
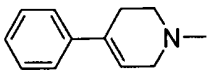
[Tabela 247]



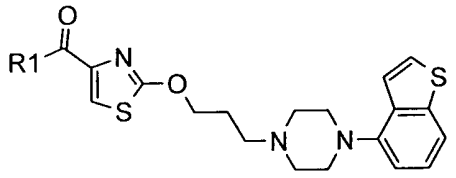
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2394 |  | 519 |
| 2395 |  | 563 |
| 2396 |  | 558 |
| 2397 |  | 519 |
| 2398 |  | 505 |
| 2399 |  | 500 |
| 2400 |  | 548 |
| 2401 |  | 563 |
| 2402 |  | 487 |

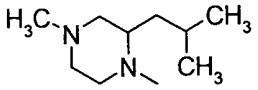
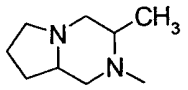
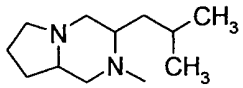
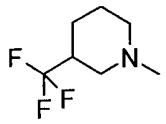
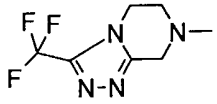
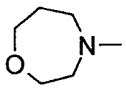
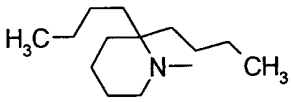
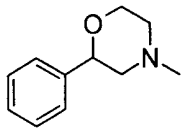
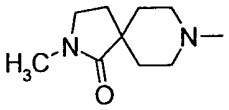
[Tabela 248]



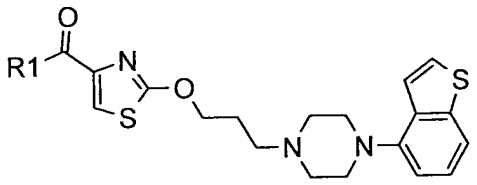
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2403 |  | 515 |
| 2404 |  | 577 |
| 2405 |  | 473 |
| 2406 |  | 546 |
| 2407 |  | 570 |
| 2408 |  | 505 |
| 2409 |  | 533 |
| 2410 |  | 486 |
| 2411 |  | 545 |

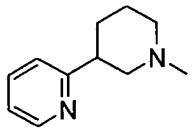
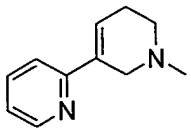
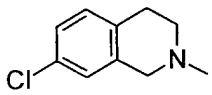
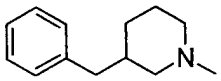
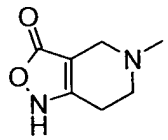
[Tabela 249]



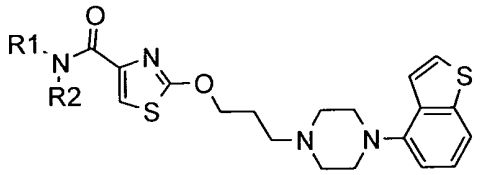
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2412 |  | 542 |
| 2413 |  | 526 |
| 2414 |  | 568 |
| 2415 |  | 539 |
| 2416 |  | 578 |
| 2417 |  | 487 |
| 2418 |  | 583 |
| 2419 |  | 549 |
| 2420 |  | 554 |

[Tabela 250]



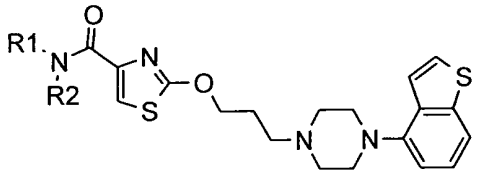
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2421 |  | 548 |
| 2422 |  | 546 |
| 2423 |  | 553 |
| 2424 |  | 561 |
| 2425 |  | 526 |
| 2426 |  | 443 |

[Tabela 251]



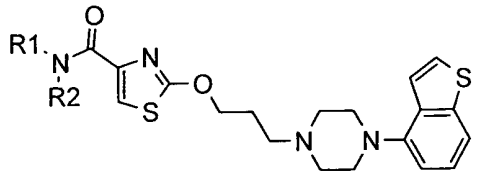
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2427 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | -$CH_3$ | 499 |
| 2428 | -H | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 485 |
| 2429 | -H | -$CH(CH_3)_2$ | 445 |
| 2430 | -$C_4H_9$ | -$C_4H_9$ | 515 |
| 2431 | -$CH_2CH(CH_3)_2$ | -$CH_2CH(CH_3)_2$ | 515 |
| 2432 | -$CH_2CH_2OH$ | -$CH_2CH_2OH$ | 491 |
| 2433 | -$CH_2CH_2OH$ | -$C_2H_5$ | 475 |
| 2434 | -$C_6H_{13}$ | -$C_6H_{13}$ | 571 |
| 2435 | -$CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | -$CH_3$ | 488 |
| 2436 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | -$CH_2CH_2OH$ | 529 |
| 2437 | -$CH_2CH_2OCH_3$ | -$CH_2CH_2OCH_3$ | 519 |
| 2438 | -$(CH_2)_3N(CH_3)_2$ | -$(CH_2)_3N(CH_3)_2$ | 573 |
| 2439 | -$(CH_2)_3N(C_2H_5)_2$ | -$CH_3$ | 530 |
| 2440 | -$CH_2CH{=}CH_2$ | -ciclo-$C_5H_9$ | 511 |
| 2441 | -$C_2H_5$ | -$C_2H_5$ | 459 |
| 2442 | -H | -$C(CH_3)_3$ | 459 |
| 2443 | -H | -ciclo-$C_3H_5$ | 443 |
| 2444 | -H | -ciclo-$C_7H_{13}$ | 499 |
| 2445 | -H | -$CH_2C_6H_5$ | 493 |
| 2446 | -$C_3H_7$ | -$(CH_2)_3C_6H_5$ | 563 |
| 2447 | -$CH_2CONHCH_3$ | -$CH_2C_6H_5$ | 564 |
| 2448 | -$CH_2C_6H_5$ | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 575 |
| 2449 | -$(CH_2)_2C_6H_5$ | -$CH_3$ | 521 |
| 2450 | -$CH_2C_6H_5$ | -$CH_3$ | 507 |
| 2451 | -$CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | -$CH_2C_6H_5$ | 564 |
| 2452 | -$CH_2C_6H_5$ | -$C_5H_{11}$ | 563 |

[Tabela 252]



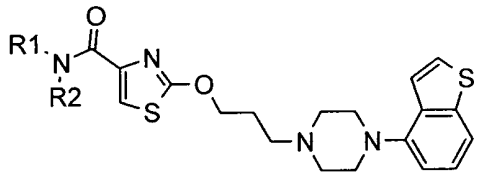
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2453 | $-CH_2C_6H_5$ | $-CH_2C_6H_5$ | 583 |
| 2454 | $-CH_2C_6H_5$ | $-C_2H_5$ | 521 |
| 2455 | $-CH_2C_6H_5$ | $-CH(CH_3)_2$ | 535 |
| 2456 | $-CH_2CH_2CN$ | $-CH_2C_6H_5$ | 546 |
| 2457 | $-(CH_2)_2OC_6H_5$ | $-CH_3$ | 537 |
| 2458 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | $-C_2H_5$ | 513 |
| 2459 | $-CH(CH_3)_2$ | $-C_2H_5$ | 473 |
| 2460 | -H | $-C_2H_5$ | 431 |
| 2461 | -H | $-CH_2CH(CH_3)_2$ | 459 |
| 2462 | -H | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 461 |
| 2463 | $-C_2H_5$ | $-C_4H_9$ | 487 |
| 2464 | -H | $-CH_2CH_2OC_2H_5$ | 475 |
| 2465 | -H | $-(CH_2)_3OC_2H_5$ | 489 |
| 2466 | $-CH_2C_6H_5$ | $-C_6H_5$ | 569 |
| 2467 | $-C_6H_5$ | $-C_2H_5$ | 507 |
| 2468 | $-C_6H_5$ | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 561 |
| 2469 | $-CH_2CH_2CN$ | $-C_6H_5$ | 532 |
| 2470 | -2-PYRIDYL | $-C_2H_5$ | 508 |
| 2471 | -H | $-C_6H_5$ | 479 |
| 2472 | -H | -3-PYRIDYL | 480 |
| 2473 | -H | -2-PYRIDYL | 480 |
| 2474 | -H | -4-PYRIDYL | 480 |
| 2475 | $-C_6H_5$ | $-CH_3$ | 493 |
| 2476 | -H | $-CH_2$-ciclo-$C_6H_{11}$ | 499 |
| 2477 | -H | $-(CH_2)_3C_6H_5$ | 521 |
| 2478 | -H | $-(CH_2)_2NHCOCH_3$ | 488 |
| 2479 | -H | $-(CH_2)_5OH$ | 489 |

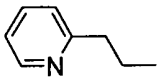
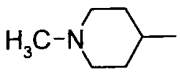
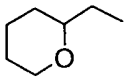
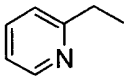
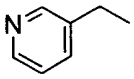
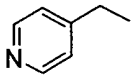
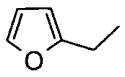
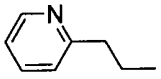
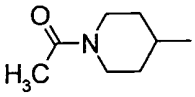
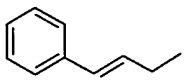
[Tabela 253]



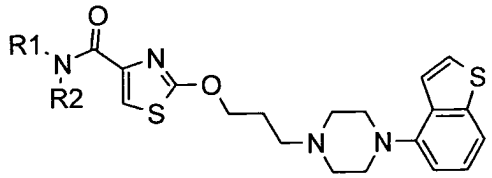
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2480 | -H | $-(CH_2)_2C_6H_5$ | 507 |
| 2481 | -H | $-CH_2CONH_2$ | 460 |
| 2482 | -H | $-CH_2CCH$ | 441 |
| 2483 | $-C_5H_{11}$ | $-CH_3$ | 487 |
| 2484 | -H | $-(CH_2)_2CH(CH_3)_2$ | 473 |
| 2485 | -H | $-CH_2C(CH_3)_3$ | 473 |
| 2486 | -H | $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | 474 |
| 2487 | $-CH_2C_6H_5$ | $-(CH_2)_3OH$ | 551 |
| 2488 | $-CH_3$ | $-CH_2$-ciclo-$C_3H_5$ | 471 |
| 2489 | -H | $-CH_2CF_3$ | 485 |
| 2490 | -H | $-NHCH_2CF_3$ | 500 |
| 2491 | $-CH_3$ | $-CH_3$ | 431 |
| 2492 | -H | $-(CH_2)_3OCH(CH_3)_2$ | 503 |
| 2493 | -H | $-CH_2CH_2C(CH_3)_3$ | 487 |
| 2494 | -H | $-CH_2CN$ | 442 |
| 2495 | -H | $-(CH_2)_3OCH_3$ | 475 |
| 2496 | -H | $-(CH_2)_2OCH(CH_3)_2$ | 489 |
| 2497 | -H | $-CH_2CH_2CN$ | 456 |
| 2498 | -H | $-CH_2CONHCH_3$ | 474 |
| 2499 | -H | $-(CH_2)SCH_3$ | 477 |
| 2500 | -H | $-CH_2CHF_2$ | 467 |
| 2501 | -H | $-CH_2CH_2OH$ | 447 |
| 2502 | -H | $-C_6H_{13}$ | 487 |
| 2503 | $-CH_2CON(CH_3)_2$ | $-CH_3$ | 502 |
| 2504 | $-CH_2C_6H_5$ | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 551 |
| 2505 | -H | $-(CH_2)_2NHCONH_2$ | 489 |

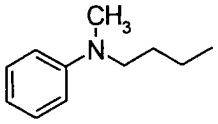
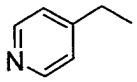
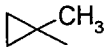
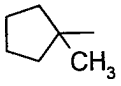
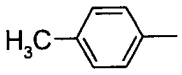
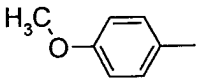
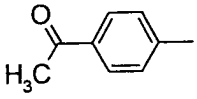
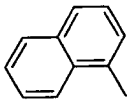
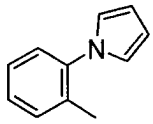
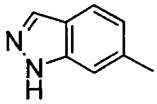
[Tabela 254]



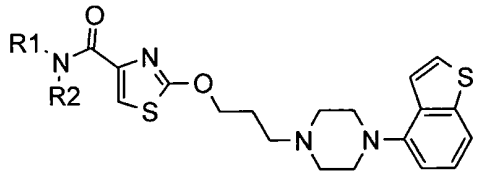
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2506 |  | -$CH_3$ | 522 |
| 2507 |  | -$CH_3$ | 514 |
| 2508 |  | -$C_2H_5$ | 529 |
| 2509 |  | -H | 494 |
| 2510 |  | -H | 494 |
| 2511 |  | -H | 494 |
| 2512 |  | -H | 483 |
| 2513 |  | -$C_2H_5$ | 536 |
| 2514 |  | -$CH_3$ | 542 |
| 2515 |  | -$C_2H_5$ | 547 |

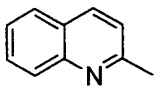
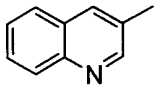
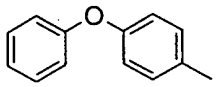
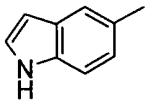
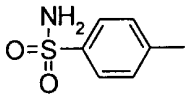
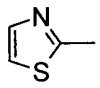
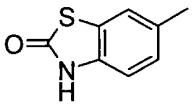
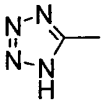
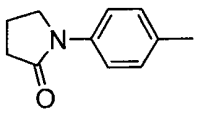
[Tabela 255]



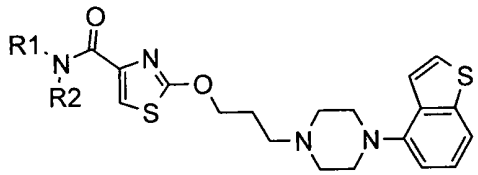
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2516 |  | -$CH_3$ | 564 |
| 2517 |  | -$C_2H_5$ | 522 |
| 2518 |  | -H | 457 |
| 2519 |  | -H | 485 |
| 2520 |  | -$CH_3$ | 507 |
| 2521 |  | -H | 509 |
| 2522 |  | -H | 521 |
| 2523 |  | -H | 529 |
| 2524 |  | -H | 544 |
| 2525 |  | -H | 519 |

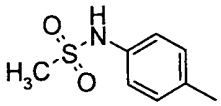
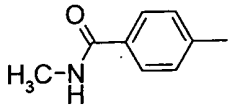
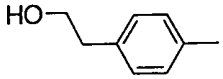
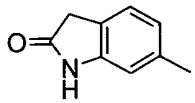
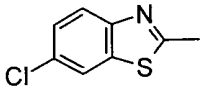
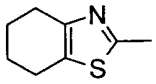
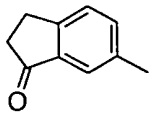
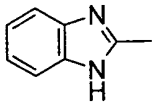
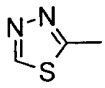
[Tabela 256]



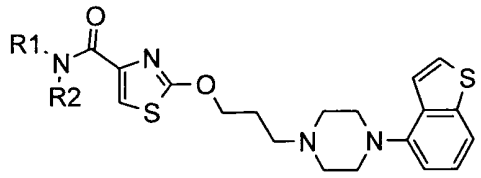
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2526 |  | -H | 530 |
| 2527 |  | -H | 530 |
| 2528 |  | -H | 571 |
| 2529 |  | -H | 518 |
| 2530 |  | -H | 558 |
| 2531 |  | -H | 486 |
| 2532 |  | -H | 552 |
| 2533 |  | -H | 471 |
| 2534 |  | -H | 562 |

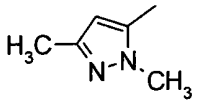
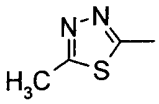
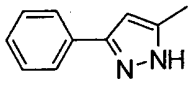
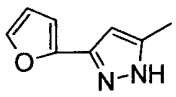
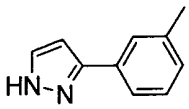
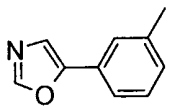
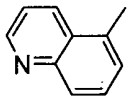
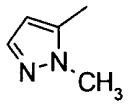
[Tabela 257]



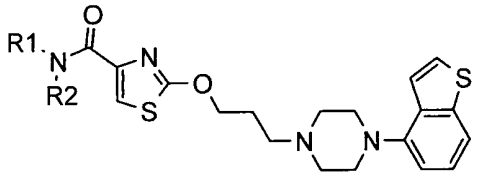
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2535 |  | -H | 572 |
| 2536 |  | -H | 536 |
| 2537 |  | -H | 523 |
| 2538 |  | -H | 534 |
| 2539 |  | -H | 570 |
| 2540 |  | -H | 540 |
| 2541 |  | -H | 533 |
| 2542 |  | -H | 519 |
| 2543 |  | -H | 487 |

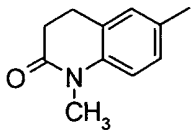
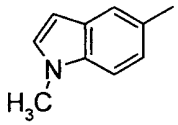
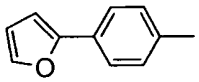
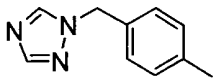
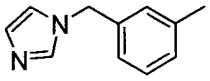
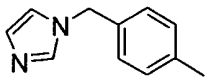
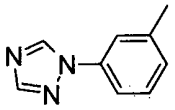
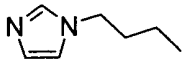
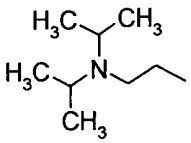
[Tabela 258]



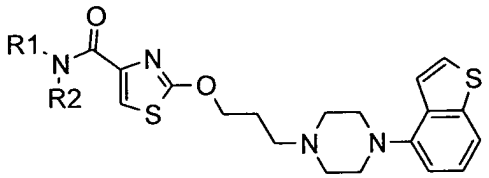
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2544 |  | -H | 497 |
| 2545 |  | -H | 501 |
| 2546 |  | -H | 545 |
| 2547 |  | -H | 535 |
| 2548 |  | -H | 545 |
| 2549 |  | -H | 546 |
| 2550 |  | -H | 530 |
| 2551 |  | -H | 483 |

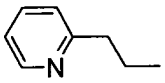
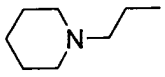
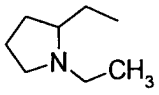
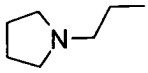
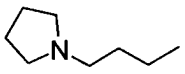
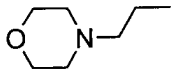
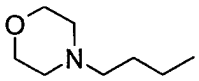
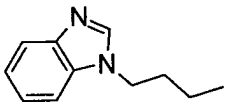
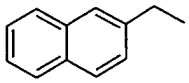
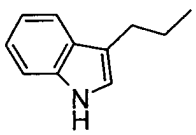
[Tabela 259]



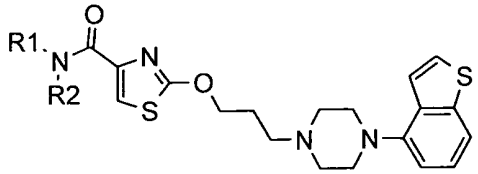
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2552 |  | -H | 562 |
| 2553 |  | -H | 532 |
| 2554 |  | -H | 545 |
| 2555 |  | -H | 560 |
| 2556 |  | -H | 559 |
| 2557 |  | -H | 559 |
| 2558 |  | -H | 546 |
| 2559 |  | -H | 511 |
| 2560 |  | -H | 530 |

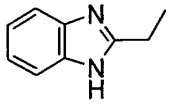
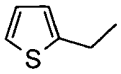
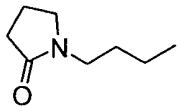
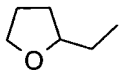
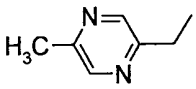
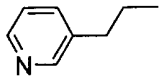
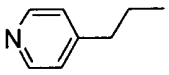
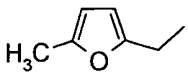
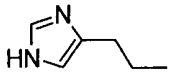
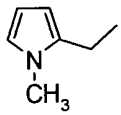
[Tabela 260]



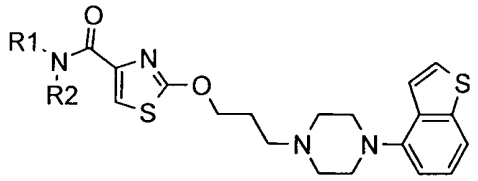
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2561 |  | -H | 508 |
| 2562 |  | -H | 514 |
| 2563 |  | -H | 514 |
| 2564 |  | -H | 500 |
| 2565 |  | -H | 514 |
| 2566 |  | -H | 516 |
| 2567 |  | -H | 530 |
| 2568 |  | -H | 561 |
| 2569 |  | -H | 543 |
| 2570 |  | -H | 546 |

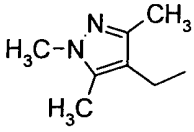
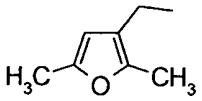
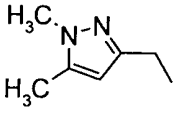
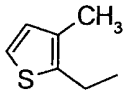
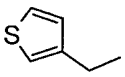
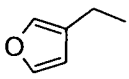
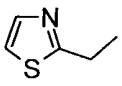
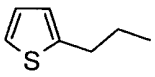
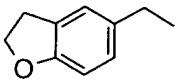
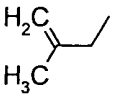
[Tabela 261]



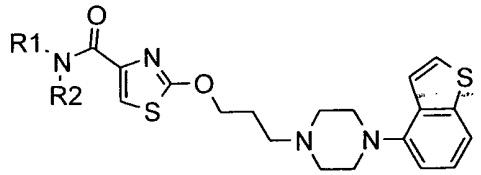
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2571 |  | -H | 533 |
| 2572 |  | -H | 499 |
| 2573 |  | -H | 528 |
| 2574 |  | -H | 487 |
| 2575 |  | -H | 509 |
| 2576 |  | -H | 508 |
| 2577 |  | -H | 508 |
| 2578 |  | -H | 497 |
| 2579 |  | -H | 497 |
| 2580 |  | -H | 496 |

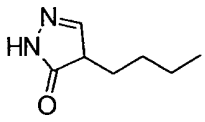
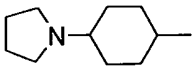
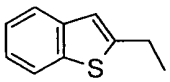
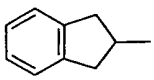
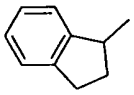
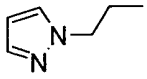
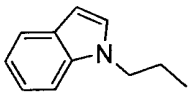
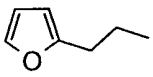
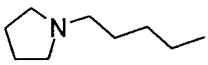
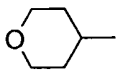
[Tabela 262]



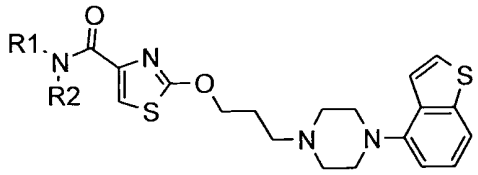
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2581 |  | -H | 525 |
| 2582 |  | -H | 511 |
| 2583 |  | -H | 511 |
| 2584 |  | -H | 513 |
| 2585 |  | -H | 499 |
| 2586 |  | -H | 483 |
| 2587 |  | -H | 500 |
| 2588 |  | -H | 513 |
| 2589 |  | -H | 535 |
| 2590 |  | -H | 457 |

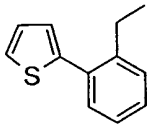
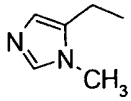
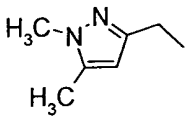
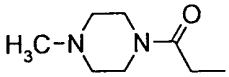
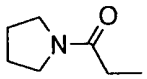
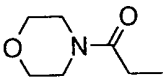
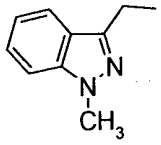
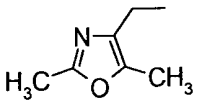
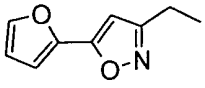
[Tabela 263]



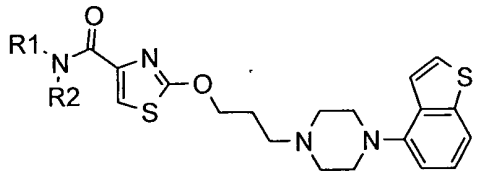
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2591 |  | -H | 527 |
| 2592 |  | -H | 554 |
| 2593 |  | -H | 549 |
| 2594 |  | -H | 519 |
| 2595 |  | -H | 519 |
| 2596 |  | -H | 497 |
| 2597 |  | -H | 546 |
| 2598 |  | -H | 497 |
| 2599 |  | -H | 528 |
| 2600 |  | -H | 487 |

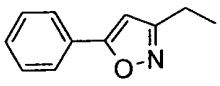
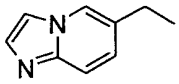
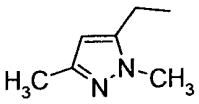
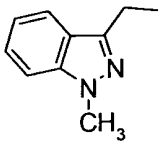
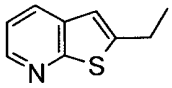
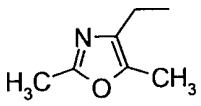
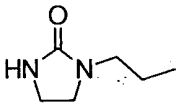
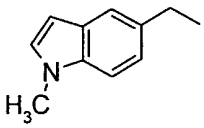
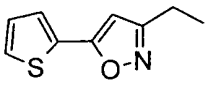
[Tabela 264]



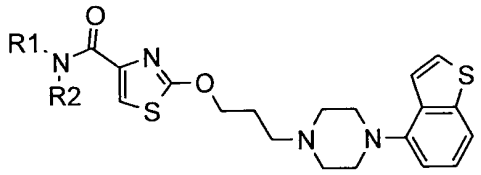
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2601 |  | -H | 575 |
| 2602 |  | -$CH_3$ | 511 |
| 2603 |  | -$CH_3$ | 525 |
| 2604 |  | -$CH_3$ | 557 |
| 2605 |  | -$CH_3$ | 528 |
| 2606 |  | -$CH_3$ | 544 |
| 2607 |  | -H | 547 |
| 2608 |  | -$CH_3$ | 526 |
| 2609 |  | -$CH_3$ | 564 |

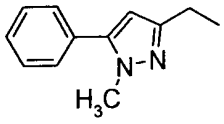
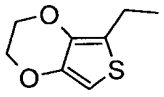
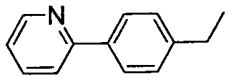
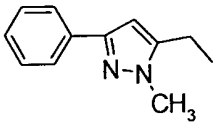
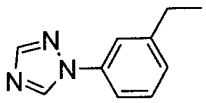
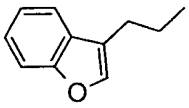
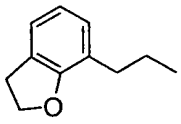
[Tabela 265]



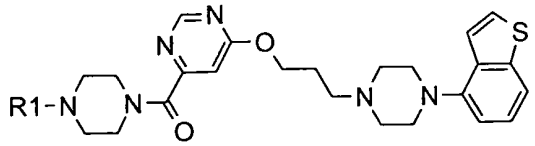
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2610 |  | -$CH_3$ | 574 |
| 2611 |  | -$CH_3$ | 547 |
| 2612 |  | -H | 511 |
| 2613 |  | -$CH_3$ | 561 |
| 2614 |  | -$CH_3$ | 564 |
| 2615 |  | -H | 512 |
| 2616 |  | -H | 515 |
| 2617 |  | -$CH_3$ | 560 |
| 2618 |  | -H | 566 |

[Tabela 266]



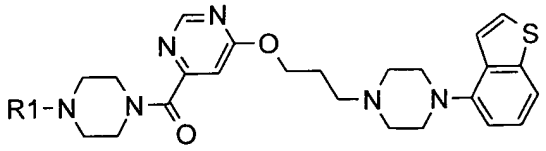
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2619 |  | -H | 573 |
| 2620 |  | $-CH_3$ | 571 |
| 2621 |  | $-CH_3$ | 584 |
| 2622 |  | $-CH_3$ | 587 |
| 2623 |  | -H | 560 |
| 2624 |  | -H | 547 |
| 2625 |  | -H | 549 |

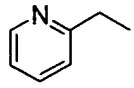
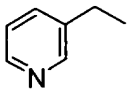
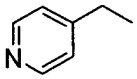
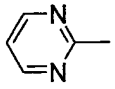
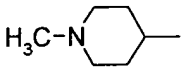
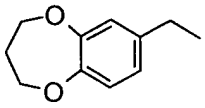
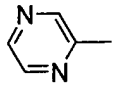
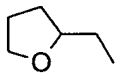
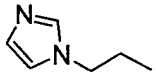
[Tabela 267]



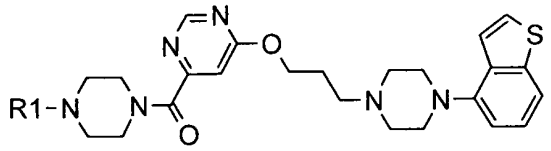
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2626 | -2-PYRIDYL | 544 |
| 2627 | $-C_4H_9$ | 523 |
| 2628 | $-CH(CH_3)_2$ | 509 |
| 2629 | $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | 538 |
| 2630 | -4-PYRIDYL | 544 |
| 2631 | $-C_6H_5$ | 543 |
| 2632 | $-C_3H_7$ | 509 |
| 2633 | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 525 |
| 2634 | $-CH_3$ | 481 |
| 2635 | -3-PYRIDYL | 544 |
| 2636 | $-C_6H_{13}$ | 551 |
| 2637 | $-C_2H_5$ | 495 |
| 2638 | $-CH_2CH_2OH$ | 511 |
| 2639 | $-COCH_3$ | 509 |
| 2640 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 549 |
| 2641 | $-SO_2C_2H_5$ | 559 |

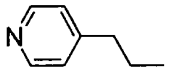
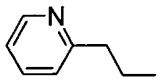
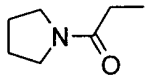
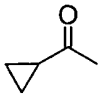
[Tabela 268]



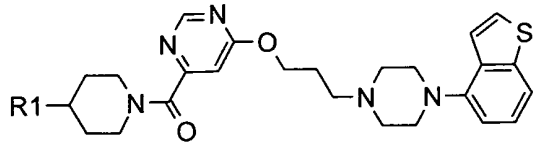
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2642 |  | 558 |
| 2643 |  | 558 |
| 2644 |  | 558 |
| 2645 |  | 545 |
| 2646 |  | 564 |
| 2647 |  | 629 |
| 2648 |  | 545 |
| 2649 |  | 551 |
| 2650 |  | 561 |

[Tabela 269]



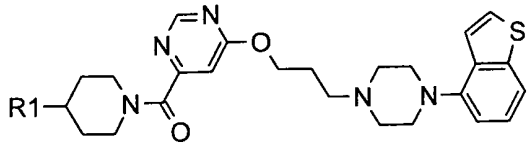
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2651 |  | 572 |
| 2652 |  | 572 |
| 2653 |  | 578 |
| 2654 |  | 550 |
| 2655 |  | 535 |

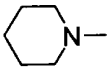
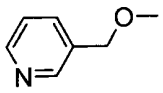
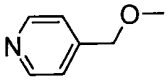
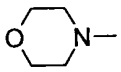
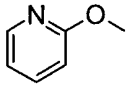
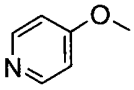
[Tabela 270]



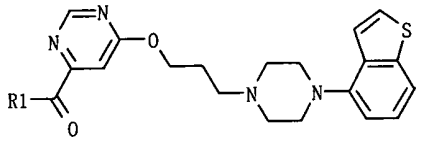
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2656 | $-OCH_3$ | 496 |
| 2657 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 548 |
| 2658 | $-C_6H_5$ | 542 |
| 2659 | $-OCH_2C_6H_5$ | 572 |
| 2660 | $-OC_6H_5$ | 558 |
| 2661 | -OH | 482 |
| 2662 | $-CONH_2$ | 509 |
| 2663 | $-C_2H_5$ | 494 |
| 2664 | $-NHCOCH_3$ | 523 |
| 2665 | $-COC_6H_5$ | 570 |
| 2666 | -2-PYRIDYL | 543 |

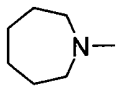
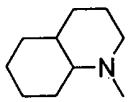
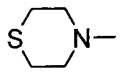
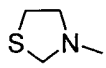
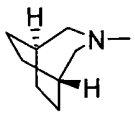
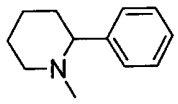
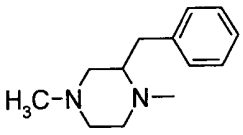
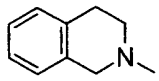
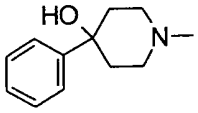
[Tabela 271]



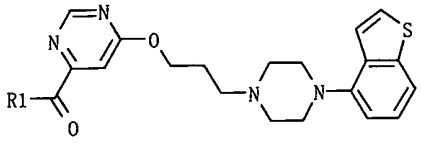
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2667 |  | 549 |
| 2668 |  | 573 |
| 2669 |  | 573 |
| 2670 |  | 551 |
| 2671 |  | 559 |
| 2672 |  | 559 |

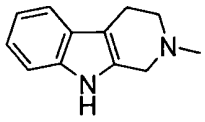
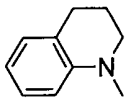
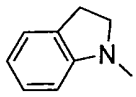
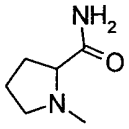
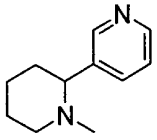
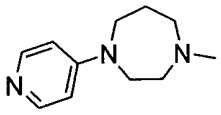
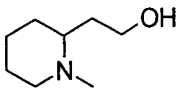
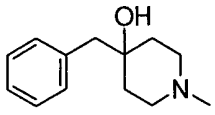
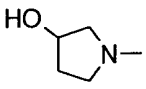
[Tabela 272]



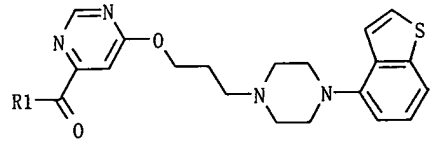
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2673 |  | 480 |
| 2674 |  | 520 |
| 2675 |  | 484 |
| 2676 |  | 470 |
| 2677 |  | 506 |
| 2678 |  | 534 |
| 2679 |  | 542 |
| 2680 |  | 571 |
| 2681 |  | 514 |
| 2682 |  | 558 |

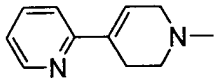
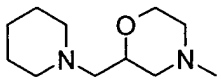
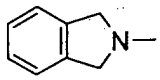
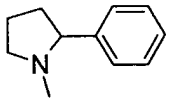
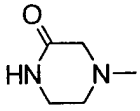
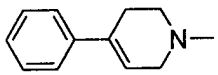
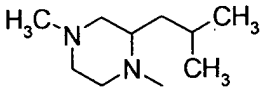
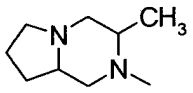
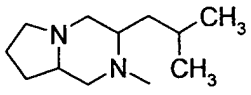
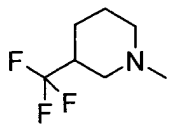
[Tabela 273]



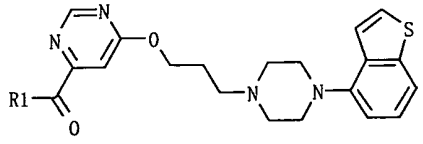
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2683 |  | 553 |
| 2684 |  | 514 |
| 2685 |  | 500 |
| 2686 |  | 495 |
| 2687 |  | 543 |
| 2688 |  | 558 |
| 2689 |  | 510 |
| 2690 |  | 572 |
| 2691 |  | 468 |

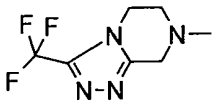
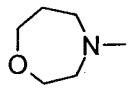
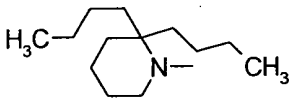
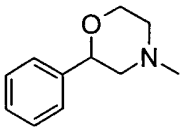
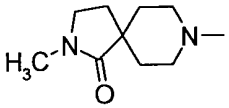
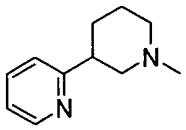
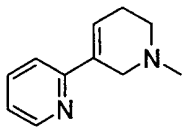
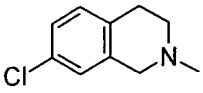
[Tabela 274]



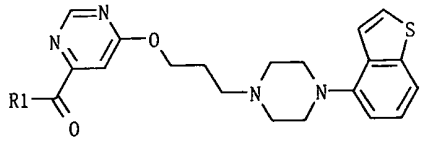
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2692 |  | 541 |
| 2693 |  | 565 |
| 2694 |  | 500 |
| 2695 |  | 528 |
| 2696 |  | 481 |
| 2697 |  | 540 |
| 2698 |  | 537 |
| 2699 |  | 521 |
| 2700 |  | 563 |
| 2701 |  | 534 |

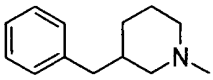
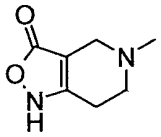
[Tabela 275]



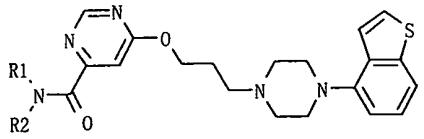
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2702 |  | 573 |
| 2703 |  | 482 |
| 2704 |  | 578 |
| 2705 |  | 544 |
| 2706 |  | 549 |
| 2707 |  | 543 |
| 2708 |  | 541 |
| 2709 |  | 548 |

[Tabela 276]



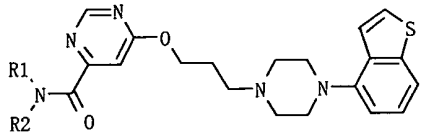
| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 2710 |  | 556 |
| 2711 |  | 521 |
| 2712 |  | 438 |

[Tabela 277]



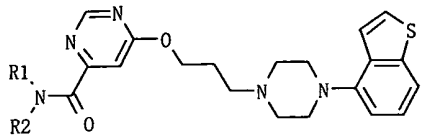
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2713 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | -$CH_3$ | 494 |
| 2714 | -H | -$CH(CH_3)_2$ | 440 |
| 2715 | -$C_4H_9$ | -$C_4H_9$ | 510 |
| 2716 | -$CH_2CH(CH_3)_2$ | -$CH_2CH(CH_3)_2$ | 510 |
| 2717 | -$CH_2CH_2OH$ | -$CH_2CH_2OH$ | 486 |
| 2718 | -$C_6H_{13}$ | -$C_6H_{13}$ | 566 |
| 2719 | -$CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | -$CH_3$ | 483 |
| 2720 | -$CH_2CH_2OCH_3$ | -$CH_2CH_2OCH_3$ | 514 |
| 2721 | -$CH_2CH(CH_3)_2$ | -$CH_2CH(CH_3)_2$ | 568 |
| 2722 | -$(CH_2)_3N(C_2H_5)_2$ | -$CH_3$ | 525 |
| 2723 | -$CH_2CH{=}CH_2$ | -ciclo-$C_5H_9$ | 506 |
| 2724 | -H | -$C_4H_9$ | 454 |
| 2725 | -H | -ciclo-$C_3H_5$ | 438 |
| 2726 | -H | -ciclo-$C_7H_{13}$ | 494 |
| 2727 | -H | -$CH_2C_6H_5$ | 488 |
| 2728 | -$C_3H_7$ | -$(CH_2)_3C_6H_5$ | 558 |
| 2729 | -$CH_2CONHCH_3$ | -$CH_2C_6H_5$ | 559 |
| 2730 | -$CH_2C_6H_5$ | -ciclo-$C_6H_{11}$ | 570 |
| 2731 | -$(CH_2)_2C_6H_5$ | -$CH_3$ | 516 |
| 2732 | -$CH_2C_6H_5$ | -$CH_3$ | 502 |
| 2733 | -$CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | -$CH_2C_6H_5$ | 559 |
| 2734 | -$CH_2C_6H_5$ | -$C_5H_{11}$ | 558 |
| 2735 | -$CH_2C_6H_5$ | -$CH_2C_6H_5$ | 578 |
| 2736 | -$CH_2C_6H_5$ | -$C_2H_5$ | 516 |
| 2737 | -$CH_2C_6H_5$ | -$CH(CH_3)_2$ | 530 |
| 2738 | -$CH_2CH_2CN$ | -$CH_2C_6H_5$ | 541 |
| 2739 | -$(CH_2)_2OC_6H_5$ | -$CH_3$ | 532 |
| 2740 | -ciclo-$C_6H_{11}$ | -$C_2H_5$ | 508 |

[Tabela 178]



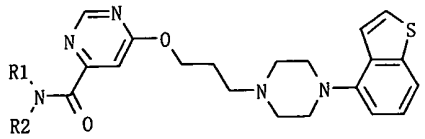
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2741 | $-CH(CH_3)_2$ | $-C_2H_5$ | 468 |
| 2742 | -H | $-C_2H_5$ | 426 |
| 2743 | -H | $-C_3H_7$ | 440 |
| 2744 | -H | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 456 |
| 2745 | $-CH_2$-ciclo-$C_6H_{11}$ | $-C_2H_5$ | 522 |
| 2746 | $-C_2H_5$ | $-C_4H_9$ | 482 |
| 2747 | -H | -1-$CH_3$-CICLOHEXYL | 494 |
| 2748 | -H | $-(CH_2)_2OC_6H_5$ | 518 |
| 2749 | $-CH_2C_6H_5$ | $-C_6H_5$ | 564 |
| 2750 | $-C_6H_5$ | $-CH_2CH_2OH$ | 518 |
| 2751 | $-C_6H_5$ | $-C_2H_5$ | 502 |
| 2752 | $-CH_2CH_2CN$ | $-C_6H_5$ | 527 |
| 2753 | -2-PYRIDYL | $-C_2H_5$ | 503 |
| 2754 | -H | $-C_6H_5$ | 474 |
| 2755 | -H | -3-PYRIDYL | 475 |
| 2756 | -H | -2-PYRIDYL | 475 |
| 2757 | -H | -4-PYRIDYL | 475 |
| 2758 | $-C_6H_5$ | $-CH_3$ | 488 |
| 2759 | -H | $-CH_2$-ciclo-$C_6H_{11}$ | 494 |
| 2760 | -H | $-(CH_2)_3C_6H_5$ | 516 |
| 2761 | -H | $-(CH_2)_2C_6H_5$ | 502 |
| 2762 | -H | $-CH_2CONH_2$ | 455 |
| 2763 | -H | $-CH_2CCH$ | 436 |
| 2764 | $-C_5H_{11}$ | $-CH_3$ | 482 |
| 2765 | $-CH(CH_3)_2$ | $-CH_3$ | 454 |
| 2766 | -H | $-(CH_2)_2CH(CH_3)_2$ | 468 |
| 2767 | -H | $-CH_2C(CH_3)_3$ | 468 |
| 2768 | -H | $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$ | 469 |

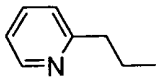
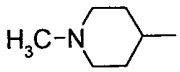
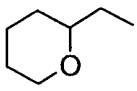
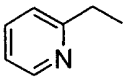
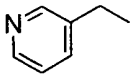
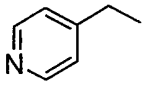
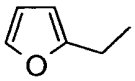
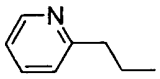
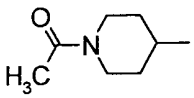
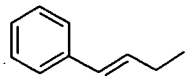
[Tabela 279]



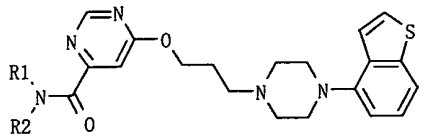
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2769 | $-CH_2C_6H_5$ | $-(CH_2)_3OH$ | 546 |
| 2770 | $-CH_3$ | $-CH_2$-ciclo-$C_3H_5$ | 466 |
| 2771 | -H | $-CH_2CF_3$ | 480 |
| 2772 | -H | $-NHCH_2CF_3$ | 495 |
| 2773 | $-CH_3$ | $-CH_3$ | 426 |
| 2774 | -H | $-(CH_2)_3OCH(CH_3)_2$ | 498 |
| 2775 | -H | $-CH_2CH_2C(CH_3)_3$ | 482 |
| 2776 | -H | $-CH_2CN$ | 437 |
| 2777 | -H | $-(CH_2)_3OCH_3$ | 470 |
| 2778 | -H | $-(CH_2)_2OCH(CH_3)_2$ | 484 |
| 2779 | -H | $-CH_2CH_2CN$ | 451 |
| 2780 | -H | $-CH_2CONHCH_3$ | 469 |
| 2781 | -H | $-(CH_2)SCH_3$ | 472 |
| 2782 | -H | $-CH_2CHF_2$ | 462 |
| 2783 | -H | $-C_6H_{13}$ | 482 |
| 2784 | $-CH_2CON(CH_3)_2$ | $-CH_3$ | 497 |
| 2785 | $-CH_2C_6H_5$ | $-CH_2CH_2OCH_3$ | 546 |
| 2786 | -H | $-(CH_2)_2NHCONH_2$ | 484 |

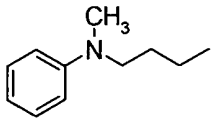
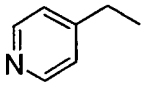
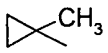
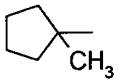
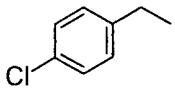
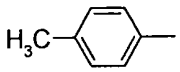
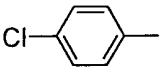
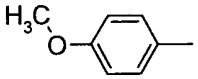
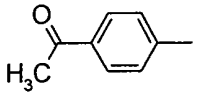
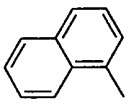
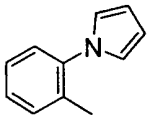
[Tabela 280]



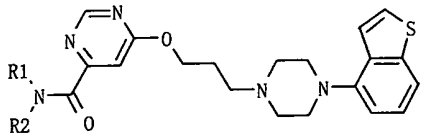
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2787 |  | -$CH_3$ | 517 |
| 2788 |  | -$CH_3$ | 509 |
| 2789 |  | -$C_2H_5$ | 524 |
| 2790 |  | -H | 489 |
| 2791 |  | -H | 489 |
| 2792 |  | -H | 489 |
| 2793 |  | -H | 478 |
| 2794 |  | -$C_2H_5$ | 531 |
| 2795 |  | -$CH_3$ | 537 |
| 2796 |  | -$C_2H_5$ | 542 |

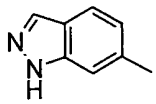
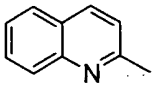
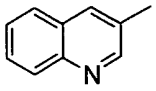
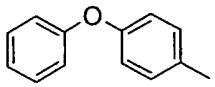
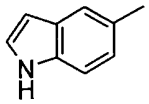
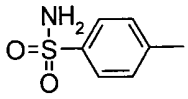
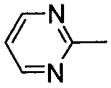
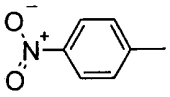
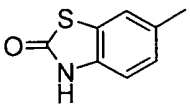
[Tabela 281]



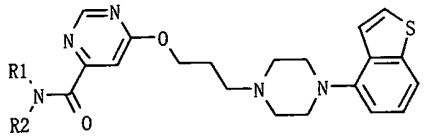
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2797 |  | -$CH_3$ | 559 |
| 2798 |  | -$C_2H_5$ | 517 |
| 2799 |  | -H | 452 |
| 2800 |  | -H | 480 |
| 2801 |  | -$CH_3$ | 536 |
| 2802 |  | -$CH_3$ | 502 |
| 2803 |  | -H | 508 |
| 2804 |  | -H | 504 |
| 2805 |  | -H | 516 |
| 2806 |  | -H | 524 |
| 2807 |  | -H | 539 |

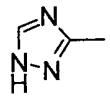
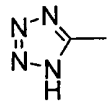
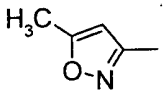
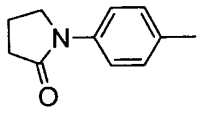
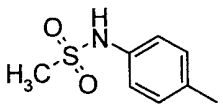
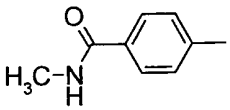
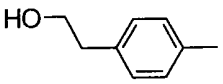
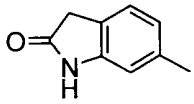
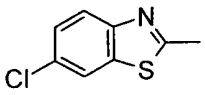
[Tabela 282]



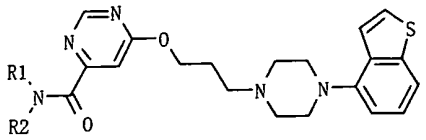
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2808 |  | -H | 514 |
| 2809 |  | -H | 525 |
| 2810 |  | -H | 525 |
| 2811 |  | -H | 566 |
| 2812 |  | -H | 513 |
| 2813 |  | -H | 553 |
| 2814 |  | -H | 481 |
| 2815 |  | -H | 476 |
| 2816 |  | -H | 519 |
| 2817 |  | -H | 547 |

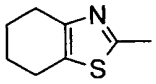
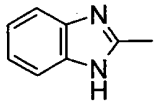
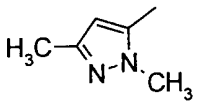
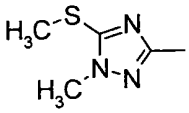
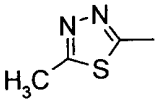
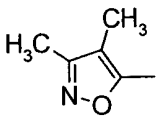
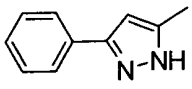
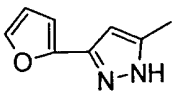
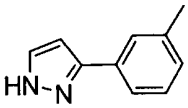
[Tabela 283]



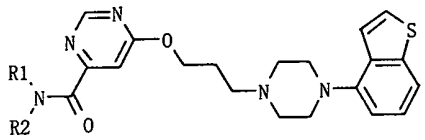
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2818 |  | -H | 465 |
| 2819 |  | -H | 466 |
| 2820 |  | -H | 479 |
| 2821 |  | -H | 557 |
| 2822 |  | -H | 567 |
| 2823 |  | -H | 531 |
| 2824 |  | -H | 518 |
| 2825 |  | -H | 529 |
| 2826 |  | -H | 565 |

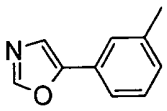
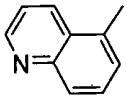
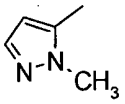
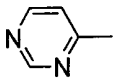
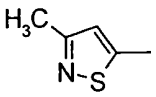
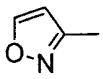
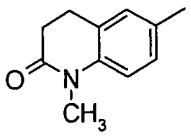
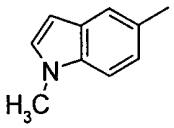
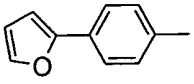
[Tabela 284]



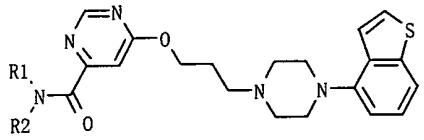
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2827 |  | -H | 535 |
| 2828 |  | -H | 514 |
| 2829 |  | -H | 492 |
| 2830 |  | -H | 525 |
| 2831 |  | -H | 496 |
| 2832 |  | -H | 493 |
| 2833 |  | -H | 540 |
| 2834 |  | -H | 530 |
| 2835 |  | -H | 540 |

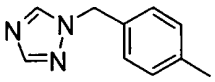
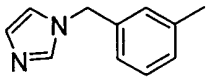
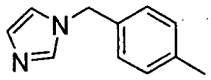
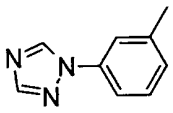
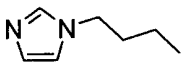
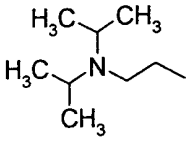
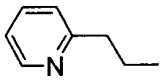
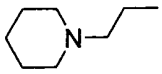
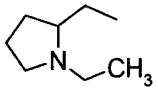
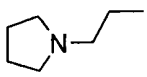
[Tabela 285]



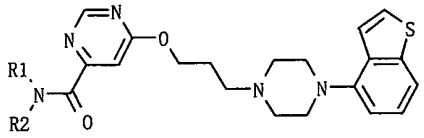
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2836 |  | -H | 541 |
| 2837 |  | -H | 525 |
| 2838 |  | -H | 478 |
| 2839 |  | -H | 476 |
| 2840 |  | -H | 495 |
| 2841 |  | -H | 465 |
| 2842 |  | -H | 557 |
| 2843 |  | -H | 527 |
| 2844 |  | -H | 540 |

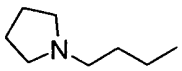
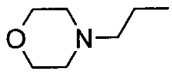
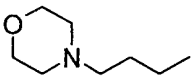
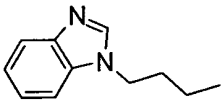
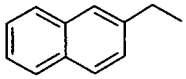
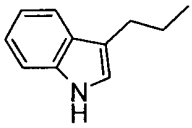
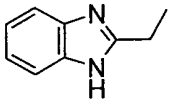
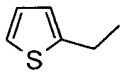
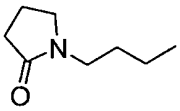
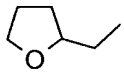
[Tabela 286]



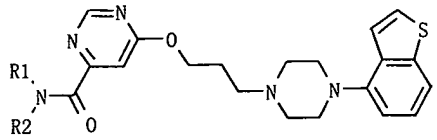
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2845 |  | -H | 555 |
| 2846 |  | -H | 554 |
| 2847 |  | -H | 554 |
| 2848 |  | -H | 541 |
| 2849 |  | -H | 506 |
| 2850 |  | -H | 525 |
| 2851 |  | -H | 503 |
| 2852 |  | -H | 509 |
| 2853 |  | -H | 509 |
| 2854 |  | -H | 495 |

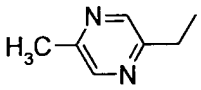
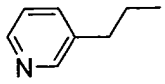
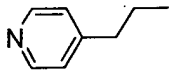
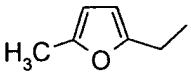
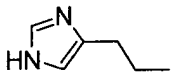
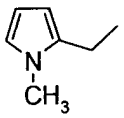
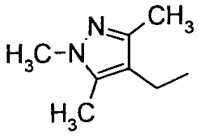
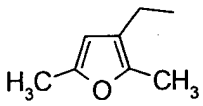
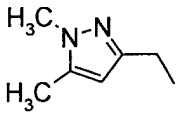
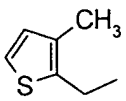
[Tabela 287]



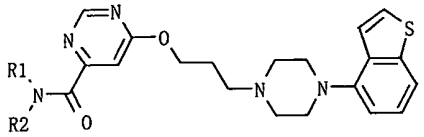
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2855 |  | -H | 509 |
| 2856 |  | -H | 511 |
| 2857 |  | -H | 525 |
| 2858 |  | -H | 556 |
| 2859 |  | -H | 538 |
| 2860 |  | -H | 541 |
| 2861 |  | -H | 528 |
| 2862 |  | -H | 494 |
| 2863 |  | -H | 523 |
| 2864 |  | -H | 482 |

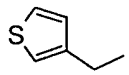
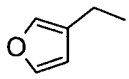
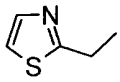
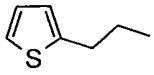
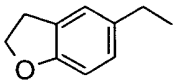
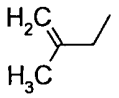
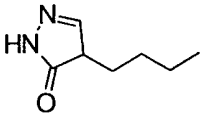
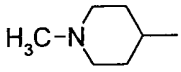
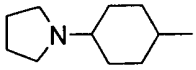
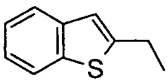
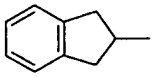
[Tabela 288]



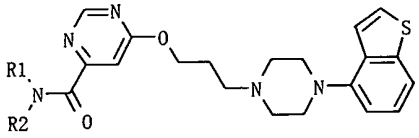
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2865 |  | -H | 504 |
| 2866 |  | -H | 503 |
| 2867 |  | -H | 503 |
| 2868 |  | -H | 492 |
| 2869 |  | -H | 492 |
| 2870 |  | -H | 491 |
| 2871 |  | -H | 520 |
| 2872 |  | -H | 506 |
| 2873 |  | -H | 506 |
| 2874 |  | -H | 508 |

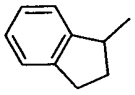
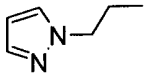
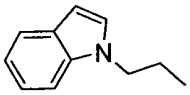
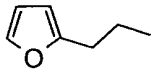
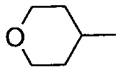
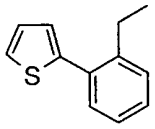
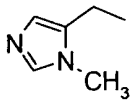
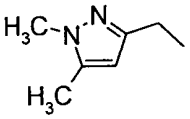
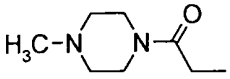
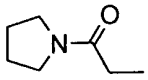
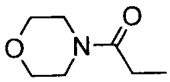
[Tabela 289]



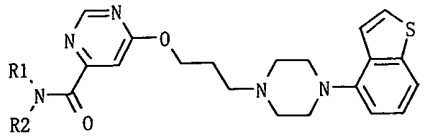
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2875 |  | -H | 494 |
| 2876 |  | -H | 478 |
| 2877 |  | -H | 495 |
| 2878 |  | -H | 508 |
| 2879 |  | -H | 530 |
| 2880 |  | -H | 452 |
| 2881 |  | -H | 522 |
| 2882 |  | -H | 495 |
| 2883 |  | -H | 549 |
| 2884 |  | -H | 544 |
| 2885 |  | -H | 514 |

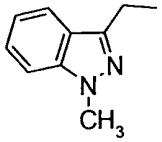
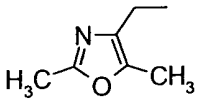
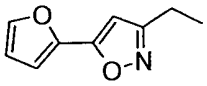
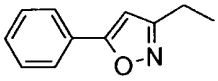
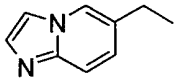
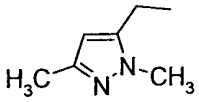
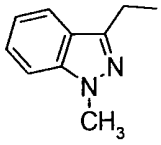
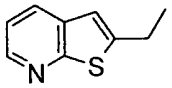
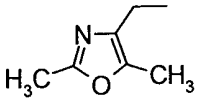
[Tabela 290]



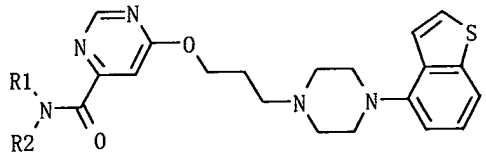
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2886 |  | -H | 514 |
| 2887 |  | -H | 492 |
| 2888 |  | -H | 541 |
| 2889 |  | -H | 492 |
| 2890 |  | -H | 482 |
| 2891 |  | -H | 570 |
| 2892 |  | $-CH_3$ | 506 |
| 2893 |  | $-CH_3$ | 520 |
| 2894 |  | $-CH_3$ | 552 |
| 2895 |  | $-CH_3$ | 523 |
| 2896 |  | $-CH_3$ | 539 |

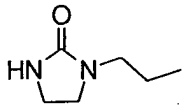
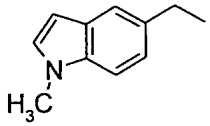
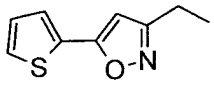
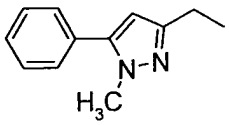
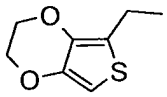
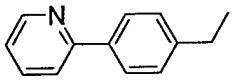
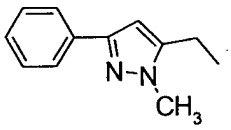
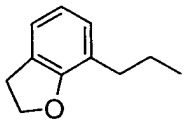
[Tabela 291]



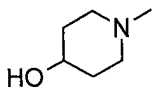
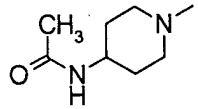
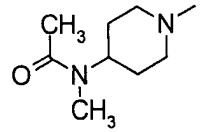
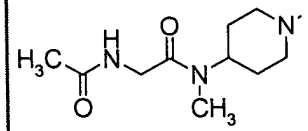
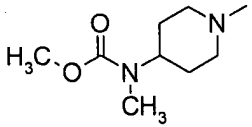
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2897 |  | -H | 542 |
| 2898 |  | $-CH_3$ | 521 |
| 2899 |  | $-CH_3$ | 559 |
| 2900 |  | $-CH_3$ | 569 |
| 2901 |  | $-CH_3$ | 542 |
| 2902 |  | -H | 506 |
| 2903 |  | $-CH_3$ | 556 |
| 2904 |  | $-CH_3$ | 559 |
| 2905 |  | -H | 507 |

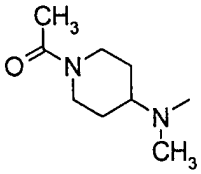
[Tabela 292]



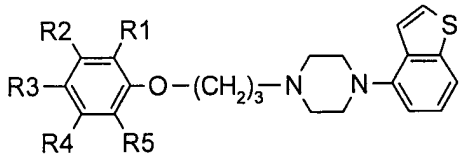
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 2906 |  | -H | 510 |
| 2907 |  | -$CH_3$ | 555 |
| 2908 |  | -H | 561 |
| 2909 |  | -H | 568 |
| 2910 |  | -$CH_3$ | 566 |
| 2911 |  | -$CH_3$ | 579 |
| 2912 |  | -$CH_3$ | 582 |
| 2913 |  | -H | 544 |

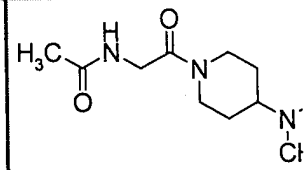
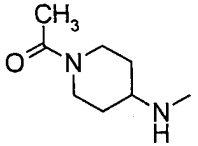
[Tabela 293]

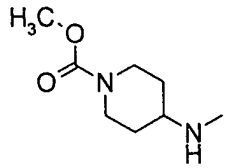
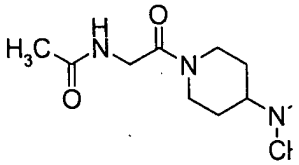
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 2914 | $-CH_3$ | -H |  | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 230,0 (dec) | Cloridrato |
| 2915 | $-CH_3$ | -H |  | -H | $-OCH_3$ | | | |
| 2916 | $-CH_3$ | -H |  | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 235,0 (dec) | Cloridrato |
| 2917 | $-CH_3$ | -H |  | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 227,0 (dec) | Cloridrato |
| 2918 | $-CH_3$ | -H |  | -H | $-OCH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 240,0 (dec) | Cloridrato |

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 2919 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 211,0-213,5 | Cloridrato |

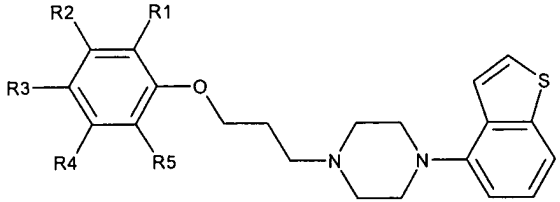
[Tabela 294]

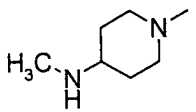
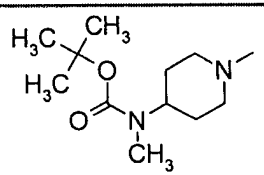


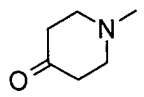
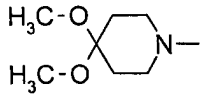
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 2920 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 207,5-210,0 | Cloridrato |
| 2921 | $-OCH_3$ | -H |  | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 247,0 (dec) | — |
| 2922 | $-CH_3$ | -H | $-CONHCH_3$ | -H | $-OC_3H_7$ | Pó branco (Etanol) | 178,5-179,5 | Cloridrato |

| | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 2923 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | | | Cloridrato |
| 2924 | -$OCH_3$ | -H |  | -H | -$CH_3$ | Pó branco (Acetato de etila) | 248,5-257,5 | Cloridrato |

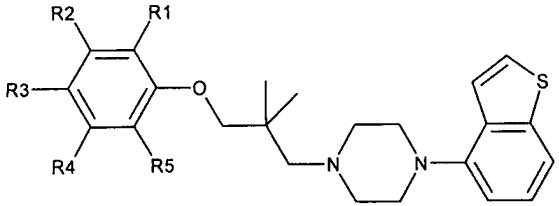
[Tabela 295]



| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 2925 | -$CH_3$ | -H |  | -H | -$OCH_3$ | RMN-$^1$H (CDCl3 ) δppm: 1,36-1,65(4H, m), 1,88-2,11 (3H, m ), 2,25(3H, s), 2,47(3H, s), 2,60-2,82(8H, m), 3,12-3,29(4H, m), 3,47-3,63(2H, m), 3,82(3H, s), 3,93( 2H, t, J=6,4Hz ), 6,34(1H, d, J=2,7Hz), 6,40(1H, d, J=2,7Hz), 6,90(1H, d, J=7,1Hz), 7,21-7,34(1H, m), 7,40 ( 2H, dd, J=5,5Hz, 9,9Hz ), 7,55(1H, d, J=8,0Hz). | — |
| 2926 | -$CH_3$ | -H |  | -H | -$OCH_3$ | RMN-$^1$H (CDCl3 ) δppm: 1,48(9H, s), 1,67-1,92(4H, m), 1,95-2,11 (2H, m ), 2,25(3H, s), 2,61-2,87(12H, m), 3,11-3,28(4H, m), 3,54-3,70(2H, m), 3,83(3H, s), 3,94( 2H, t, J=6,3Hz ), 6,34(1H, d, J=2,6Hz), 6,39(1H, d, J=2,6Hz), 6,90(1H, d, J=6,9Hz), 7,17-7,34(1H, m), 7,35-7,47 ( 2H, m ), 7,55(1H, d, J=8,0Hz). | — |

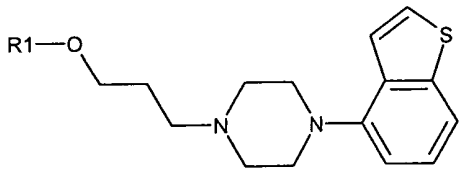
| | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 2927 | $-CH_3$ | -H |  | -H | $-OCH_3$ | RMN-$^1$H (CDCl3 ) δppm: 1,96-2,11(2H, m), 2,27(3H, s), 2,57(4H, t, J=6,0Hz), 2,64-2,84(6H, m), 3,13-3,27(14H, m), 3,51(4H, t, J=6,0Hz), 3,84(3H, s), 3,96( 2H, t, J=6,4Hz ), 6,38(1H, d, J=2,7Hz), 6,20(1H, d, J=2,7Hz), 6,90(1H, d, J=7,5Hz), 7,21-7,32(1H, m), 7,40 ( 2H, dd, J=5,5Hz, 10,0Hz ), 7,55(1H, d, J=8,1Hz). | — |
| 2928 | $-CH_3$ | -H |  | -H | $-OCH_3$ | RMN-$^1$H (CDCl3 ) δppm: 1,83-1,95 (4H, m ), 1,95-2,10(2H, m), 2,25(3H, s), 2,61-2,81(6H, m), 3,07-3,28(14H, m), 3,82(3H, s), 3,93( 2H, t, J=6,5Hz ), 6,30-6,43(2H, m), 6,90(1H, d, J=7,5Hz), 7,29-7,34(1H, m), 7,41 ( 2H, dd, J=6,0Hz, 10,0Hz ), 7,55(1H, d, J=7,9Hz). | — |

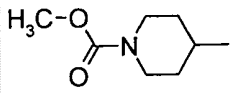
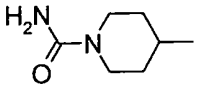
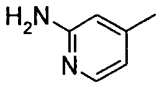
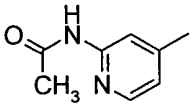
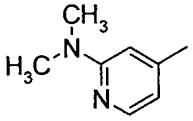
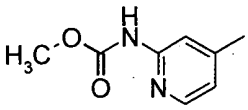
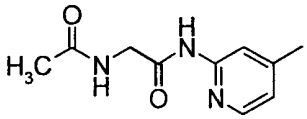
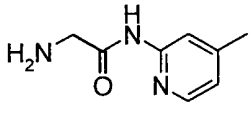
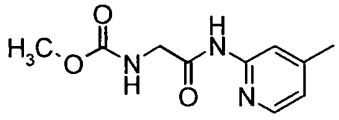
[Tabela 296]



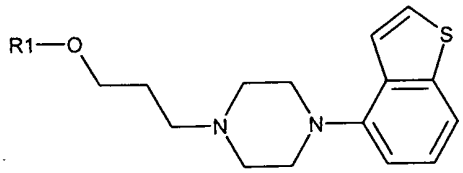
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 2929 | $-OCH_3$ | -H | $-CONH_2$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Etanol) | 189,0-192,5 | Cloridrato |
| 2930 | $-OCH_3$ | -H | $-CONHCH_3$ | -H | $-CH_3$ | Pó branco (Álcool isopropílico/água) | 165,5-167,0 | — |

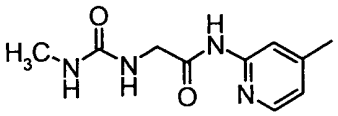
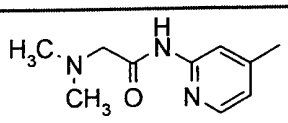
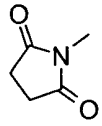
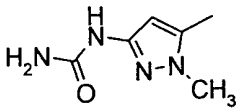
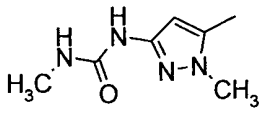
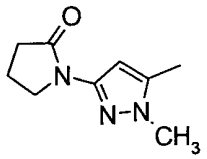
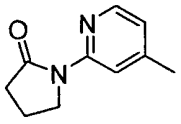
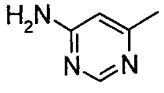
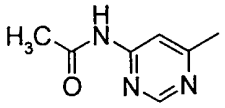
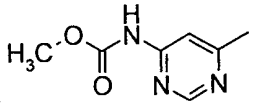
[Tabela 297]



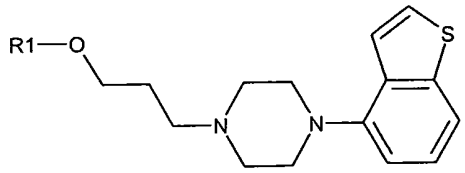
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| | | | | |
| 2931 |  | Pó branco (Acetato de etila/ metanol) | 214-217 | Cloridrato |
| 2932 | | Pó branco (Acetato de etila/ metanol) | 218-222 | 1/2 fumarato |
| 2933 |  | Cristal na forma de agulha incolor (Etanol) | 195-196 | — |
| 2934 | | Pó branco (Acetato de etila) | 145-146 | — |
| 2935 |  | Pó branco (Etanol/ acetato de etila) | 219-221 | Dicloridrato |
| 2936 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 162-164 | — |
| 2937 |  | Pó branco (Etanol/éter) | 208,5-209,5 | Dicloridrato |
| 2938 |  | Pó branco (n-hexano/ acetato de etila) | 137-139 | — |
| 2939 |  | Pó branco (Etanol) | 137-139 | — |
| 2940 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 163-165 | — |
| 2941 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 196-199 | — |

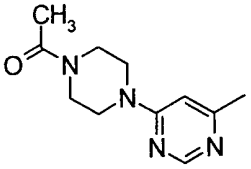
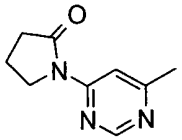
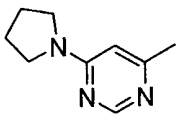
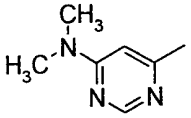
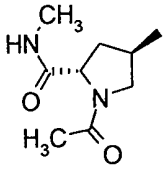
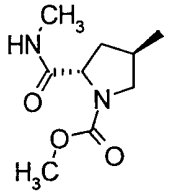
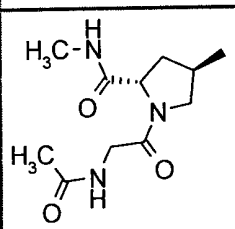
[Tabela 298]

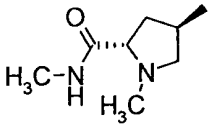


| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 2942 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 197-199 | — |
| 2943 |  | Pó branco (Etanol) | 232-233 | Dicloridrato |
| 2944 |  | Pó branco (Etanol/éter) | 255-257 | Cloridrato |
| 2945 |  | Pó branco (Etanol) | 169,5-172,5 | — |
| 2946 |  | Pó branco (Etanol) | 195,0-196,5 | — |
| 2947 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 151,5-153,5 | — |
| 2948 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 235,0 (dec) | Cloridrato |
| 2949 |  | | | |
| 2950 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 224,0-227,5 | Cloridrato |
| 2951 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 175,0-178,5 | — |

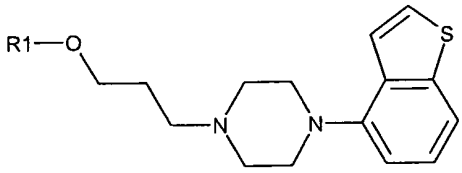
[Tabela 299]

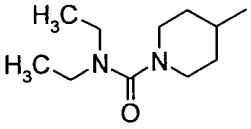
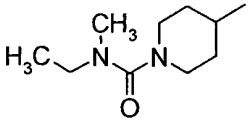
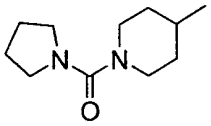
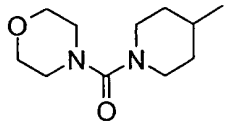
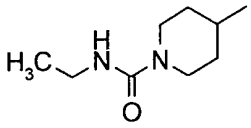
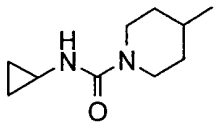
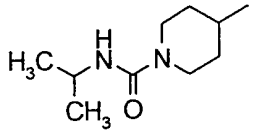
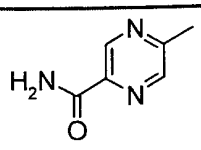


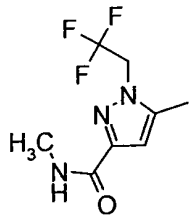
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 2952 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 169,0-173,0 | TriCloridrato |
| 2953 |  | | | |
| 2954 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 210,0-217,0 | Dicloridrato |
| 2955 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 181,0-188,0 | Dicloridrato |
| 2956 |  | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 163,5-167,0 | Cloridrato |
| 2957 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 172,5-176,5 | Cloridrato |
| 2958 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 145,0-151,0 | Dicloridrato |

| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 2959 |  | Pó branco (Etanol/acetato de etila) | 144,0-150,0 | Dicloridrato |

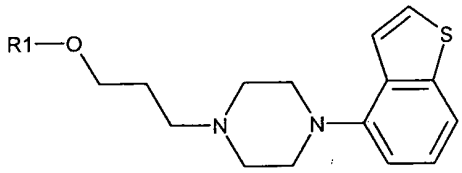
[Tabela 300]

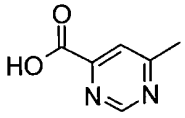
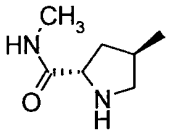
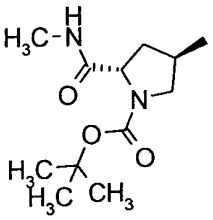


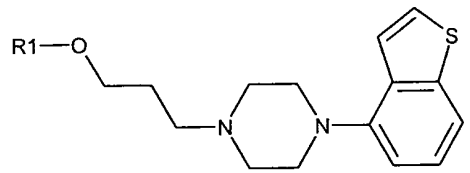
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 2960 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 177-182 | Dicloridrato |
| 2961 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 198-201 | Cloridrato |
| 2962 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 195-200 | Cloridrato |
| 2963 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 215-218 | Cloridrato |
| 2964 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 152-157 | Cloridrato |
| 2965 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 158-161 | Cloridrato |
| 2966 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 168-172 | Cloridrato |
| 2967 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 178,5-181,5 | — |

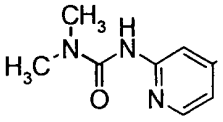
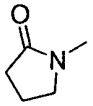
| | | | | |
|---|---|---|---|---|
| 2968 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 228,0 (dec) | Cloridrato |

[Tabela 301]

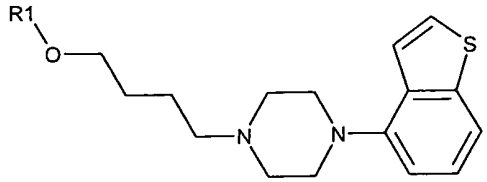


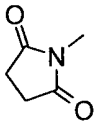
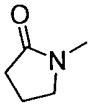
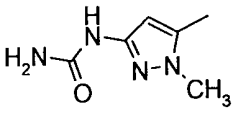
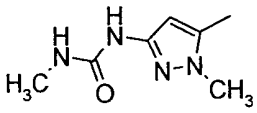
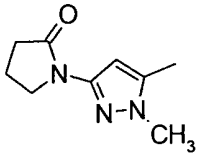
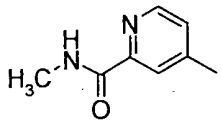
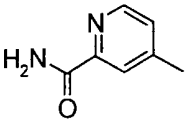
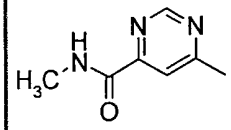
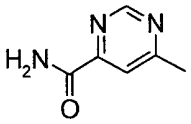
| Exemplo | R1 | RMN | Sal |
|---|---|---|---|
| 2969 |  | RMN-$^1$H (DMSO-d6) δppm: 1,95-2,10 (2H, m), 2,85-2,95 (2H, m), 3,00-3,15 (4H, m), 3,15-3,30 (4H, m), 4,41 (2H, t, J=5,8Hz), 6,89 (1H, d, J=5,0 Hz), 7,15 (1H, s), 7,26 (1H, t, J=7,9Hz), 7,43 (1H, d, J=5,5 Hz), 7,63 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,71 (1H, d, J=5,5 Hz), 8,73 (1H, s). | – |
| 2970 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,72-1,98 (4H, m), 2,30-2,46(1H, m), 2,46-2,58(2H, m), 2,62-2,77 (5H, m), 2,80(3H, d, J=5,1Hz), 3,04-3,29 (5H, m), 3,38-3,55 (2H, m), 3,83-4,04 (2H, m), 6,90 (1H, dd, J=0,5Hz, 7,6Hz ), 7,22-7,34 (1H, m), 7,34-7,47 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz), 7,63(1H, br). | |
| 2971 |  | RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,46 (9H, s), 1,70-1,89 (2H, m), 1,90-2,17(1H, m), 2,44-2,60(2H, m), 2,62-2,75 (4H, m), 2,81(3H, d, J=4,7Hz), 3,09-3,26 (4H, m), 3,39-3,57 (4H, m), 3,93-4,21 (1H, m), 4,21-4,46(1H, m), 6,65-6,95(1H, br), 6,90 (1H, d, J=7,0 Hz), 7,20-7,34 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz). | |



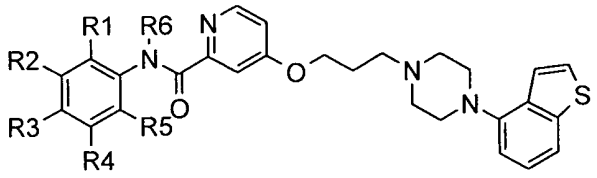
| Exemplo | R1 | MS(M+1) | Sal |
|---|---|---|---|
| 2972 |  | 440 | Cloridrato |
| 2973 |  | 360 | Maleato |

[Tabela 302]



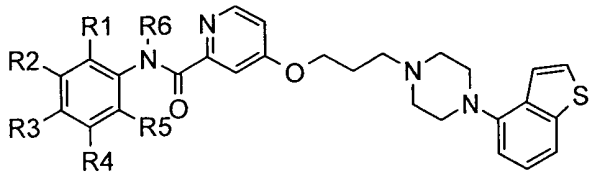
| Exemplo | R1 | Forma do cristal (Solvente de recristalização) | Ponto de fusão (°C) | Sal |
|---|---|---|---|---|
| 2974 |  | Pó branco (Acetato de etila/éter) | 215,5-216,5 | Cloridrato |
| 2975 |  | | | |
| 2976 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 132,5-135,0 | - |
| 2977 |  | Pó branco (2-propanol água) | 180,0-182,0 | - |
| 2978 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 216,0-220,2 | Cloridrato |
| 2979 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 203,0-207,0 | Cloridrato |
| 2980 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 146,5-148,0 | — |
| 2981 |  | Pó branco (Acetato de etila) | 197,0-201,0 | Cloridrato |
| 2982 |  | Pó branco (Acetato de etila/ éter isopropílico) | 133,0-134,5 | — |

[Tabela 303]



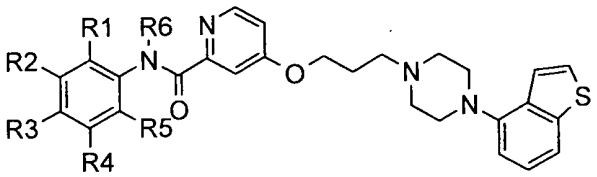

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 2983 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | 517 |
| 2984 | -H | -H | $-CH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | 501 |
| 2985 | -H | -H | -Cl | -H | -H | $-CH_3$ | 521 |
| 2986 | -H | $-SCH_3$ | -H | -H | -H | -H | 519 |
| 2987 | $-SCH_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | 519 |
| 2988 | -H | -Cl | -Cl | -H | -H | -H | 541 |
| 2989 | -H | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | -H | 557 |
| 2990 | -H | -H | -H | -H | -H | -H | 473 |
| 2991 | -H | -H | -Cl | -H | -H | -H | 507 |
| 2992 | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 503 |
| 2993 | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | 503 |
| 2994 | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | 503 |
| 2995 | -Cl | -H | -H | -H | -H | -H | 507 |
| 2996 | -H | -Cl | -H | -H | -H | -H | 507 |
| 2997 | -H | -H | $-CH_3$ | -H | -H | -H | 487 |
| 2998 | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 533 |
| 2999 | $-N(CH_3)_2$ | -H | -H | -H | -H | -H | 516 |
| 3000 | -1-PYRRYL | -H | -H | -H | -H | -H | 538 |
| 3001 | -H | -Cl | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | 537 |
| 3002 | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | $-OCH_3$ | -H | 533 |
| 3003 | -H | $-OCH_3$ | -H | $-OCH_3$ | -H | -H | 533 |
| 3004 | $-OCH_3$ | -H | -H | $-CH_3$ | -H | -H | 517 |
| 3005 | -H | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 533 |
| 3006 | $-C(CH_3)=CH_2$ | -H | -H | -H | -H | -H | 513 |
| 3007 | -H | $-OCF_3$ | -H | -H | -H | -H | 557 |
| 3008 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | 487 |
| 3009 | -H | $-CH_3$ | -H | -H | -H | -H | 487 |
| 3010 | -F | -H | -H | -H | -H | -H | 491 |

[Tabela 304]



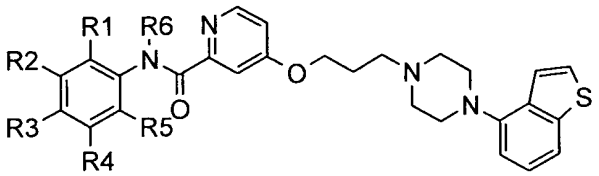

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 3011 | -H | -H | -F | -H | -H | -H | 491 |
| 3012 | -H | $-N(CH_3)_2$ | -H | -H | -H | -H | 516 |
| 3013 | -H | -H | $-N(CH_3)_2$ | -H | -H | -H | 516 |
| 3014 | $-CF_3$ | -H | -H | -H | -H | -H | 541 |
| 3015 | -H | $-CF_3$ | -H | -H | -H | -H | 541 |
| 3016 | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | -H | -H | 530 |
| 3017 | -H | -H | $-NHCOCH_3$ | -H | -H | -H | 530 |
| 3018 | -H | -H | -H | -H | -CN | -H | 498 |
| 3019 | -H | -H | -H | -CN | -H | -H | 498 |
| 3020 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | -H | $-CH_3$ | 501 |
| 3021 | -H | $-CH_3$ | -H | -H | -H | $-CH_3$ | 501 |
| 3022 | -H | -Cl | -H | -H | -H | $-CH_3$ | 521 |
| 3023 | -H | -H | -OH | -H | -H | $-CH_3$ | 503 |
| 3024 | $-CH_3$ | $-CH_3$ | -H | -H | -H | -H | 501 |
| 3025 | $-CH_3$ | -H | $-CH_3$ | -H | -H | -H | 501 |
| 3026 | $-CH_3$ | -H | -H | -H | $-CH_3$ | -H | 501 |
| 3027 | -H | $-CH_3$ | $-CH_3$ | -H | -H | -H | 501 |
| 3028 | -H | $-CH_3$ | -H | $-CH_3$ | -H | -H | 501 |
| 3029 | -F | -F | -H | -H | -H | -H | 509 |
| 3030 | -H | -F | -F | -H | -H | -H | 509 |
| 3031 | -H | -F | -H | -F | -H | -H | 509 |
| 3032 | -H | -F | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 521 |
| 3033 | -H | $-OCH_3$ | $-CH_3$ | -H | -H | -H | 517 |
| 3034 | -H | -Cl | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | 537 |
| 3035 | -H | -Cl | $-CH_3$ | -H | -H | -H | 521 |
| 3036 | $-OCH_3$ | $-OCH_3$ | -H | -H | -H | -H | 533 |
| 3037 | -H | -Cl | -OH | -H | -H | -H | 523 |
| 3038 | -Cl | -H | -H | $-CH_3$ | -H | -H | 521 |

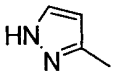
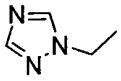
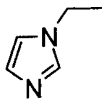
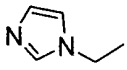
[Tabela 305]



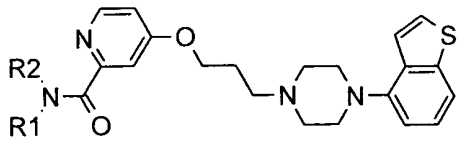

| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 3039 | -H | $-CONH_2$ | -H | -H | -Cl | -H | 550 |
| 3040 | $-CH_3$ | -H | -Br | -H | $-CH_3$ | -H | 579 |
| 3041 | -H | -H | -CN | -H | -H | -H | 498 |
| 3042 | -H | -H | $-SCH_3$ | -H | -H | -H | 519 |
| 3043 | -H | -H | $-CH(CH_3)_2$ | -H | -H | -H | 515 |
| 3044 | -H | -H | -2-FURYL | -H | -H | -H | 539 |

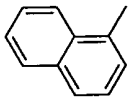
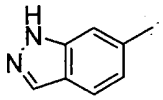
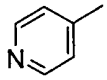
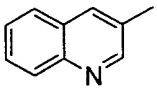
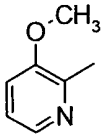
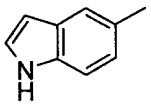
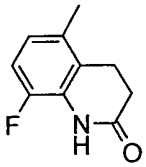
[Tabela 306]



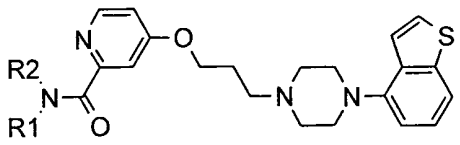
| Exemplo | R1 | R2 | R3 | R4 | R5 | R6 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 3045 | -H |  | -H | -H | -H | -H | 539 |
| 3046 | -H |  | -H | -H | -H | -H | 540 |
| 3047 | -H |  | -H | -H | -H | -H | 542 |
| 3048 | -H | -H |  | -H | -H | -H | 554 |
| 3049 | -H |  | -H | -H | -H | -H | 553 |
| 3050 | -H | -H |  | -H | -H | -H | 553 |
| 3051 | -H |  | -H | -H | -H | -H | 540 |

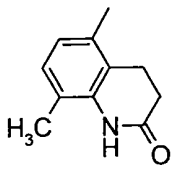
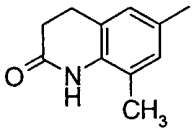
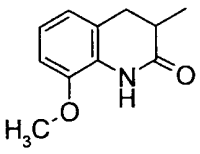
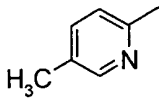
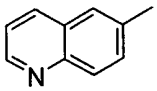
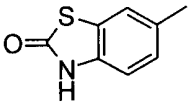
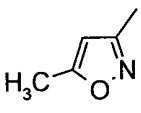
[Tabela 307]



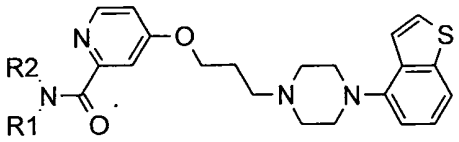
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 3052 |  | -H | 474 |
| 3053 |  | -H | 523 |
| 3054 |  | -H | 513 |
| 3055 |  | -H | 474 |
| 3056 |  | -H | 474 |
| 3057 |  | -H | 524 |
| 3058 |  | -H | 504 |
| 3059 |  | -H | 512 |
| 3060 |  | -H | 560 |

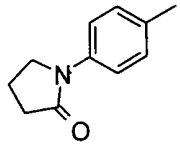
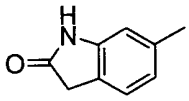
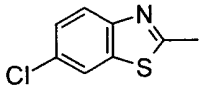
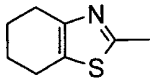
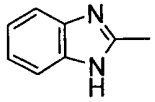
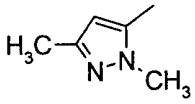
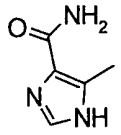
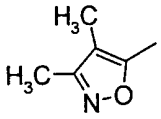
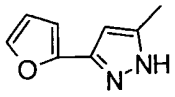
[Tabela 308]



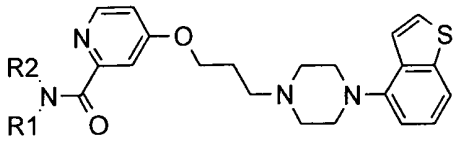
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 3061 |  | -H | 556 |
| 3062 |  | -H | 556 |
| 3063 |  | -H | 572 |
| 3064 |  | -H | 488 |
| 3065 |  | -H | 480 |
| 3066 |  | -H | 524 |
| 3067 |  | -H | 546 |
| 3068 |  | -H | 478 |

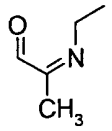
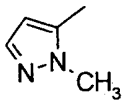
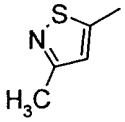
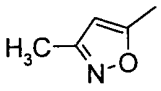
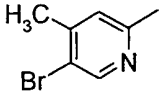
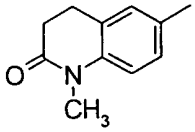
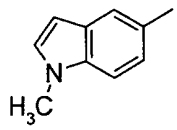
[Tabela 309]



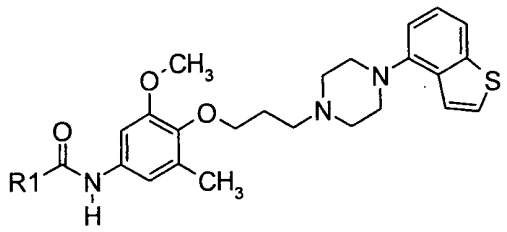
| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 3069 |  | -H | 556 |
| 3070 |  | -H | 528 |
| 3071 |  | -H | 564 |
| 3072 |  | -H | 534 |
| 3073 |  | -H | 513 |
| 3074 |  | -H | 491 |
| 3075 |  | -H | 506 |
| 3076 |  | -H | 492 |
| 3077 |  | -H | 529 |

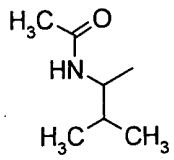
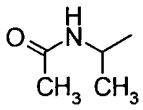
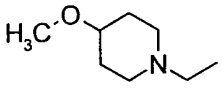
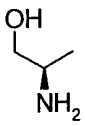
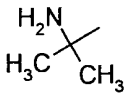
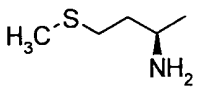
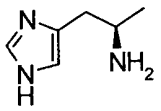
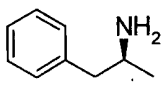
[Tabela 310]



| Exemplo | R1 | R2 | MS(M+1) |
|---|---|---|---|
| 3078 |  | -H | 480 |
| 3079 |  | -H | 477 |
| 3080 |  | -H | 494 |
| 3081 |  | -H | 464 |
| 3082 |  | -H | 478 |
| 3083 |  | -H | 566 |
| 3084 |  | -H | 556 |
| 3085 |  | -H | 526 |

[Tabela 311]



| Exemplo | R1 | MS(M+1) |
|---|---|---|
| 3086 |  | 553 |
| 3087 |  | 525 |
| 3088 |  | 567 |
| 3089 |  | 499 |
| 3090 |  | 497 |
| 3091 |  | 543 |
| 3092 |  | 549 |
| 3093 |  | 559 |

Exemplo 3094

Síntese de 3-amino-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-N-etil-benzamida

Carbono em paládio 5 % (0,8 g) foi adicionado a uma solução

de etanol (30 mL) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-N-etil-3-nitrobenzamida (1,0 g, 2,1 mmol) e a mistura foi submetida a redução catalítica em temperatura ambiente em pressão normal. O catalisador foi removido por filtração e o filtrado foi concentrado em baixa pressão. Água foi adicionada ao resíduo e a solução foi extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de sódio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: metanol = 30:1 → 20:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão para obter 3-amino-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-N-etil-benzamida (0,78 g, 83 % de rendimento) na forma de um sólido amarelo amorfo.

RMN-$^1$H ($CDCl_3$ ) δppm: 1,23 (3H, t, J=7,4 Hz), 2,00-2,15 (2H, m), 2,67 (2H, t, J=7,3 Hz), 2,75 (4H, brs), 3,21 (4H, brs), 3,40-3,50 (2H, m), 3,50-4,30 (2H, br), 4,13 (2H, t, J=6,5 Hz), 5,99 (1H, brs), 6,80 (1H, d, J=8,4 Hz), 6,90 (1H, d, J=7,6 Hz), 7,08 (1H, dd, J=2,1, 8,3 Hz), 7,19 (1H, d, J=2,1 Hz), 7,25-7,30 (1H, m), 7,35-7,45 (2H, m), 7,55 (1H, d, J=8,0 Hz).

Exemplo 3095

Síntese de cloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(1-acetil piperidin-4-ilóxi)propil]piperazina

Trietil amina (0,28 mL, 2,0 mmol) foi adicionado a uma solução de diclorometano (15 mL) de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(piperidin-4-ilóxi)-propil]-piperazina (0,45 g, 1,25 mmol) e a mistura foi resfriada em um banho de gelo. A isto, cloreto de acetila (0,1 mL, 1,4 mmol) foi adicionado e a mistura foi agitada em temperatura ambiente durante toda a noite. Água foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com diclorometano. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de sódio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: metanol = 30:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão. Ao resíduo, solução de cloridrato 0,5 N-

metanol (3 mL) foi adicionada. O cristal produzido foi obtido por filtração e seco para obter cloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(1-acetil piperidin-4-ilóxi)propil]piperazina na forma de um pó branco (0,36 g, 66 % de rendimento).

Ponto de fusão: 208-210°C

Exemplo 3096

Síntese de cloridrato de 1-[3-(4-Benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]pirrolidina-2,5-diona

PS-trifenil fosfina (3 mmol/g, 1,80 g), azodicarboxilato de diterc-butila (1,27 g, 5,4 mmol) e N-hidroxisuccinimida (510 mg, 4,3 mmol) foram adicionados a uma solução de THF (50 mL) de 3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propanol (1,00 g, 3,6 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 4 horas. A resina foi removida por filtração e o filtrado foi concentrado em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 1:2). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão para obter sólido amorfo branco (762 mg, 47 % de rendimento). 157 mg do sólido amorfo branco foi dissolvido em etanol. À solução, solução de ácido clorídrico 1 N-etanol (0,42 mL) foi adicionado e adicionalmente éter foi adicionado. A solução ainda repousou em um refrigerador. O cristal produzido foi filtrado e seco para obter cloridrato de 1-[3-(4-Benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-pirrolidina-2,5-diona (158 mg) como um pó branco.

Ponto de fusão: 255,0-257,0°C

Exemplo 3097

Síntese de amida do ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]naftaleno-1-carboxílico

Trietil amina (0,24 mL, 1,7 mmol) e cloroformiato de isobutila (0,19 mL, 1,4 mmol) foram adicionados a uma solução de acetonitrila (10 mL) de ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propóxi]-naftaleno-

1-carboxílico (0,52 g, 1,2 mmol) mediante resfriamento em gelo e a mistura foi agitada por 20 minutos. À solução de reação, 28 % de amônia aquosa (0,5 mL) foi adicionada e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 20 minutos. À solução de reação, acetato de etila foi adicionado e a solução foi lavada com água. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 2:1 → 0:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi recristalizado a partir de uma mistura de solvente de acetato de etila-éter diisopropílico para obter amida do ácido 6-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-naftaleno-1-carboxílico (0,27 g, 53 % de rendimento) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão 167,0-169,0°C

Exemplo 3098

Síntese de metil amida do ácido 1-alil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1H-pirazol-3-carboxílico

40 % de solução de metil amina metanol (5 mL) foi adicionado a uma solução de metanol (5 mL) de éster etílico do ácido 1-alil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1H-pirazol-3-carboxílico (0,5 g, 1,1 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 3 dias. A solução foi concentrada em baixa pressão e o resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 5:1 → 0:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi recristalizado a partir de uma mistura de solvente de acetato de etila-éter diisopropílico para obter metilamida do ácido 1-alil-5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1H-pirazol-3-carboxílico (0,32 g, 67 % de rendimento) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão 138,5-140,5°C

Exemplo 3099

Síntese de amida do ácido 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-cicloexanocarboxílico

Amônia aquosa (28 %, 0,5 mL), cloridrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etil carbodiimida (WSC)(0,36 g, 1,9 mmol) e 4-dimetilaminopiridina (DMAP) (0,05 g, 0,4 mmol) foram adicionados a uma solução de diclorometano (10 mL) de ácido 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-cicloexanocarboxílico (0,5 g, 1,2 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 19 horas. À solução de reação, diclorometano foi adicionado e a mistura foi lavada com água. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 3:1 → 0:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi recristalizado a partir de uma mistura de solvente de acetato de etila-éter diisopropílico para obter amida do ácido 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propóxi]-cicloexanocarboxílico (0,1 g, 22 % de rendimento), na forma de um pó branco.

Ponto de fusão 107,5-108,5°C

Exemplo 3100

Síntese de Cloridrato de {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil-fenil}amida do ácido etanossulfônico

Uma solução de diclorometano (4 mL) de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil amina (0,2 g, 0,49 mmol) foi resfriada em gelo. A isto, N-etil diisopropil amina (0,15 mL, 0,87 mmol) e cloreto de etano sulfonila (0,07 mL, 0,73 mmol) foram adicionados e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por uma hora. Adicionalmente, N-etil diisopropil amina (0,15 mL, 0,87 mmol) e cloreto de etano sulfonila (0,07 mL, 0,73 mmol) foram adicionados e a mistura foi

agitada em temperatura ambiente por 19 horas. A isto, uma solução de hidróxido de sódio aquosa 6 N (0,5 mL) e etanol (2 mL) foram adicionados e a mistura foi agitada em temperatura ambiente durante toda a noite. Diclorometano foi adicionado à solução de reação, que foi então lavada com água. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 2:1 → 0:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão. Solução de cloridrato 4 N/acetato de etila foi adicionada ao resíduo. O cristal gerado foi filtrado e seco para obter cloridrato de {4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil-fenil}amida do ácido etanossulfônico (222 mg, 85 % de rendimento) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 235,5-237,5°C

Exemplo 3101

Síntese de éster metílico do ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-carbâmico

Uma solução de diclorometano (2 mL) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il-amina (0,17 g, 0,47 mmol) foi resfriada em gelo. A isto, piridina (0,08 mL, 0,94 mmol) e cloroformiato de metila (0,04 mL, 0,52 mmol) foram adicionados e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 17 horas. À solução de reação, acetato de etila foi adicionado e a mistura de reação foi lavado com água. A camada aquosa foi extraída com acetato de etila. As camadas orgânicas foram combinadas, secas sobre sulfato de magnésio anidro, e daí em diante, concentradas em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 2:1 → 1:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi recristalizado a partir de uma mistura de solvente de acetato de etila-éter diisopropílico para obter éster metílico do ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-

piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}carbâmico (0,10 g, 51 % de rendimento) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 162,5-165,0°C.

Exemplo 3102

Síntese de cloridrato de 3-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-1,1-dimetil-uréia

Uma solução de diclorometano (5 mL) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il-amina (0,27 g, 0,73 mmol) foi resfriada em gelo. A isto, trietil amina (0,36 mL, 2,5 mmol), cloreto de dimetil carbamoíla (0,20 mL, 2,1 mmol) e piridina (0,06 mL, 0,73 mmol) foram adicionados e a mistura foi agitada em temperatura ambiente durante toda a noite. À solução de reação, água foi adicionada e a solução de reação foi extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 3:1 → 0:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em acetato de etila e uma solução de cloridrato 4 N/acetato de etila foi adicionada a ele. O cristal produzido foi filtrado e seco para obter cloridrato de 3-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-1,1-dimetil-uréia (0,10 g, 30 % de rendimento), na forma de um pó amarelo claro.

Ponto de fusão: 174,0-176,5°C

Exemplo 3103

Síntese de cloridrato de 3-{5-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-1,1-dimetil-uréia

Uma solução de dimetilamina aquosa (50 %, 0,16 mL, 1,6 mmol) foi adicionada a uma solução de DMF (3 mL) de éster fenílico do ácido 5-[4-(4-Benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il carbâmico (0,26 g, 0,52 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura

ambiente por 16 horas. Água foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 7:3 → 0:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em acetato de etila. Uma solução de ácido clorídrico 1 N/etanol foi adicionada e o cristal produzido foi filtrado e seco para obter cloridrato de 3-{5-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-1,1-dimetil-uréia (95 mg, 37 % de rendimento) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 186,0-187,5°C

Exemplo 3104

Síntese de N-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-acetamida

Anidreto acético (1 mL) e trietil amina (0,09 mL, 0,65 mmol) foram adicionados a uma solução de diclorometano (4 mL) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il-amina (0,20 g, 0,54 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 6 horas. Uma solução de carbonato de potássio aquosa foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 2:1 → 0:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi recristalizado a partir de uma mistura de solvente de acetato de etila-éter diisopropílico para obter N-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}acetamida (0,19 g, 89 % de rendimento) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 137,0-139,0°C

Exemplo 3105

Síntese de cloridrato de 3-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-hidroximetil-5-metóxi-fenil}oxazolidin-2-ona

Primeiramente, cloridrato de 2-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-(2-oxo-oxazolidin-3-il)benzaldeído (1,28 g. 2,4 mmol)) foi adicionado a uma solução de cloridrato de potássio aquosa. A mistura foi extraída com diclorometano. A solução extraída foi concentrada em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em THF (15 mL). À solução, boroidreto de sódio (0,05 g, 1,2 mmol) foi adicionado mediante resfriamento em gelo e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 3 horas. Então, ácido clorídrico 10 % foi adicionado à mistura mediante resfriamento em gelo para decompor o reagente excessivamente presente. Em seguida, uma solução de hidróxido de sódio aquosa 6 N foi adicionada à solução para torná-la uma solução alcalina, que foi então extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: acetato de etila = 3:7 → diclorometano: metanol = 100:3). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em etanol. Uma solução de ácido clorídrico 1 N/etanol foi adicionada a isto. O cristal produzido foi recristalizado a partir de etanol para obter cloridrato de 3-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propóxi]-3-hidroximetil-5-metóxi-fenil}oxazolidin-2-ona (0,52 g, 41 % de rendimento) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 224,0-226,5°C (decomposto)

Exemplo 3106

Síntese de Cloridrato de 1-acetil-4-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}piperazina

Cloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-bromo-2-metóxi-6-metilafenóxi)propil]piperazina (0,5 g, 0,98 mmol), 1-acetil piperazina (0,15 g, 1,2 mmol), acetato de paládio (11 mg, 0,048 mmol), 2,2'-bis(difenil fosfina)-

1,1'-binaftil(BINAP)(63 mg, 0,098 mmol) e t-butóxido de sódio (0,23 g, 2,3 mmol) foram adicionados a tolueno (10 mL) e a mistura foi agitada em uma atmosfera de argônio a 90 °C por 22 horas. A mistura de reação foi resfriada para temperatura ambiente e filtrada em celite. A torta do filtro foi lavada com acetato de etila. O filtrado e o líquido de lavagem foram combinados e daí em diante concentrados em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 11:1 → 1:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em acetato de etila. Uma solução de ácido clorídrico 1 N/etanol foi adicionada a isto e o cristal produzido foi filtrado e seco para obter cloridrato de 1-acetil-4-{4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metil fenil}-piperazina (75 mg, 14 % de rendimento) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 257,0-261,0 °C (decomposto)

Exemplo 3107

Síntese de dicloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-imidazol-1-il-2-metóxi-6-metil-fenóxi)-propil]-piperazina

1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-iodo-2-metóxi-6-metil-fenóxi)-propil]-piperazina (0,6 g, 0,69 mmol), imidazol (0,07 g, 1,03 mmol), iodeto de cobre (I) (13 mg, 0,069 mmol), trans-N,N'-dimetil-1,2-cicloexanodiamina (0,02 mL, 0,14 mmol) e carbonato de césio (0,47 g, 1,38 mmol) foram adicionados a 1,4-dioxano (6 mL) e a mistura foi refluxada com aquecimento em uma atmosfera de argônio por 50 horas. Depois que a mistura de reação resultante foi resfriada para temperatura ambiente, água foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 5:1 → 1:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em

acetato de etila. Uma solução de ácido clorídrico 1 N/etanol foi adicionada a isto e o cristal produzido foi filtrado e seco para obter dicloridrato de 1-benzo[b]tiofen-4-il-4-[3-(4-imidazol-1-il-2-metóxi-6-metilafenóxi)propil]-piperazina (60 mg, 17 % de rendimento) na forma de um pó amarelo claro.

Ponto de fusão: 234,0-240,0°C (decomposto).

Exemplo 3108

Síntese de cloridrato de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3,N-dimetil-5-(2,2,2-trifluoretóxi)benzamida

Carbonato de césio (0,34 g, 0,99 mmol) e 1,1,1-triflúor-2-iodoetano (0,05 mL, 0,47 mmol) foram adicionados a uma solução de DMF (2 mL) de 4-[3-(4-Benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-hidróxi-5,N-dimetil benzamida (188 mg, 0,39 mmol), e a mistura foi agitada a 40 °C por 2 horas. Então, 1,1,1-triflúor-2-iodoetano (0,1 mL, 0,94 mmol) foi adicionalmente adicionado e a mistura foi agitada a 40 °C por 5 horas. Depois que a mistura de reação foi resfriada para temperatura ambiente, água foi adicionada à solução de reação, que foi então extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel básica (n-hexano: acetato de etila = 3:1 → 0:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em álcool isopropílico. Uma solução de ácido clorídrico 1 N/etanol foi adicionada a isto e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi recristalizado a partir de uma mistura de solvente de álcool isopropílico/acetato de etila para obter cloridrato de 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3,N-dimetil-5-(2,2,2-triflúor-etóxi)benzamida

(88 mg, 40 % de rendimento) na forma de um pó amarelo claro.

Ponto de fusão: 156,0-157,5°C

Exemplo 3109

Síntese de cloridrato de 1-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}-etanona

Cloridrato de metóxi metilamida do ácido 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxílico (0,61 g, 1,3 mmol) foi adicionado a uma solução aquosa de hidróxido de sódio e a mistura de solução foi extraída com diclorometano. A solução extraída foi concentrada em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em THF (12 mL). A solução foi resfriada para -78 °C e solução de éter de metil lítio 1 N (1,2 mL) foi adicionada a ela e a mistura foi agitada na mesma temperatura por 2 horas. À solução de reação, uma solução aquosa de cloreto de amônio foi adicionada e a solução foi aquecida para temperatura ambiente. Cloreto de potássio foi adicionado à solução, que foi então extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: acetato de etila = 3:1 → 0:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi dissolvido em etanol. Solução de ácido clorídrico 1 N/etanol foi adicionada a isto e o cristal produzido foi recristalizado a partir de etanol contendo água para obter cloridrato de 1-{5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-1-metil-1H-pirazol-3-il}etanona (0,22 g, 40 % de rendimento) na forma de um pó branco.

Ponto de fusão: 245,0 °C (decomposto)

Exemplo 3110

Síntese de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-l-il)propóxi]-3-hidroximetil-1-metil-1H pirazol

Uma solução de THF (8 mL) de 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)propóxi]-3-(terc-butil-dimetil silanilóximetil)-1-metil-1H-pirazol (0,75 g, 1,5 mmol) foi resfriada em gelo e uma solução de THF 1 M de fluoreto de tetrabutil amônio (1,7 mL) foi adicionada a ela. A mistura foi

agitada em temperatura ambiente por 16 horas. Acetato de etila foi adicionado à solução de reação, que foi lavada com água. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e daí em diante concentrada em baixa pressão. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (diclorometano: metanol = 1:0 → 30:1 →15:1). O produto purificado foi concentrado em baixa pressão e o resíduo foi recristalizado a partir de uma mistura de solvente de acetato de etila e éter diisopropílico para obter 5-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)-propóxi]-3-hidroximetil-1-metil-1H-pirazol (0,46 g, 79 % de rendimento) na forma de um pó branco.

Temperatura de fusão: 123,5-126,0 °C

Teste farmacológico 1

1) Ensaio de ligação ao receptor de dopamina $D_2$

O ensaio foi realizado de acordo com o método por Kohler et al. (Kohler C, Hall H, Ogren SO e Gawell L, Specific in vitro and in vivo binding of 3H-racloprida. A potent substituted benzamide drug with high affinity for dopamina D-2 receptors in o rat brain. Biochem. Pharmacol., 1985; 34: 2251-2259).

Ratos Wistar machos foram decaptados, o cérebro foi reparado imediatamente e corpo estriado foi retirado. Ele foi homogeneizado em tampão tris(hidroximetil)aminometano (Tris) 50 mM-ácido clorídrico (pH 7,4) de um volume 50 vezes do peso do tecido usando um homogeneizador com uma paleta de alta velocidade de rotação, e centrifugado a 4 °C, 48.000 × g por 10 minutos. O precipitado obtido foi suspenso novamente no tampão descrito anteriormente de um volume 50 vezes do peso do tecido e depois incubado a 37 °C por 10 minutos, centrifugado na condição descrita anteriormente. O precipitado obtido foi suspenso em tampão (Tris) 50 mM-ácido clorídrico (contendo NaCl 120 mM, KCl 5 mM, $CaCl_2$ 2 mM, $MgCl_2$ 1 mM, pH 7,4) de um volume 25 vezes do peso do tecido e conservado por congelamento a -85 °C até que ele foi usado para ensaio de ligação como um

corpo de prova de membrana.

O ensaio de ligação foi realizado usando 40 mL do corpo de prova de membrana, 20 mL de [$^3$H]-racloprida (concentração final 1 a 2 nM), 20 mL de um medicamento teste e tampão Tris 50 mM-ácido clorídrico (contendo NaCl 120 mM, KCl 5 mM, $CaCl_2$ 2 mM, $MgCl_2$ 1 mM, pH 7,4) de maneira que a quantidade total fosse 200 μL (concentração final de sulfóxido de dimetila 1%). A reação foi realizada em temperatura ambiente por 1 hora e finalizada conduzindo filtração por sucção com um colheitador de célula em uma placa de filtro de fibra de vidro. A placa de filtro feita de fibra de vidro foi lavada com tampão Tris 50 mM-ácido clorídrico (pH 7,4), e em seguida seca, um coquetel de cintilação líquida de microplaca foi adicionado e a radioatividade foi medida com um contador de cintilação de microplaca. Radioatividade na presença de (+)-cloridrato de butaclamol 10 mM foi adotada como ligação não específica.

Valor $IC_{50}$ foi calculado a partir de reação dependente da concentração usando um programa de análise não linear. Valor de Ki foi calculado a partir de Valor de $IC_{50}$ usando fórmula de Cheng-Prussoff. Os resultados estão apresentados na seguinte tabela 312.

[Tabela 312]

| Teste de ligação ao receptor de dopamina D2 | |
|---|---|
| Composto de teste | Ki (nM) |
| Composto do exemplo 3 | 1,5 |
| Composto do exemplo 4 | 1,9 |
| Composto do exemplo 6 | 0,7 |
| Composto do exemplo 7 | 0,8 |
| Composto do exemplo 11 | 0,2 |
| Composto do exemplo 14 | 0,3 |
| Composto do exemplo 15 | 0,4 |
| Composto do exemplo 17 | 0,6 |
| Composto do exemplo 26 | 2,6 |
| Composto do exemplo 27 | 1,5 |
| Composto do exemplo 32 | 2,5 |
| Composto do exemplo 40 | 3,1 |
| Composto do exemplo 48 | 2,3 |
| Composto do exemplo 58 | 2,0 |
| Composto do exemplo 61 | 5,0 |
| Composto do exemplo 62 | 1,6 |
| Composto do exemplo 72 | 3,4 |

| | |
|---|---|
| Composto do exemplo 73 | 1,3 |
| Composto do exemplo 76 | 2,5 |
| Composto do exemplo 80 | 1,6 |
| Composto do exemplo 94 | 2,4 |
| Composto do exemplo 95 | 1,9 |
| Composto do exemplo 112 | 1,0 |
| Composto do exemplo 115 | 1,6 |
| Composto do exemplo 121 | 1,1 |
| Composto do exemplo 123 | 0,7 |
| Composto do exemplo 125 | 2,0 |
| Composto do exemplo 127 | 0,4 |
| Composto do exemplo 133 | 0,3 |
| Composto do exemplo 144 | 0,4 |
| Composto do exemplo 146 | 0,1 |
| Composto do exemplo 160 | 0,4 |
| Composto do exemplo 169 | 0,9 |
| Composto do exemplo 170 | 1,0 |
| Composto do exemplo 186 | 1,3 |
| Composto do exemplo 190 | 1,2 |
| Composto do exemplo 232 | 1,1 |
| Composto do exemplo 241 | 0,4 |
| Composto do exemplo 243 | 0,2 |
| Composto do exemplo 252 | 0,3 |
| Composto do exemplo 271 | 1,2 |

Continuou

[Tabela 312]

| Teste de ligação ao receptor de dopamina D2 | |
|---|---|
| Composto de teste | Ki (nM) |
| Composto do exemplo 281 | 0,3 |
| Composto do exemplo 286 | 0,2 |
| Composto do exemplo 301 | 0,2 |
| Composto do exemplo 303 | 1,0 |
| Composto do exemplo 307 | 0,3 |
| Composto do exemplo 313 | 0,7 |
| Composto do exemplo 314 | 0,8 |
| Composto do exemplo 323 | 1,5 |
| Composto do exemplo 340 | 1,9 |
| Composto do exemplo 343 | 0,9 |
| Composto do exemplo 345 | 1,6 |
| Composto do exemplo 354 | 0,2 |
| Composto do exemplo 358 | 0,2 |
| Composto do exemplo 359 | 0,2 |
| Composto do exemplo 363 | 2,0 |
| Composto do exemplo 368 | 0,4 |
| Composto do exemplo 382 | 0,5 |
| Composto do exemplo 394 | 3,8 |
| Composto do exemplo 453 | 0,9 |
| Composto do exemplo 462 | 0,4 |
| Composto do exemplo 546 | 0,6 |
| Composto do exemplo 650 | 1,2 |
| Composto do exemplo 706 | 1,0 |
| Composto do exemplo 802 | 0,6 |
| Composto do exemplo 1014 | 3,3 |
| Composto do exemplo 1016 | 2,2 |
| Composto do exemplo 1026 | 1,9 |
| Composto do exemplo 1027 | 1,9 |

| | |
|---|---|
| Composto do exemplo 1034 | 2,1 |
| Composto do exemplo 1059 | 0,4 |
| Composto do exemplo 1060 | 0,1 |
| Composto do exemplo 1061 | 0,1 |
| Composto do exemplo 1071 | 0,1 |
| Composto do exemplo 1076 | 1,2 |
| Composto do exemplo 1079 | 0,4 |
| Composto do exemplo 1080 | 0,6 |
| Composto do exemplo 1083 | 0,3 |
| Composto do exemplo 1084 | 0,1 |
| Composto do exemplo 1086 | 1,0 |

Continuou

[Tabela 312]

| Teste de ligação ao receptor de dopamina D2 | |
|---|---|
| Composto de teste | Ki (nM) |
| Composto do exemplo 1087 | 0,3 |
| Composto do exemplo 1089 | 1,0 |
| Composto do exemplo 1106 | 1,0 |
| Composto do exemplo 1110 | 1,2 |
| Composto do exemplo 1113 | 0,7 |
| Composto do exemplo 1138 | 1,4 |

2) Ensaio de ligação ao receptor de serotonina 5-HT2A

O ensaio foi realizado de acordo com o método por Leysen JE et al. (Leysen JE, Niemegeers CJE, Van Nueten JM e Laduron PM. [3H] Ketanserin (R 41 468), a selective 3H-ligand for serotonin 2 receptor binding sites. Mol. Pharmacol., 1982, 21: 301-314).

Ratos Wistar machos foram decaptados, o cérebro foi reparado imediatamente e o córtex frontal foi retirado. Ele foi homogeneizado em sacarose 0,25 M de um volume 10 vezes do peso do tecido usando um homogeneizador de vidro de Teflon, e centrifugado a 4 °C, 1.000 × g por 10 minutos. O sobrenadante obtido foi transferido para um outro tubo de centrífuga e suspenso em sacarose 0,25 M de um volume 5 vezes do peso do tecido e o precipitado foi centrifugado na condição descrita anteriormente. O sobrenadante obtido foi combinado com o sobrenadante obtido anteriormente e adjustado para um volume 40 vezes do peso do tecido com tampão Tris 50

mM-ácido clorídrico (pH 7,4), e centrifugado a 4 °C, 35.000 × g por 10 minutos. O precipitado obtido foi suspenso novamente no tampão descrito anteriormente de um volume 40 vezes do peso do tecido e centrifugado na condição descrita anteriormente. O precipitado obtido foi suspenso no tampão descrito anteriormente de um volume 20 vezes do peso do tecido e conservado por congelamento a -85 °C até que ele fosse usado para ensaio de ligação como um corpo de prova de membrana.

O ensaio de ligação foi realizado usando 40 mL do corpo de prova de membrana, 20 mL de [$^3$H]-Ketanserina (concentração final 1 a 3 nM), 20 mL de um medicamento teste e tampão Tris 50 mM-ácido clorídrico (pH 7,4) de maneira que a quantidade total foi 200 µL (concentração final de sulfóxido de dimetila 1%). A reação foi realizada a 37 °C por 20 minutos e finalizada conduzindo filtração por sucção com um colheitador de célula em uma placa de filtro de fibra de vidro.

A placa de filtro feita de fibra de vidro foi lavada com tampão Tris 50 mM-ácido clorídrico (pH 7,4), e em seguida seca, um coquetel de cintilação líquida de microplaca foi adicionado e a radioatividade foi medida com um contador de cintilação de microplaca. Radioatividade na presença de espiperona 10 µM foi adotada como ligação não específica.

Valor $IC_{50}$ foi calculado a partir de reação dependente da concentração usando um programa de análise não linear. Valor de Ki foi calculado a partir do valor de $IC_{50}$ usando fórmula de Cheng-Prussoff. Os resultados estão apresentados na seguinte tabela 313

[Tabela 313]

| Teste de ligação ao receptor de serotonina 5-HT2A | |
|---|---|
| Composto de teste | Ki (nM) |
| Composto do exemplo 3 | 6,0 |
| Composto do exemplo 4 | 7,7 |
| Composto do exemplo 6 | 3,3 |
| Composto do exemplo 7 | 2,9 |
| Composto do exemplo 11 | 4,4 |
| Composto do exemplo 14 | 2,4 |
| Composto do exemplo 15 | 5,9 |

| | |
|---|---|
| Composto do exemplo 17 | 3,4 |
| Composto do exemplo 26 | 0,8 |
| Composto do exemplo 27 | 1,0 |
| Composto do exemplo 32 | 1,4 |
| Composto do exemplo 40 | 0,6 |
| Composto do exemplo 48 | 3,8 |
| Composto do exemplo 58 | 4,9 |
| Composto do exemplo 61 | 4,9 |
| Composto do exemplo 62 | 4,7 |
| Composto do exemplo 72 | 3,4 |
| Composto do exemplo 73 | 5,6 |
| Composto do exemplo 76 | 1,7 |
| Composto do exemplo 80 | 3,3 |
| Composto do exemplo 94 | 2,0 |
| Composto do exemplo 95 | 2,3 |
| Composto do exemplo 112 | 0,7 |
| Composto do exemplo 115 | 3,7 |
| Composto do exemplo 121 | 1,5 |
| Composto do exemplo 123 | 1,4 |
| Composto do exemplo 125 | 3,9 |
| Composto do exemplo 127 | 2,4 |
| Composto do exemplo 133 | 4,7 |
| Composto do exemplo 144 | 1,4 |
| Composto do exemplo 146 | 2,4 |
| Composto do exemplo 160 | 0,6 |
| Composto do exemplo 169 | 2,6 |
| Composto do exemplo 170 | 3,3 |
| Composto do exemplo 186 | 2,0 |
| Composto do exemplo 190 | 0,6 |
| Composto do exemplo 232 | 2,7 |
| Composto do exemplo 241 | 0,7 |
| Composto do exemplo 243 | 0,5 |
| Composto do exemplo 252 | 0,3 |
| Composto do exemplo 271 | 0,6 |

continuou

[Tabela 313]

| Teste de ligação ao receptor de serotonina 5-HT2A | |
|---|---|
| Composto de teste | Ki (nM) |
| Composto do exemplo 281 | 0,6 |
| Composto do exemplo 286 | 0,8 |
| Composto do exemplo 301 | 0,4 |
| Composto do exemplo 303 | 2,5 |
| Composto do exemplo 307 | 0,7 |
| Composto do exemplo 313 | 1,1 |
| Composto do exemplo 314 | 0,8 |
| Composto do exemplo 323 | 0,7 |
| Composto do exemplo 340 | 4,8 |
| Composto do exemplo 343 | 0,5 |

| | |
|---|---|
| Composto do exemplo 345 | 1,9 |
| Composto do exemplo 354 | 0,6 |
| Composto do exemplo 358 | 1,1 |
| Composto do exemplo 359 | 1,1 |
| Composto do exemplo 363 | 1,1 |
| Composto do exemplo 368 | 0,7 |
| Composto do exemplo 382 | 0,6 |
| Composto do exemplo 394 | 4,7 |
| Composto do exemplo 453 | 1,2 |
| Composto do exemplo 462 | 1,7 |
| Composto do exemplo 546 | 0,7 |
| Composto do exemplo 650 | 0,6 |
| Composto do exemplo 706 | 0,9 |
| Composto do exemplo 802 | 1,4 |
| Composto do exemplo 1014 | 4,2 |
| Composto do exemplo 1016 | 2,3 |
| Composto do exemplo 1026 | 3,5 |
| Composto do exemplo 1027 | 2,0 |
| Composto do exemplo 1034 | 3,1 |
| Composto do exemplo 1059 | 3,8 |
| Composto do exemplo 1060 | 1,2 |
| Composto do exemplo 1061 | 1,2 |
| Composto do exemplo 1071 | 1,3 |
| Composto do exemplo 1076 | 12,4 |
| Composto do exemplo 1079 | 2,8 |
| Composto do exemplo 1080 | 3,4 |
| Composto do exemplo 1083 | 1,5 |
| Composto do exemplo 1084 | 1,4 |
| Composto do exemplo 1086 | 5,8 |
| Composto do exemplo 1087 | 2,6 |
| Composto do exemplo 1089 | 13,9 |

continuou

[Tabela 313]

| Teste de ligação ao receptor de serotonina 5-HT2A | |
|---|---|
| Composto de teste | Ki (nM) |
| Composto do exemplo 1106 | 7,1 |
| Composto do exemplo 1110 | 4,9 |
| Composto do exemplo 1113 | 5,0 |
| Composto do exemplo 1138 | 19,7 |

3) Ensaio de ligação ao receptor de adrenalina α1

O ensaio foi realizado de acordo com o método por Gro& G et al. (Gro& G, Hanft G e Kolassa N. Urapidil e some analogues with hypotensive properties show high affinities for 5-hidroxytryptamine (5-HT) binding sites of the 5-HT1A subtype and for αl-adrenoceptor binding sites.

Naunyn-Schmiedeberg's Arch Pharmacol., 1987, 336: 597-601).

Ratos Wistar machos foram decaptados, o cérebro foi reparado imediatamente e córtex cerebral foi retirado. Ele foi homogeneizado em tampão Tris 50 mM-ácido clorídrico (NaCl 100 mM, contendo tetraacetato de diidrogeno disódio etileno diamina 2 mM, pH 7,4) de um volume 20 vezes do peso do tecido usando um homogeneizador com uma paleta de alta velocidade de rotação, e centrifugado a 4 °C, 80.000 × g por 20 minutos. O precipitado obtido foi suspenso no tampão descrito anteriormente de um volume 20 vezes do peso do tecido e depois incubado a 37 °C por 10 minutos, centrifugado na condição descrita anteriormente. O precipitado obtido foi suspenso novamente no tampão descrito anteriormente de um volume 20 vezes do peso do tecido e centrifugado na condição descrita anteriormente. O precipitado obtido foi suspenso em tampão (Tris) 50 mM-ácido clorídrico (contendo tetraacetato de diidrogeno disódio etileno diamina 1 mM, pH 7,4) de um volume 20 vezes do peso do tecido e conservado por congelamento a -85 °C até que ele fosse usado para ensaio de ligação como um corpo de prova de membrana.

O ensaio de ligação foi realizado usando 40 mL do corpo de prova de membrana, 20 mL de [$^3$H]-prazosina (concentração final 0,2 a 0,5 nM), 20 mL de um medicamento teste e tampão Tris 50 mM-ácido clorídrico (contendo EDTA 1 mM, pH 7,4) de maneira que a quantidade total foi 200 μL (concentração final de sulfóxido de dimetila 1 %). A reação foi realizada a 30 °C por 45 minutos e finalizada conduzindo filtração por sucção com um colheitador de célula em uma placa de filtro de fibra de vidro.

A placa de filtro feita de fibra de vidro foi lavada com tampão Tris 50 mM-ácido clorídrico (pH 7,4), e em seguida seca, um coquetel de cintilação líquida de microplaca foi adicionado e a radioatividade foi medida com um contador de cintilação de microplaca. Radioatividade na presença de cloridrato de fentolamina 10 μM foi adotada como ligação não específica.

Valor $IC_{50}$ foi calculado a partir de reação dependente da concentração usando um programa de análise não linear. Valor de Ki foi calculado a partir do valor de $IC_{50}$ usando fórmula de Cheng-Prussoff.

Teste farmacológico 2

Atividade agonística parcial no receptor de dopamina D2 usando células de expressão de receptor D2

Atividade agonística parcial no receptor de dopamina D2 foi avaliada determinando quantitativamente o efeito inibitório da produção de AMP cíclico de um composto de teste nas células de expressão de receptor D2 de dopamina em que a produção de monofosfato de adenosina 3',5'-cíclica (AMP cíclico) foi induzida por estímulo da forscolina.

Células de ovário/DHFR(-) de hamster chinês que expressam o receptor D2 de dopamina recombinante humano foram cultivadas em uma condição de meio de cultura (Meio de Dulbecco modificado de Iscove (meio de cultura IMDM), soro bovino fetal 10 %, Penincilina 50 I.U./mL, estreptomicina 50 μg/mL, geneticina 200 μg/mL, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 μM) a 37 °C e dióxido de carbono 5 %. Células foram semeadas a $10^4$ células/poço em um placa de microtitulação de 96 poços revestida com poli-L-lisina e cresceram na mesma condição por 2 dias. Cada poço foi lavado com 100 mL de um meio de cultura (meio de cultura IMDM, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 mM). O meio de cultura foi substituído com 50 mL de meio de cultura (meio de cultura IMDM, ascorbato de sódio 0,1%, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 mM) tendo dissolvido nele 3 μM de um composto de teste. Depois da incubação a 37 °C, condição de dióxido de carbono 5 % por 20 minutos, o meio de cultura foi substituído com 100 mL de meio de cultura estimulativo de forscolina (meio de cultura IMDM, ascorbato de sódio 0,1 %, hipoxantina sódica 0,1 mM, timidina 16 mM, forscolina 10 mM, 3-isobutil-1-metil xantina 500 μM) tendo 3 μM do composto de teste dissolvido nele e incubado a 37 °C, condição de dióxido de carbono 5 % por

10 minutos. Depois que o meio de cultura foi removido, 200 mL de solução aquosa de Lysis 1B (Amersham Bioscience, reagente anexado ao sistema de imunoensaio de enzima biotrack de AMP cíclico) foi dispensado e agitado por 10 minutos. A solução aquosa de cada poço foi usada como uma amostra para a medição. Amostras para a medição quadruplamente diluídas foram submetidas a medição da quantidade de AMP cíclico usando o sistema de imunoensaio de enzima descrito anteriormente. Razão de inibição do respectivo composto de teste foi calculada assumindo que a quantidade de AMP cíclico do poço ao qual nenhum composto de teste foi adicionado foi 100 %. Neste sistema de teste empírico, dopamina que foi usada como um medicamento controle suprimida da quantidade de AMP cíclico a cerca de 10 % como a atividade máxima.

Confirmou-se que compostos de teste tinham atividade agonística parcial para receptor de dopamina $D_2$ no teste descrito anteriormente.

Uma vez que os compostos de teste têm atividade agonística parcial para receptor de dopamina $D_2$, eles podem estabilizar a neurotransmissão de dopamina para uma condição normal em um paciente com esquizofrenia e conseqüentemente, apresentam, por exemplo, efeito de melhora da condição positivo e negativo, efeito de melhora na falha cognitiva e os efeitos de melhora em outros sintomas sem causar efeitos colaterais.

Teste farmacológico 3

Efeito inibitório no comportamento estereotipado induzido por apomorfina em ratos

Ratos Wistar (macho, seis-sete semanas de vida, Japan SLC, Inc.) foram usadso como animais de teste. Um composto de teste foi suspenso em goma arábica 5 %/(salina fisiológica ou água) usando um almofariz de ágata e foi diluído com o mesmo solvente se necessário.

Animais de teste foram jejuados durante toda a noite do dia

anterior. Apomorfina (0,7 mg/kg) foi subcutaneamente administrada (1 mL/kg) 1 hora depois que cada composto de teste foi oralmente administrado (5 mL/kg). Comportamento estereotipado foi observado por 1 minuto respectivamente 20, 30 e 40 minutos depois da injeção de apomorfina.

O comportamento estereotipado de cada animal foi quantificado de acordo com a seguinte condição e pontuação feita em três pontos foram somadas e o efeito anti-apomorfina foi avaliado. Seis animais de teste foram usados para cada grupo.

0: A aparência dos animais é a mesma que ratos tratados com salina;

1: Farejada descontínua, atividade exploratória constante;

2: Farejada contínua, atividade exploratória periódica;

3: Farejada contínua, mordida descontínua, roedura ou lambida. Períodos muito curtos de atividade locomotora;

4: Mordida contínua, roedura ou lambida; nenhuma atividade exploratória.

Sistema de análise estatística não clínica foi usado para todo processamento estatístico. Quando o valor de probabilidade de significância foi menor que 0,05, julgou-se que existia uma diferença significativa. A diferença da pontuação entre o grupo de administração do solvente e o grupo de administração de cada composto de teste foi analisada usando teste de soma de ranque de Wilcoxon ou teste de Steel. Além do mais, análise de regressão linear foi usada para calcular 50 % da dose efetiva (intervalo de confiança a 95 %).

Uma vez que os compostos de testes apresentaram efeito inibitório para comportamento estereotipado induzido por apomorfina, confirmou-se que os compostos de testes tinham efeito antagonístico do receptor $D_2$.

Teste farmacológico 4

Efeito inibitório no espasmo da cabeça induzido por (±)D-2,5-dimetóxi-4-iodoanfetamina (DOI) em ratos

Ratos Wistar (machos, seia-sete semanas de vida, Japan SLC, Inc.) foram usados como animais de teste. Um composto de teste foi suspenso em goma arábica 5 %/(salina fisiológica ou água) usando um almofariz de ágata e foi diluído com o mesmo solvente se necessário.

Animais de teste foram jejuados durante toda a noite do dia anterior. DOI (5,0 mg/kg) foi subcutaneamente administrado (1 mL/kg) 1 hora depois que cada composto de teste foi oralmente administrado (5 mL/kg). O número de espasmos da cabeça foi contado por 10 minutos imediatamente depois dar injeção de DOI. Seis animais de teste foram usados para cada grupo.

Análise estatística não clínica foi usada para todo o processamento estatístico. Quando o valor de probabilidade de significância foi menor que 0,05, julgou-se que existia uma diferença significativa. A diferença do número de espasmos de cabeça entre o grupo de administração de solvente e o cada grupo de administração de composto de teste foi analisada usando teste-t ou teste de Dunnett. Além do mais, análise de regressão linear foi usada para calcular 50 % da dose efetiva (intervalo de confiança a 95 %).

Uma vez que os compostos de testes apresentaram efeito inibitório para espasmo de cabeça induzido por DOI, confirmou-se que os compostos de teste têm efeito antagonístico do receptor da serotonina $5HT_{2A}$.

Teste farmacológico 5

Efeito da indução de catalepsia em ratos

Ratos Wistar (machos, seia-sete semanas de vida, Japan SLC, Inc.) foram usados como animais de teste. Um composto de teste foi suspenso em goma arábica 5 %/(salina fisiológica ou água) usando um almofariz de ágata e foi diluído com o mesmo solvente se necessário.

Animais de teste foram jejuados durante toda a noite do dia anterior à observação da catalepsia e ptose foi realizada 1, 2, 4, 6 e 8 horas depois que cada composto de teste foi oralmente administrado (5 mL/kg). Seis animais de teste foram usados para cada grupo.

Uma pata dianteira de um rato foi colocada em uma borda de uma caixa pequena de aço (largura: 6,5 cm, profundidade: 4,0 cm, altura: 7,2 cm) (uma pose não natural) e quando o rato mantinha a pose por mais que 30 segundos, julgou-se que o caso foi positivo para catalepsia. Esta observação foi realizada três vezes em cada ponto, e se houvesse pelo menos um caso positivo, julgou-se que ocorreu catalepsis no indivíduo.

Conseqüentemente, o efeito de indução de catalepsia de um composto de teste foi dissociado do efeito inibitório em comportamento estereotipado induzido por apomorfina, desta forma sugeriu-se que apreensão para efeito colateral extrapiramidal clínico é baixa.

Teste farmacológico 6

Medição da atividade inibitória da absorção da serotonin (5-HT) de um composto de teste por sinaptosoma de cérebro de rato

Ratos Wistar machos foram decaptados, o cérebro foi reparado e córtex frontal foi dissecado, e ele foi homogeneizado em solução de sacarose 0,32 M de um peso 20 vezes do peso do tecido usando um homogeneizador tipo Potter. O homogeneizado foi centrifugado a 4 °C, 1.000 × g por 10 minutos, o sobrenadante obtido foi adicionalmente centrifugado a 4 °C, 20.000 × g por 20 minutos, e o precipitado foi suspenso em um tampão de incubação (tampão Hepes 20 mM (pH 7,4) contendo glicose 10 mM, cloreto de sódio 145 mM, cloreto de potássio 4,5 mM, cloreto de magnésio 1,2 mM, cloreto de cálcio 1,5 mM), que foi usado como fração de sinaptososma bruto.

A reação de absorção de 5-HT foi realizada em um volume de 200 μL usando uma placa de fundo redondo de 96 poços e pargilina

(concentração final 10 μM) e ascorbato de sódio (concentração final 0,2 mg/mL) estavam contidos no tampão de incubação mediante a reação e usados.

Tampão de incubação (contagem total), 5-HT não marcado (concentração final 10 μM, contagem não especificada) e o composto de teste diluído (concentração final 300 nM) foram adicionados a cada poço. Um décimo da quantidade do volume final da fração de sinaptosoma foi adicionado e depois de pré-incubado a 37 °C por 10 minutos, solução de 5-HT marcada com trítio (concentração final 8 nM) foi adicionada e a reação de absorção foi iniciada a 37 °C. O tempo de absorção foi 10 minutos e a reação foi finalizada por filtração em vácuo através de uma placa de papel de filtro de fibra de vidro de 96 poços, e depois que o papel de filtro foi lavado com salina normal fria, ele foi seco suficientemente e Microscint0 (Perkin-Elmer) foi adicionado ao filtro e a radioatividade restante no filtro foi medida.

Inibidor da absorção da atividade de serotinina (%) foi calculado a partir da radioatividade da contagem total como 100 %, da contagem não específica como 0 %, e da contagem obtida com composto de teste.

% de inibição de 5-HT(%) = 100-[(Contagem obtida com composto de teste-contagem não específica(0 % de absorção))/(contagem total (100 % de absorção)-contagem não específica(0 % de absorção)]×100

Os resultados estão apresentados na tabela 314 a seguir.

[Tabela 314]

| Composto de teste | Inibidor da absorção da taxa de serotonina (%) (300 nM) |
|---|---|
| Composto do exemplo 11 | 95,2 |
| Composto do exemplo 15 | 95,3 |
| Composto do exemplo 802 | 96,6 |
| Composto do exemplo 1071 | 94,4 |
| Composto do exemplo 1076 | 87,8 |
| Composto do exemplo 1089 | 85,0 |
| Composto do exemplo 1083 | 96,3 |
| Composto do exemplo 1106 | 69,9 |
| Composto do exemplo 1079 | 82,3 |
| Composto do exemplo 1080 | 95,6 |

| | |
|---|---|
| Composto do exemplo 1138 | 67,2 |
| Composto do exemplo 1059 | 97,2 |
| Composto do exemplo 1060 | 97,5 |
| Composto do exemplo 1061 | 97,5 |
| Composto do exemplo 1110 | 38,5 |
| Composto do exemplo 1086 | 98,6 |
| Composto do exemplo 1087 | 97,1 |
| Composto do exemplo 1113 | 59,3 |

Exemplos de preparação

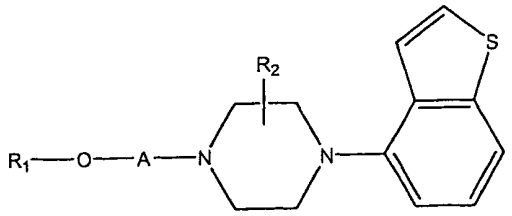
100 g de um composto da presente invenção, 40 g de Avicel (nome comercial, produto de Asahi Chemical Industry Co., Ltd.), 30 g de amido de milho e 2 g de estearato de magnésio foram misturados e polidos e comprimidos com um pistilo para glicocálice R10 mm.

O comprimido obtido foi revestido com um filme usando um agente de revestimento de filme feito de 10 g de TC-5 (nome comercial, produto de Shin-Etsu Chemical Co., Ltd., hidroxipropil metil celulose), 3 g de polietileno glicol 6.000, 40 g de óleo de rícino e uma quantidade apropriada de etanol para produzir um comprimido revestido com filme da composição anterior.

REIVINDICAÇÕES

1. Composto heterocíclico ou um sal do mesmo, caracterizado pelo fato de ser representado pela fórmula (1):

[Fórmula 1]




(1)

em que $R^2$ representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila inferior;

A representa um grupo alquileno inferior ou grupo alquenileno inferior; e

$R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (IV) a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$;

(II) um grupo aromático selecionado de um grupo fenila, um grupo naftila, um grupo diidroindenila e um grupo tetraidronaftila;

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, um átomo de oxigênio e um átomo de enxofre; e

(IV) um grupo heterocíclico fundido a benzeno que tem 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, um átomo de oxigênio e um átomo de enxofre e que é selecionado do grupo que consiste em (1) um grupo tetraidroquinoxalinila, (2) um grupo tetraidroquinazolinila, (3) um grupo diidroquinazolinila, (4) um grupo indolinila, (5) um grupo indolila, (6) um grupo isoindolinila, (7) um grupo benzimidazolila, (8) um grupo diidrobenzimidazolila, (9) um grupo tetraidrobenzazepinila, (10) um grupo tetraidrobenzodiazepinila, (11) um

grupo hexaidrobenzazocinila, (12) um grupo diidrobenzoxazinila, (13) um grupo diidrobenzoxazolila, (14) um grupo benzisoxazolila, (15) um grupo benzoxadiazolila, (16) um grupo tetraidrobenzoxazepinila, (17) um grupo diidrobenzotiazinila, (18) um grupo benzotiazolila, (19) um grupo benzoxatiolila, (20) um grupo cromenila, (21) um grupo diidrobenzofurila, (22) um grupo carbazolila, (23) um grupo dibenzofurila e (24) um grupo quinoxalinila

em que pelo menos um grupo selecionado do grupo que consiste nos grupo (1) a (66) a seguir pode estar presente como um substituinte no grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, o grupo aromático e o grupo heterocíclico representados por $R^1$:

(1) um grupo alquila inferior,

(2) um grupo alquenila inferior,

(3) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(5) um grupo arilóxi,

(6) um grupo alquiltio inferior,

(7) um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio,

(8) um grupo hidróxi,

(9) um grupo hidróxi protegido,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(11) um grupo hidróxi alquila inferior protegido,

(12) um átomo de halogênio,

(13) um grupo ciano,

(14) um grupo arila,

(15) um grupo nitro,

(16) um grupo amino,

(17) um grupo amino tendo um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior,

um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alquil inferior carbamoíla, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcóxi carbonil inferior amino alcanoíla inferior como um substituinte,

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(19) um grupo aril sulfonila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo arila,

(20) um grupo carbóxi,

(21) um grupo alcoxicarbonila inferior,

(22) um grupo carbóxi alquila inferior,

(23) um grupo alcoxicarbonila inferior alquila inferior,

(24) um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(25) um grupo carbóxi alquenila inferior,

(26) um grupo alcoxicarbonila inferior alquenila inferior,

(27) um grupo carbamoil alquenila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio como um substituinte,

(28) um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste nos grupo (i) a (lxxviii) a seguir como um substituinte:

(i) um grupo alquila inferior,

(ii) um grupo alcóxi inferior,

(iii) um grupo hidróxi alquila inferior,

(iv) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(v) um grupo arilóxi alquila inferior,

(vi) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(vii) um grupo amino alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo aroíla e um grupo carbamoíla,

(viii) um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo fenil alcóxi inferior como um substituinte,

(ix) um grupo alquila inferior substituído por cicloalquila $C_3$-$C_8$,

(x) um grupo alquenila inferior,

(xi) um grupo carbamoil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo fenila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior e um(s) grupo(s) fenila que pode ter um(s) grupo(s) alcóxi inferior como um substituinte,

(xii) um grupo alcoxicarbonila inferior alquila inferior,

(xiii) um grupo furil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte) no grupo furila,

(xiv) um grupo tetraidrofuril alquila inferior,

(xv) um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior,

(xvi) um grupo tetraidropiranil alquila inferior,

(xvii) um grupo pirrolil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo pirrolila),

(xviii) um grupo alquila inferior substituído por um grupo diidropirazolila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(xix) um grupo pirazolil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo pirazolila),

(xx) um grupo imidazolil alquila inferior,

(xxi) um grupo piridil alquila inferior,

(xxii) um grupo pirazinil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo pirazinila),

(xxiii) um grupo pirrolidinil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um(s) grupo(s) oxo e

um grupo alquila inferior como um substituinte no grupo pirrolidinila),

(xxiv) um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo benzoíla e um grupo alcanoíla inferior como um substituinte no grupo piperidinila),

(xxv) um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo piperazinila),

(xxvi) um grupo morfolinil alquila inferior,

(xxvii) um grupo tienil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo tienila),

(xxviii) um grupo tiazolil alquila inferior,

(xxix) um grupo diidrobenzofuril alquila inferior,

(xxx) um grupo benzopiranil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) oxo como um substituinte no grupo benzopiranila),

(xxxi) um grupo benzimidazolil alquila inferior,

(xxxii) um grupo indolil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior),

(xxxiii) um grupo imidazolil alquila inferior que tem um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior,

(xxxiv) um grupo piridila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquiltio inferior alquila inferior como um substituinte,

(xxxv) um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla como um substituinte,

(xxxvi) um grupo piperidila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo

alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um átomo de halogênio como um substituinte,

(xxxvii) um grupo tetraidrofurila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(xxxviii) um grupo hexaidroazepinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(xxxix) um grupo pirazolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo arila e um grupo furila como um substituinte,

(xl) um grupo tiazolila,

(xli) um grupo tiadiazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(xlii) um grupo isoxazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(xliii) um grupo indazolila,

(xliv) um grupo indolila,

(xlv) um grupo tetraidrobenzotiazolila,

(xlvi) um grupo tetraidroquinolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um átomo de halogênio e um grupo oxo como um substituinte,

(xlvii) um grupo quinolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(xlviii) um grupo benzodioxolil alquila inferior,

(xlix) um grupo arila que pode ter um(s) grupo(s) como um substituinte, selecionado do grupo que consiste em

um átomo de halogênio; um grupo alquila inferior; um grupo alcóxi inferior; um grupo alquila inferior substituído por halogênio; um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio; um grupo alquenila inferior; um

grupo amino que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo alquila inferior e um grupo arila; um grupo sulfamoíla; um grupo alquiltio inferior; um grupo alcanoíla inferior; um grupo alcoxicarbonila inferior; um pirrolila grupo; um grupo alquinila inferior; um grupo ciano; um grupo nitro; um grupo arilóxi; um grupo aril alcóxi inferior; um grupo hidróxi; um grupo hidróxi alquila inferior; um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo arila; um grupo pirazolila; um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo; um grupo oxazolila; um grupo imidazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior; um grupo diidrofurila que pode ter um(s) grupo(s) oxo; um grupo tiazolidinil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) oxo; um grupo imidazolil alcanoíla inferior e um grupo piperidinil carbonila,

(l) um grupo ciano alquila inferior,

(li) um grupo diidroquinolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo oxo,

(lii) um grupo alquil inferior amino substituído por halogênio,

(liii) um grupo alquiltio inferior alquila inferior,

(liv) um grupo amidino que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(lv) um grupo amidino alquila inferior,

(lvi) um grupo alquenilóxi inferior alquila inferior,

(lvii) um grupo arilamino que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, no grupo arila,

(lviii) um grupo aril alquenila inferior,

(lix) um grupo piridilamino que pode ter um(s) grupo(s)

alquila inferior,

(lx) um grupo aril alquila inferior (que pode ter no grupo arila e/ou o grupo alquila inferior um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior, um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior como um substituinte),

(lxi) um grupo alquinila inferior,

(lxii) um grupo arilóxi alquila inferior (que pode ter como um substituinte no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior; um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior; e um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo),

(lxiii) um grupo isoxazolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(lxiv) um grupo diidroindenila,

(lxv) um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior,

(lxvi) um grupo tetraidropiranila,

(lxvii) um grupo azetidinila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla,

(lxviii) um grupo azetidinil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e grupo aroíla,

(lxix) um grupo tetrazolila,

(lxx) um grupo indolinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(lxxi) um grupo triazolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo

alquiltio inferior,

(lxxii) um grupo imidazolila que pode ter um(s) grupo(s) carbamoíla,

(lxxiii) um grupo oxazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(lxxiv) um grupo isotiazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(lxxv) um grupo benzimidazolila,

(lxxvi) um grupo diidrobenzotiazolila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(lxxvii) um grupo tienila que pode ter um(s) grupo(s) alcoxicarbonila inferior, e

(lxxviii) um grupo oxazolil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior

(29) um grupo amino alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior, um grupo aroíla e um grupo alquila substituído por amino (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo amino) no grupo amino,

(30) um grupo alquila inferior substituído por um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(31) um grupo tiocarbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(32) um grupo sulfamoíla,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(34) um grupo imidazolidinila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(36) um grupo imidazolila,

(37) um grupo triazolila,

(38) um grupo isoxazolila,

(39) um grupo piperidila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo aril sulfonila, um grupo oxo, um grupo hidróxi, e um grupo amino que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(40) um grupo piperidil carbonila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo carbóxi alquila inferior, um grupo alquil inferior carbamoil alquila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alcóxi inferior, um grupo carbóxi, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino (em que 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo aroíla pode estar presente), um grupo piperidila (em que um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo aroíla pode estar presente), grupo piperazinila (em que um(s) grupo(s) alquila inferior pode estar presente como um substituinte), um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4,5]decila, um grupo morfolinila, um grupo hexaidro-1,4-diazepinila (em que um(s) grupo(s) alquila inferior pode estar presente como um substituinte), um grupo piridila, um grupo piridilóxi, um grupo piridil alcóxi inferior, um grupo

tetraidroquinolila (em que um(s) grupo(s) oxo pode estar presente), um grupo benzodioxolila, um grupo aril alcóxi inferior (que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio no grupo arila), um grupo arila (em que um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alcóxi inferior, grupo hidróxi pode estar presente), um grupo arilóxi (que pode ter no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo ciano, um átomo de halogênio, grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio), um grupo aril alquila inferior (que pode ter no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio), e um grupo aroíla (que pode ter no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alcóxi inferior),

(41) um grupo pirrolidinil carbonila que pode ter um grupo como um substituinte, selecionado do grupo que consiste em um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo hidróxi, um grupo amino (que pode ter no grupo amino um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior, um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo piperazinila), um grupo amino alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo amino), um grupo arilóxi (que pode ter um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio(s) no grupo arila), um grupo arilóxi alquila inferior (que pode ter um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio(s) no grupo aril) e um

grupo tetraidroquinolila (em que um(s) grupo(s) oxo pode estar presente),

(42) um grupo piperazinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) como um substituinte, selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, um grupo alcanoíla inferior, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo amino), um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo piperidinila), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior, um grupo tetraidrofuril alquila inferior, um grupo piridil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) fenila como um substituinte no grupo alquila inferior), um grupo imidazolil alquila inferior, um grupo furil alquila inferior, um grupo pirrolidinil carbonil alquila inferior, um grupo piperidila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte, grupo piridila (que pode ter no grupo piridila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo ciano e um grupo alquila inferior substituído por halogênio como um substituinte), um grupo tieno[2,3-b] piridila, um grupo arila (em que um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alquila inferior pode estar presente), um grupo aroíla, um furil carbonila, grupo um arila grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo oxo,

(43) um grupo hexaidroazepinil carbonila,

(44) um grupo hexaidro-1,4-diazepinil carbonila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo piridila,

(45) um grupo diidropirrolil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(46) um grupo tiomorfolinil carbonila,

(47) um grupo morfolinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior e um grupo arila,

(48) um grupo tiazolidinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) arila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo ciano,

(49) um grupo azabiciclo[3,2,2]nonil carbonila,

(50) um grupo 8-azabiciclo[3,2,1]octil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) arila substituído ou não substituído por halogênio,

(51) um grupo indolinil carbonila,

(52) um grupo tetraidroquinolil carbonila,

(53) um grupo tetraidropirido[3,4-b]indolil carbonila,

(54) um grupo morfolinil alquila inferior,

(55) um grupo piperazinil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo piperazinila,

(56) um grupo morfolinil carbonil alquila inferior,

(57) um grupo piperazinil carbonil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo piperazinila,

(58) um grupo oxo,

(59) um grupo amino alcóxi inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo amino),

(60) um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior,

(61) um grupo piperazinila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior,

(62) um grupo morfolinila,

(63) um grupo 1,3,8-triazaspiro[4,5]decanil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo arila,

(64) um grupo tetraidropiridil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) piridila,

(65) um grupo imidazolidinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) tioxo, e

(66) um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4,5]decanila.

2. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que

$R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (IV) a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$;

(II) um grupo aromático selecionado de um grupo fenila, grupo naftila, grupo diidroindenila e grupo tetraidronaftila;

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico que tem 1 a 2 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, átomo de oxigênio e átomo de enxofre, e que é selecionado do grupo que consiste em um grupo pirrolidinila, grupo piperidila, grupo pirazolila, grupo piridila, grupo pirimidinila, grupo pirazinila, grupo isoxazolila, grupo tiazolila, grupo piranila, e grupo tienila; e

(IV) um grupo heterocíclico fundido a benzeno que tem 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, átomo de oxigênio e átomo de enxofre e que é selecionado do grupo que consiste em (1) um grupo tetraidroquinoxalinila, (2) um grupo tetraidroquinazolinila, (3) um grupo diidroquinazolinila, (4) um grupo indolinila, (5) um grupo indolila, (6) um grupo isoindolinila, (7) um grupo benzimidazolinila, (8) um grupo diidrobenzimidazolila, (9) um grupo tetraidrobenzazepinila, (10) um grupo tetraidrobenzodiazepinila, (11) um grupo hexaidrobenzazocinila, (12) um grupo diidrobenzoxazinila, (13) um grupo diidrobenzoxazolila, (14) um grupo benzisoxazolila, (15) um grupo

benzoxadiazolila, (16) um grupo tetraidrobenzoxazepinila, (17) um grupo diidrobenzotiazinila, (18) um grupo benzotiazolila, (19) um grupo benzoxatiolila, (20) um grupo cromenila, (21) um grupo diidrobenzofurila, (22) um grupo carbazolila, (23) um grupo dibenzofurilae (24) um grupo quinoxalinila,

em que, no grupo aromático e o grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste nos grupo (1) a (66) a seguir podem estar presentes como um substituinte(s):

(1) um grupo alquila inferior,

(2) um grupo alquenila inferior,

(3) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(5) um grupo fenóxi,

(6) um grupo alquiltio inferior,

(7) um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio,

(8) um grupo hidróxi,

(9) um grupo fenil alcóxi inferior,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(11) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(12) um átomo de halogênio,

(13) um grupo ciano,

(14) um grupo fenila,

(15) um grupo nitro,

(16) um grupo amino,

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alquil inferior carbamoíla, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um

grupo alcoxicarbonil inferior amino alcanoíla inferior como um substituinte(s),

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(19) um grupo fenil sulfonila que pode ter um único grupo alquila inferior no grupo fenila,

(20) um grupo carbóxi,

(21) um grupo alcoxicarbonila inferior,

(22) um grupo carbóxi alquila inferior,

(23) um grupo alcoxicarbonila inferior alquila inferior,

(24) um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(25) um grupo carbóxi alquenila inferior,

(26) um grupo alcoxicarbonila inferior alquenila inferior,

(27) um grupo carbamoil alquenila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por 1 a 3 átomos de halogênio como um substituinte(s),

(28) um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste nos grupo (i) a (lxxviii) a seguir como um substituinte(s):

(i) um grupo alquila inferior,

(ii) um grupo alcóxi inferior,

(iii) um grupo hidróxi alquila inferior,

(iv) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(v) um grupo fenóxi alquila inferior,

(vi) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(vii) um grupo amino alquila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo benzoíla e um grupo carbamoíla,

(viii) um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ que pode ter 1 a 3 grupos

selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo fenil alcóxi inferior como um substituinte(s),

(ix) um grupo alquila inferior substituído por cicloalquila $C_3$-$C_8$,

(x) um grupo alquenila inferior,

(xi) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos como um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo fenila que pode ter um único grupo alquila inferior e um grupo fenila que pode ter um único grupo alcóxi inferior,

(xii) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos alcóxi inferior carbonila,

(xiii) um grupo furil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo furila),

(xiv) um grupo tetraidrofuril alquila inferior,

(xv) um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior,

(xvi) um grupo tetraidropiranil alquila inferior,

(xvii) um grupo pirrolil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior no grupo pirrolila como um substituinte(s)),

(xviii) um grupo alquila inferior substituído por um grupo diidropirazolila que pode ter um único grupo oxo,

(xix) um grupo pirazolil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirazolila),

(xx) um grupo imidazolil alquila inferior,

(xxi) um grupo piridil alquila inferior,

(xxii) um grupo pirazinil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirazinila),

(xxiii) um grupo pirrolidinil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirrolidinila),

(xxiv) um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo benzoíla e um grupo alcanoíla inferior como um substituinte(s) no grupo piperidinila),

(xxv) um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo piperazinila),

(xxvi) um grupo morfolinil alquila inferior,

(xxvii) um grupo tienil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo tienila),

(xxviii) um grupo tiazolil alquila inferior,

(xxix) um grupo diidrobenzofuril alquila inferior,

(xxx) um grupo benzopiranil alquila inferior (que pode ter um único grupo oxo como um substituinte no grupo benzopiranila),

(xxxi) um grupo benzimidazolil alquila inferior,

(xxxii) um grupo indolil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior),

(xxxiii) um grupo imidazolil alquila inferior que tem 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior, no grupo alquila inferior,

(xxxiv) um grupo piridila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquiltio inferior alquila inferior como um substituinte(s),

(xxxv) um grupo pirrolidinila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla como um substituinte(s),

(xxxvi) um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um átomo de halogênio como um substituinte(s) no grupo fenila),

(xxxvii) um grupo tetraidrofurila que pode ter um único grupo oxo

(xxxviii) um grupo hexaidroazepinila que pode ter um único grupo oxo,

(xxxix) um grupo pirazolila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo fenila e um grupo furila como um substituinte(s),

(xl) um grupo tiazolila,

(xli) um grupo tiadiazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(xlii) um grupo isoxazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(xliii) um grupo indazolila,

(xliv) um grupo indolila,

(xlv) um grupo tetraidrobenzotiazolila,

(xlvi) um grupo tetraidroquinolila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um átomo de halogênio e um grupo oxo como um substituinte(s),

(xlvii) um grupo quinolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(xlviii) um grupo benzodioxolil alquila inferior,

(xlix) um grupo fenila ou grupo naftila que pode ter 1 a 3 grupos como um substituinte(s), selecionado do grupo que consiste em

um átomo de halogênio; um grupo alquila inferior; um grupo alcóxi inferior; um grupo alquila inferior substituído por halogênio; um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio; um grupo alquenila inferior; um grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo alquila inferior e um grupo arila; um grupo sulfamoíla; um grupo alquiltio inferior; um grupo alcanoíla inferior; um grupo alcoxicarbonila inferior; grupo pirrolila; um grupo alquinila inferior; um grupo ciano; um grupo nitro; um grupo fenilóxi; um grupo fenil alcóxi inferior; um grupo hidróxi; um grupo hidróxi alquila inferior; um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo fenila; um grupo pirazolila; um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo; grupo oxazolila; um grupo imidazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior; um grupo diidrofurila que pode ter um único grupo oxo; grupo tiazolidinil alquila inferior que pode ter dois grupos oxo; grupo imidazolil alcanoíla inferior e grupo piperidinil carbonila,

(l) um grupo ciano alquila inferior,

(li) um grupo diidroquinolila que pode ter 1 a 3 grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo oxo,

(lii) um grupo alquil inferior amino substituído por halogênio,

(liii) um grupo alquiltio inferior alquila inferior,

(liv) um grupo amidino que pode ter um grupo alquila inferior,

(lv) um grupo amidino alquila inferior,

(lvi) um grupo alquenilóxi inferior alquila inferior,

(lvii) um grupo fenilamino que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio no grupo fenila,

(lviii) um grupo fenil alquenila inferior,

(lix) um grupo piridilamino que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(lx) um grupo fenil alquila inferior (que pode ter como um substituinte(s) no grupo fenila e/ou o grupo alquila inferior 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior, grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior),

(lxi) um grupo alquinila inferior,

(lxii) um grupo fenilóxi alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior, Grupo N-alcóxi inferior-N-alquil inferior carbamoíla e grupo oxo pirrolidinila como um substituinte(s) no grupo fenila),

(lxiii) um grupo isoxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(lxiv) um grupo diidroindenila,

(lxv) um grupo fenil alcóxi inferior alquila inferior,

(lxvi) um grupo tetraidropiranila,

(lxvii) um grupo azetidinila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e grupo benzoíla,

(lxviii) um grupo azetidinil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e grupo benzoíla,

(lxix) um grupo tetrazolila,

(lxx) um grupo indolinila que pode ter um único grupo oxo,

(lxxi) um grupo triazolila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo

alquiltio inferior,

(lxxii) um grupo imidazolila que pode ter 1 a 3 grupos carbamoíla,

(lxxiii) um grupo oxazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(lxxiv) um grupo isotiazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(lxxv) um grupo benzimidazolila,

(lxxvi) um grupo diidrobenzotiazolila que pode ter um único grupo oxo,

(lxxvii) um grupo tienila que pode ter 1 a 3 grupos alcoxicarbonila inferiores, e

(lxxviii) um grupo oxazolil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(29) um grupo amino alquila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo fenila, um grupo fenil alquila inferior, um grupo benzoíla e um grupo alquila substituído por amino (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo amino), no grupo amino,

(30) um grupo alquila inferior substituído por um único grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(31) um grupo tiocarbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior,

(32) um grupo sulfamoíla,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(34) um grupo imidazolidinila que pode ter 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(36) um grupo imidazolila,

(37) um grupo triazolila,

(38) um grupo isoxazolila,

(39) um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquil inferior fenil sulfonila, um grupo oxo, um grupo hidróxi, e um grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(40) um grupo piperidil carbonila que pode ter 1 a 3 substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo carbóxi alquila inferior, um grupo alquil inferior carbamoil alquila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alcóxi inferior, um grupo carbóxi, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino (em que 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo benzoíla pode estar presente), um grupo piperidila (em que 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo benzoíla pode estar presente), um grupo piperazinila (em que 1 a 3 grupos alquila inferior podem estar presentes como um substituinte(s)), um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4,5]decila, um grupo morfolinila, um grupo hexaidro-1,4-diazepinila (em que um único grupo alquila inferior pode estar presente como um substituinte), um grupo piridila,

um grupo piridilóxi, um grupo piridil alcóxi inferior, um grupo tetraidroquinolila (em que um único grupo oxo pode estar presente), um grupo benzodioxolila, um grupo fenil alcóxi inferior (que pode ter no grupo fenila 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio), um grupo fenila (em que 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alcóxi inferior e um grupo hidróxi pode estar presente), grupo fenilóxi (que pode ter no grupo fenila 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo ciano, um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio), um grupo fenil alquila inferior (no grupo fenila, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio pode estar presente), e um grupo benzoíla (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alcóxi inferior no grupo fenila),

(41) um grupo pirrolidinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos como um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo hidróxi alquila inferior, grupo carbamoíla, um grupo hidróxi, um grupo amino (que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla no grupo amino), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior, um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter um único grupo alquila inferior como um substituinte no grupo piperazinila), um grupo amino alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior podem estar presentes como um substituinte no grupo amino), grupo fenilóxi (que pode ter 1 a 3 grupo alcóxi inferior substituído por halogênios no grupo fenila), um grupo fenilóxi alquila inferior (que pode

ter 1 a 3 grupo alcóxi inferior substituído por halogênios no grupo fenil) e um grupo tetraidroquinolila (em que um grupo oxo pode estar presente),

(42) um grupo piperazinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos como um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, um grupo alcanoíla inferior, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo amino), um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo piperidinila), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo 1,3-dioxoranil alquila inferior, um grupo tetraidrofuril alquila inferior, um grupo piridil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos fenila como um substituinte(s) no grupo alquila inferior), um grupo imidazolil alquila inferior, um grupo furil alquila inferior, um grupo pirrolidinil carbonil alquila inferior, um grupo piperidila que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s)), um grupo piridila (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo ciano e um grupo alquila inferior substituído por halogênio como um substituinte(s) no grupo piridila), um grupo tieno[2,3-b] piridila, um grupo fenila (em que 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alquila inferior pode estar presente), um grupo benzoíla, um furil carbonila, grupo um grupo fenila alcoxicarbonila inferior e um grupo oxo,

(43) um grupo hexaidroazepinil carbonila,

(44) um grupo hexaidro-1,4-diazepinil carbonila que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo piridila,

(45) um grupo diidropirrolil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(46) um grupo tiomorfolinil carbonila,

(47) um grupo morfolinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior e um grupo fenila,

(48) um grupo tiazolidinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos fenila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo ciano,

(49) um grupo azabiciclo[3,2,2]nonil carbonila,

(50) um grupo 8-azabiciclo[3,2,1]octil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos fenilóxi substituídos ou não substituídos por halogênio,

(51) um grupo indolinil carbonila,

(52) um grupo tetraidroquinolil carbonila,

(53) um grupo tetraidropirido[3,4-b]indolil carbonila,

(54) um grupo morfolinil alquila inferior,

(55) um grupo piperazinil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior no grupo piperazinila,

(56) um grupo morfolinil carbonil alquila inferior,

(57) um grupo piperazinil carbonil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior no grupo piperazinila,

(58) um grupo oxo,

(59) um grupo amino alcóxi inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior no grupo amino),

(60) um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior,

(61) um grupo piperazinila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior,

(62) um grupo morfolinila,

(63) um grupo 1,3,8-triazaspiro[4,5]decanil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um

grupo fenila,

(64) um grupo tetraidropiridil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos piridila,

(65) um grupo imidazolidinil carbonila que pode ter um único grupo tioxo, e

(66) um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4,5]decanila.

3. Composto de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizado pelo fato de que A é um grupo alquileno inferior.

4. Composto de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (III) apresentado a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$;

(II) um grupo fenila; e

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado do grupo que consiste em um grupo pirrolidinila, um grupo piperidila, um grupo pirazolila, um grupo piridila, grupo pirimidinila e um grupo tiazolila, e

no grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, o grupo aromático e o grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

5. Composto de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, e, no grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$ representado por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

6. Composto de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (II) um grupo fenila, e, no grupo aromático

representado por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

7. Composto de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado de um grupo pirrolidinila, um grupo piperidila, grupo pirazolila, um grupo piridila, um grupo pirimidinila e um grupo tiazolila, e, em grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

8. Composto de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (III) apresentado a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$;

(II) um grupo fenila; e

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado de um grupo pirrolidinila, um grupo piperidila, um grupo pirazolila, um grupo piridila, um grupo pirimidinila e um grupo tiazolila, e

no grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, grupo aromático e grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) apresentado a seguir podem estar presentes como um substituinte(s):

(1) um grupo alquila inferior,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alquil inferior carbamoíla, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonil inferior amino alcanoíla inferior, como um substituinte(s),

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(21) um grupo alcoxicarbonila inferior,

(28) um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste nos grupo (i), (ii), (iv), (xii) e (xxi) a seguir como um substituinte(s):

(i) um grupo alquila inferior,

(ii) um grupo alcóxi inferior,

(iv) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(xii) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos alcóxi inferior carbonila,

(xxi) um grupo piridil alquila inferior,

(29) um grupo amino alquila inferior que pode ter, no grupo amino, 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo fenila, um grupo fenil alquila inferior, um grupo benzoíla e um grupo alquila inferior substituído por amino (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior podem estar presentes como um substituinte(s) no grupo amino),

(30) um grupo alquila inferior substituído por um único grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(34) um grupo imidazolidinila que pode ter 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(36) um grupo imidazolila,

(39) um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquil inferior fenil sulfonila, um grupo oxo, grupo hidróxi, e um grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(61) um grupo piperazinila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior, e

(62) um grupo morfolinila.

9. Composto de acordo com a reivindicação 8, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (I) um grupo cicloexila, e, no grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$ representado por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) definidos na reivindicação 8 podem estar presentes como um substituinte(s).

10. Composto de acordo com a reivindicação 8, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (II) um grupo fenila, e, no grupo aromático representado por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18) (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) definidos na reivindicação 8 podem estar presentes como um substituinte(s).

11. Composto de acordo com a reivindicação 10, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (II) um grupo fenila, e, no grupo aromático representado por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (28), (33), (35), (39) e (61) apresentado a seguir podem estar presentes como um substituinte(s).

(1) um grupo alquila inferior,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcóxi carbonil inferior amino alcanoíla inferior, como um substituinte(s),

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(28) um grupo carbamoíla tendo um único grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(39) um grupo piperidila, e

(61) um grupo piperazinila que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior.

12. Composto de acordo com a reivindicação 11, caracterizado pelo fato de que $R^1$ é um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo amino tendo 1 ou 2 grupos alquila inferior no grupo amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo carbamoíla tendo um único grupo alquila inferior, que tem dois grupos alcóxi inferior no grupo alquila inferior;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo hidróxi alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo oxazolidinila tendo um único grupo oxo no grupo oxazolidinila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo pirrolidinila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperidila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcanoíla inferior no grupo piperazila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcanoíla inferior e um único grupo oxo no grupo piperazila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcoxicarbonila inferior e um único grupo oxo no grupo piperazila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo N-[(N-alcóxi inferior-carbonilamino)alcanoíl inferior]amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo N-(amino alcanoil inferior) amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo N-[(N-alcanoil inferior amino)alcanoil inferior] amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alcóxi inferior, um único grupo alcanoíla inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcoxicarbonila inferior no grupo piperazila; ou

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alcóxi inferior, um único grupo hidróxi alquila inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcoxicarbonila inferior no grupo piperazila.

13. Composto de acordo com a reivindicação 8, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionados de um grupo piperidila, grupo pirazolila e grupo tiazolila, e, no grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) definidos na reivindicação 8 podem estar presentes como um substituinte(s).

14. Composto de acordo com a reivindicação 13, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionados de um grupo piperidila, grupo pirazolila e grupo tiazolila, e, no grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (17) e (28) apresentado a seguir podem estar presentes como um substituinte(s).

(1) um grupo alquila inferior;

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alcanoíla inferior, como um substituinte(s); e

(28) um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior.

15. Composto de acordo com a reivindicação 14, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa

um grupo pirazolila tendo um único grupo alquila inferior e um único grupo alcanoil inferior amino;

um grupo pirazolila tendo um único grupo alquila inferior e

um único grupo N,N-di-alquil inferior amino;

um grupo piperidila tendo um único grupo N,N-di-alquil inferior carbamoíla; ou

um grupo tiazolila tendo um único grupo N,N-di-alquil inferior carbamoíla.

16. Composição farmacêutica, caracterizada pelo fato de que compreende um composto heterocíclico da fórmula (1) ou um sal do mesmo, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 15, como um ingrediente ativo e um veículo farmaceuticamente aceitável.

17. Composição farmacêutica de acordo com a reivindicação 16, caracterizada pelo fato de que é para tratar ou prevenir outros distúrbios do sistema nervoso central.

18. Composição farmacêutica de acordo com a reivindicação 17, caracterizada pelo fato de que é para tratar ou prevenir outros distúrbios do sistema nervoso central selecionados do grupo que consiste em esquizofrenia; esquizofrenia refratória, intratável ou crônica; perturbação emocional; distúrbio psicótico; distúrbio de humor; distúrbio bipolar tipo I; distúrbio bipolar tipo II; depressão; endógeno; depressão; depressão maior; depressão de melancolia e refratória; distúrbio distímico; distúrbio ciclotímico; ataque de pânico; distúrbio de pânico; agorafobia; fobia social; distúrbio obsessivo-compulsivo; distúrbio de estresse pós traumático; distúrbio de ansiedade generalizada; distúrbio de estresse agudo; histeria; distúrbio de somatização; distúrbio de conversão; distúrbio de dor; hipocondríase; distúrbio factioso; distúrbio dissociativo; disfunção sexual; distúrbio de desejo sexual; distúrbio de excitação sexual; disfunção erétil; anorexia nervosa; bulimia nervosa; distúrbio do sono; distúrbio do ajuste; abuso de álcool; intoxicação por álcool; abstinência de medicamento; intoxicação por estimulante; narcotismo; anhedonia; anhedonia iatrogênica; anhedonia de uma causa psíquica ou mental; anhedonia associada a

depressão; anhedonia associada a esquizofrenia; delírio; falha cognitiva; falha cognitiva associada ao mal de Alzheimer, mal de Parkinson e outras distúrbios neurodegenerativos; falha cognitiva causada pelo mal de Alzheimer; mal de Parkinson e doenças neurodegenerativas associadas; falha cognitiva de esquizofrenia; falha cognitiva causada por esquizofrenia refratória, intratável ou crônica; vômito; doença do movimento; obesidade; enxaqueca; dor (cabeça); retardo mental; distúrbio de autismo (autismo); distúrbio de Tourette; distúrbio de cacoete; distúrbio de déficit de atenção/hiperatividade; distúrbio de conduta; e síndrome de Down.

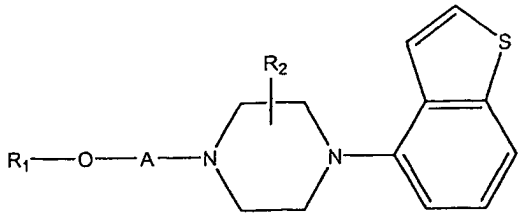
19. Processo para produzir uma composição farmacêutica, caracterizado pelo fato de que compreende misturar um composto heterocíclico da fórmula (1) ou um sal do mesmo, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 15, com um veículo farmaceuticamente aceitável.

20. Uso de um composto heterocíclico da fórmula (1) ou um sal do mesmo, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 15, caracterizado pelo fato de que é como um medicamento.

21. Uso de um composto heterocíclico da fórmula (1) ou um sal do mesmo, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 15, caracterizado pelo fato de que é como um agonista parcial do receptor de dopamina $D_2$ e/ou antagonista do receptor de serotonina 5-$HT_{2A}$ e/ou um antagonista do receptor de adrenalina $\alpha_1$ e/ou um inibidor da absorção de serotonina e/ou um inibidor da reabsorção de serotonina.

22. Método para tratar ou prevenir um distúrbio do sistema nervoso central, caracterizado pelo fato de que compreende administrar um composto heterocíclico da fórmula (1) ou um sal do mesmo, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 15 a humano ou animal.

23. Processo para produzir um composto heterocíclico representado pela fórmula (1):

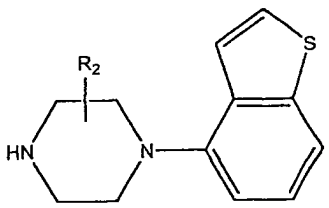



(1)

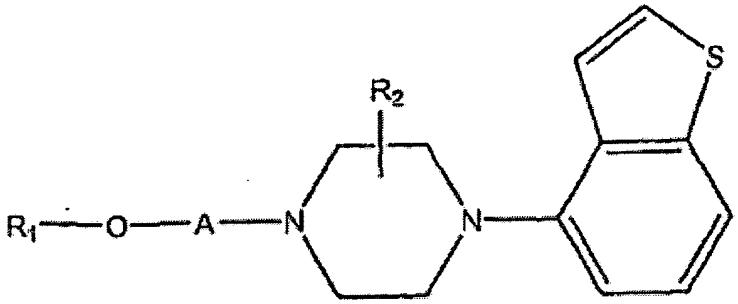
[em que $R_1$, $R_2$ e A são os mesmos definidos na reivindicação 1] ou um sal do mesmo, caracterizado pelo fato de que compreende uma reação de um composto representado pela fórmula:

$$R_1—O—A—X_1$$

[em que $R_1$ e A são os mesmos definidos anteriormente, e $X_1$ representa um átomo de halogênio ou um grupo que provoca uma reação de substituição, a mesma que em um átomo de halogênio] ou um sal do mesmo com um composto representado pela fórmula:




[em que $R_2$ é o mesmo definido anteriormente] ou um sal do mesmo.



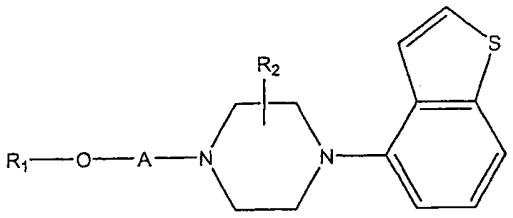

(1)

# RESUMO

"COMPOSTO HETEROCÍCLICO OU UM SAL DO MESMO, COMPOSIÇÃO FARMACÊUTICA, PROCESSO PARA PRODUZIR A MESMA, USO DE UM COMPOSTO HETEROCÍCLICO OU UM SAL DO MESMO, MÉTODO PARA TRATAR OU PREVENIR UM DISTÚRBIO DO SISTEMA NERVOSO CENTRAL, E, PROCESSO PARA PRODUZIR UM COMPOSTO HETEROCÍCLICO"

É descrito um composto heterocíclico ou um sal do mesmo representado pela fórmula (1):

[Fórmula 1]




(1)

onde $R^2$ representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila inferior;

A representa um grupo alquileno inferior ou grupo alquileno inferior; e

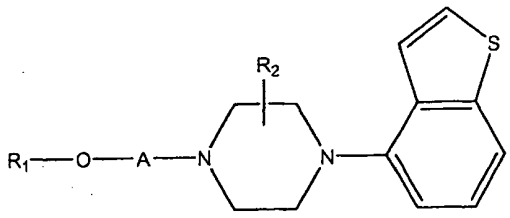
$R^1$ representa um grupo aromático ou um grupo heterocíclico. O composto da presente invenção tem um amplo espectro de tratamento para distúrbios mentais incluindo outros distúrbios do sistema nervoso central, nenhum efeito colateral e alta segurança.

A requerente apresenta novas vias das reivindicações para melhor esclarecer e definir o presente pedido.

# REIVINDICAÇÕES

1. Composto heterocíclico ou um sal do mesmo, caracterizado pelo fato de ser representado pela fórmula (1):

[Fórmula 1]




(1)

em que $R^2$ representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila inferior;

A representa um grupo alquileno inferior ou grupo alquenileno inferior; e

$R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (IV) a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$;

(II) um grupo aromático selecionado de um grupo fenila, um grupo naftila, um grupo diidroindenila e um grupo tetraidronaftila;

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, um átomo de oxigênio e um átomo de enxofre; e

(IV) um grupo heterocíclico fundido a benzeno que tem 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, um átomo de oxigênio e um átomo de enxofre e que é selecionado do grupo que consiste em (1) um grupo tetraidroquinoxalinila, (2) um grupo tetraidroquinazolinila, (3) um grupo diidroquinazolinila, (4) um grupo indolinila, (5) um grupo indolila, (6) um grupo isoindolinila, (7) um grupo benzimidazolila, (8) um grupo diidrobenzimidazolila, (9) um grupo tetraidrobenzazepinila, (10) um grupo tetraidrobenzodiazepinila, (11) um

grupo hexaidrobenzazocinila, (12) um grupo diidrobenzoxazinila, (13) um grupo diidrobenzoxazolila, (14) um grupo benzisoxazolila, (15) um grupo benzoxadiazolila, (16) um grupo tetraidrobenzoxazepinila, (17) um grupo diidrobenzotiazinila, (18) um grupo benzotiazolila, (19) um grupo benzoxatiolila, (20) um grupo cromenila, (21) um grupo diidrobenzofurila, (22) um grupo carbazolila, (23) um grupo dibenzofurila e (24) um grupo quinoxalinila

em que pelo menos um grupo selecionado do grupo que consiste nos grupo (1) a (66) a seguir pode estar presente como um substituinte no grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, o grupo aromático e o grupo heterocíclico representados por $R^1$:

(1) um grupo alquila inferior,

(2) um grupo alquenila inferior,

(3) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(5) um grupo arilóxi,

(6) um grupo alquiltio inferior,

(7) um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio,

(8) um grupo hidróxi,

(9) um grupo hidróxi protegido,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(11) um grupo hidróxi alquila inferior protegido,

(12) um átomo de halogênio,

(13) um grupo ciano,

(14) um grupo arila,

(15) um grupo nitro,

(16) um grupo amino,

(17) um grupo amino tendo um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior,

um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alquil inferior carbamoíla, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcóxi carbonil inferior amino alcanoíla inferior como um substituinte,

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(19) um grupo aril sulfonila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo arila,

(20) um grupo carbóxi,

(21) um grupo alcoxicarbonila inferior,

(22) um grupo carbóxi alquila inferior,

(23) um grupo alcoxicarbonila inferior alquila inferior,

(24) um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(25) um grupo carbóxi alquenila inferior,

(26) um grupo alcoxicarbonila inferior alquenila inferior,

(27) um grupo carbamoil alquenila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio como um substituinte,

(28) um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste nos grupo (i) a (lxxviii) a seguir como um substituinte:

(i) um grupo alquila inferior,

(ii) um grupo alcóxi inferior,

(iii) um grupo hidróxi alquila inferior,

(iv) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(v) um grupo arilóxi alquila inferior,

(vi) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(vii) um grupo amino alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo aroíla e um grupo carbamoíla,

(viii) um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo fenil alcóxi inferior como um substituinte,

(ix) um grupo alquila inferior substituído por cicloalquila $C_3$-$C_8$,

(x) um grupo alquenila inferior,

(xi) um grupo carbamoil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, grupo fenila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior e um(s) grupo(s) fenila que pode ter um(s) grupo(s) alcóxi inferior como um substituinte,

(xii) um grupo alcoxicarbonila inferior alquila inferior,

(xiii) um grupo furil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte) no grupo furila,

(xiv) um grupo tetraidrofuril alquila inferior,

(xv) um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior,

(xvi) um grupo tetraidropiranil alquila inferior,

(xvii) um grupo pirrolil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo pirrolila),

(xviii) um grupo alquila inferior substituído por um grupo diidropirazolila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(xix) um grupo pirazolil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo pirazolila),

(xx) um grupo imidazolil alquila inferior,

(xxi) um grupo piridil alquila inferior,

(xxii) um grupo pirazinil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo pirazinila),

(xxiii) um grupo pirrolidinil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um(s) grupo(s) oxo e

um grupo alquila inferior como um substituinte no grupo pirrolidinila),

(xxiv) um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo benzoíla e um grupo alcanoíla inferior como um substituinte no grupo piperidinila),

(xxv) um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo piperazinila),

(xxvi) um grupo morfolinil alquila inferior,

(xxvii) um grupo tienil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo tienila),

(xxviii) um grupo tiazolil alquila inferior,

(xxix) um grupo diidrobenzofuril alquila inferior,

(xxx) um grupo benzopiranil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) oxo como um substituinte no grupo benzopiranila),

(xxxi) um grupo benzimidazolil alquila inferior,

(xxxii) um grupo indolil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior),

(xxxiii) um grupo imidazolil alquila inferior que tem um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior,

(xxxiv) um grupo piridila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquiltio inferior alquila inferior como um substituinte,

(xxxv) um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla como um substituinte,

(xxxvi) um grupo piperidila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo

alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um átomo de halogênio como um substituinte,

(xxxvii) um grupo tetraidrofurila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(xxxviii) um grupo hexaidroazepinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(xxxix) um grupo pirazolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo arila e um grupo furila como um substituinte,

(xl) um grupo tiazolila,

(xli) um grupo tiadiazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(xlii) um grupo isoxazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(xliii) um grupo indazolila,

(xliv) um grupo indolila,

(xlv) um grupo tetraidrobenzotiazolila,

(xlvi) um grupo tetraidroquinolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um átomo de halogênio e um grupo oxo como um substituinte,

(xlvii) um grupo quinolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(xlviii) um grupo benzodioxolil alquila inferior,

(xlix) um grupo arila que pode ter um(s) grupo(s) como um substituinte, selecionado do grupo que consiste em

um átomo de halogênio; um grupo alquila inferior; um grupo alcóxi inferior; um grupo alquila inferior substituído por halogênio; um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio; um grupo alquenila inferior; um

grupo amino que pode ter um grupo selecionado do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo alquila inferior e um grupo arila; um grupo sulfamoíla; um grupo alquiltio inferior; um grupo alcanoíla inferior; um grupo alcoxicarbonila inferior; um pirrolila grupo; um grupo alquinila inferior; um grupo ciano; um grupo nitro; um grupo arilóxi; um grupo aril alcóxi inferior; um grupo hidróxi; um grupo hidróxi alquila inferior; um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo arila; um grupo pirazolila; um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo; um grupo oxazolila; um grupo imidazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior; um grupo diidrofurila que pode ter um(s) grupo(s) oxo; um grupo tiazolidinil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) oxo; um grupo imidazolil alcanoíla inferior e um grupo piperidinil carbonila,

(l) um grupo ciano alquila inferior,

(li) um grupo diidroquinolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo oxo,

(lii) um grupo alquil inferior amino substituído por halogênio,

(liii) um grupo alquiltio inferior alquila inferior,

(liv) um grupo amidino que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(lv) um grupo amidino alquila inferior,

(lvi) um grupo alquenilóxi inferior alquila inferior,

(lvii) um grupo arilamino que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, no grupo arila,

(lviii) um grupo aril alquenila inferior,

(lix) um grupo piridilamino que pode ter um(s) grupo(s)

alquila inferior,

(lx) um grupo aril alquila inferior (que pode ter no grupo arila e/ou o grupo alquila inferior um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior, um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior como um substituinte),

(lxi) um grupo alquinila inferior,

(lxii) um grupo arilóxi alquila inferior (que pode ter como um substituinte no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior; um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior; e um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo),

(lxiii) um grupo isoxazolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(lxiv) um grupo diidroindenila,

(lxv) um grupo aril alcóxi inferior alquila inferior,

(lxvi) um grupo tetraidropiranila,

(lxvii) um grupo azetidinila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla,

(lxviii) um grupo azetidinil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e grupo aroíla,

(lxix) um grupo tetrazolila,

(lxx) um grupo indolinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(lxxi) um grupo triazolila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo

alquiltio inferior,

(lxxii) um grupo imidazolila que pode ter um(s) grupo(s) carbamoíla,

(lxxiii) um grupo oxazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(lxxiv) um grupo isotiazolila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(lxxv) um grupo benzimidazolila,

(lxxvi) um grupo diidrobenzotiazolila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(lxxvii) um grupo tienila que pode ter um(s) grupo(s) alcoxicarbonila inferior, e

(lxxviii) um grupo oxazolil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior

(29) um grupo amino alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo arila, um grupo aril alquila inferior, um grupo aroíla e um grupo alquila substituído por amino (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo amino) no grupo amino,

(30) um grupo alquila inferior substituído por um grupo carbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(31) um grupo tiocarbamoíla que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(32) um grupo sulfamoíla,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(34) um grupo imidazolidinila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um(s) grupo(s) oxo,

(36) um grupo imidazolila,

(37) um grupo triazolila,

(38) um grupo isoxazolila,

(39) um grupo piperidila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo aril sulfonila, um grupo oxo, um grupo hidróxi, e um grupo amino que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(40) um grupo piperidil carbonila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo carbóxi alquila inferior, um grupo alquil inferior carbamoil alquila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alcóxi inferior, um grupo carbóxi, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino (em que 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo aroíla pode estar presente), um grupo piperidila (em que um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo aroíla pode estar presente), grupo piperazinila (em que um(s) grupo(s) alquila inferior pode estar presente como um substituinte), um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4,5]decila, um grupo morfolinila, um grupo hexaidro-1,4-diazepinila (em que um(s) grupo(s) alquila inferior pode estar presente como um substituinte), um grupo piridila, um grupo piridilóxi, um grupo piridil alcóxi inferior, um grupo

tetraidroquinolila (em que um(s) grupo(s) oxo pode estar presente), um grupo benzodioxolila, um grupo aril alcóxi inferior (que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio no grupo arila), um grupo arila (em que um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alcóxi inferior, grupo hidróxi pode estar presente), um grupo arilóxi (que pode ter no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo ciano, um átomo de halogênio, grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio), um grupo aril alquila inferior (que pode ter no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio), e um grupo aroíla (que pode ter no grupo arila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alcóxi inferior),

(41) um grupo pirrolidinil carbonila que pode ter um grupo como um substituinte, selecionado do grupo que consiste em um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo hidróxi, um grupo amino (que pode ter no grupo amino um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo aroíla), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior, um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo piperazinila), um grupo amino alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo amino), um grupo arilóxi (que pode ter um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio(s) no grupo arila), um grupo arilóxi alquila inferior (que pode ter um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio(s) no grupo aril) e um

grupo tetraidroquinolila (em que um(s) grupo(s) oxo pode estar presente),

(42) um grupo piperazinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) como um substituinte, selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, um grupo alcanoíla inferior, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo amino), um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte no grupo piperidinila), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior, um grupo tetraidrofuril alquila inferior, um grupo piridil alquila inferior (que pode ter um(s) grupo(s) fenila como um substituinte no grupo alquila inferior), um grupo imidazolil alquila inferior, um grupo furil alquila inferior, um grupo pirrolidinil carbonil alquila inferior, um grupo piperidila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior como um substituinte, grupo piridila (que pode ter no grupo piridila um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo ciano e um grupo alquila inferior substituído por halogênio como um substituinte), um grupo tieno[2,3-b] piridila, um grupo arila (em que um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alquila inferior pode estar presente), um grupo aroíla, um furil carbonila, grupo um arila grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo oxo,

(43) um grupo hexaidroazepinil carbonila,

(44) um grupo hexaidro-1,4-diazepinil carbonila que pode ter um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo piridila,

(45) um grupo diidropirrolil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior,

(46) um grupo tiomorfolinil carbonila,

(47) um grupo morfolinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior e um grupo arila,

(48) um grupo tiazolidinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) arila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo ciano,

(49) um grupo azabiciclo[3,2,2]nonil carbonila,

(50) um grupo 8-azabiciclo[3,2,1]octil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) arila substituído ou não substituído por halogênio,

(51) um grupo indolinil carbonila,

(52) um grupo tetraidroquinolil carbonila,

(53) um grupo tetraidropirido[3,4-b]indolil carbonila,

(54) um grupo morfolinil alquila inferior,

(55) um grupo piperazinil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo piperazinila,

(56) um grupo morfolinil carbonil alquila inferior,

(57) um grupo piperazinil carbonil alquila inferior que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo piperazinila,

(58) um grupo oxo,

(59) um grupo amino alcóxi inferior (que pode ter um(s) grupo(s) alquila inferior no grupo amino),

(60) um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior,

(61) um grupo piperazinila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior,

(62) um grupo morfolinila,

(63) um grupo 1,3,8-triazaspiro[4,5]decanil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo arila,

(64) um grupo tetraidropiridil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) piridila,

(65) um grupo imidazolidinil carbonila que pode ter um(s) grupo(s) tioxo, e

(66) um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4,5]decanila.

2. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que

$R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (IV) a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$;

(II) um grupo aromático selecionado de um grupo fenila, grupo naftila, grupo diidroindenila e grupo tetraidronaftila;

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico que tem 1 a 2 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, átomo de oxigênio e átomo de enxofre, e que é selecionado do grupo que consiste em um grupo pirrolidinila, grupo piperidila, grupo pirazolila, grupo piridila, grupo pirimidinila, grupo pirazinila, grupo isoxazolila, grupo tiazolila, grupo piranila, e grupo tienila; e

(IV) um grupo heterocíclico fundido a benzeno que tem 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em um átomo de nitrogênio, átomo de oxigênio e átomo de enxofre e que é selecionado do grupo que consiste em (1) um grupo tetraidroquinoxalinila, (2) um grupo tetraidroquinazolinila, (3) um grupo diidroquinazolinila, (4) um grupo indolinila, (5) um grupo indolila, (6) um grupo isoindolinila, (7) um grupo benzimidazolinila, (8) um grupo diidrobenzimidazolila, (9) um grupo tetraidrobenzazepinila, (10) um grupo tetraidrobenzodiazepinila, (11) um grupo hexaidrobenzazocinila, (12) um grupo diidrobenzoxazinila, (13) um grupo diidrobenzoxazolila, (14) um grupo benzisoxazolila, (15) um grupo

benzoxadiazolila, (16) um grupo tetraidrobenzoxazepinila, (17) um grupo diidrobenzotiazinila, (18) um grupo benzotiazolila, (19) um grupo benzoxatiolila, (20) um grupo cromenila, (21) um grupo diidrobenzofurila, (22) um grupo carbazolila, (23) um grupo dibenzofurilae (24) um grupo quinoxalinila,

em que, no grupo aromático e o grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste nos grupo (1) a (66) a seguir podem estar presentes como um substituinte(s):

(1) um grupo alquila inferior,

(2) um grupo alquenila inferior,

(3) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(5) um grupo fenóxi,

(6) um grupo alquiltio inferior,

(7) um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio,

(8) um grupo hidróxi,

(9) um grupo fenil alcóxi inferior,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(11) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(12) um átomo de halogênio,

(13) um grupo ciano,

(14) um grupo fenila,

(15) um grupo nitro,

(16) um grupo amino,

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alquil inferior carbamoíla, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um

grupo alcoxicarbonil inferior amino alcanoíla inferior como um substituinte(s),

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(19) um grupo fenil sulfonila que pode ter um único grupo alquila inferior no grupo fenila,

(20) um grupo carbóxi,

(21) um grupo alcoxicarbonila inferior,

(22) um grupo carbóxi alquila inferior,

(23) um grupo alcoxicarbonila inferior alquila inferior,

(24) um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(25) um grupo carbóxi alquenila inferior,

(26) um grupo alcoxicarbonila inferior alquenila inferior,

(27) um grupo carbamoil alquenila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por 1 a 3 átomos de halogênio como um substituinte(s),

(28) um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste nos grupo (i) a (lxxviii) a seguir como um substituinte(s):

(i) um grupo alquila inferior,

(ii) um grupo alcóxi inferior,

(iii) um grupo hidróxi alquila inferior,

(iv) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(v) um grupo fenóxi alquila inferior,

(vi) um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(vii) um grupo amino alquila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo benzoíla e um grupo carbamoíla,

(viii) um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$ que pode ter 1 a 3 grupos

selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo fenil alcóxi inferior como um substituinte(s),

(ix) um grupo alquila inferior substituído por cicloalquila $C_3$-$C_8$,

(x) um grupo alquenila inferior,

(xi) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos como um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo fenila que pode ter um único grupo alquila inferior e um grupo fenila que pode ter um único grupo alcóxi inferior,

(xii) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos alcóxi inferior carbonila,

(xiii) um grupo furil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo furila),

(xiv) um grupo tetraidrofuril alquila inferior,

(xv) um grupo 1,3-dioxolanil alquila inferior,

(xvi) um grupo tetraidropiranil alquila inferior,

(xvii) um grupo pirrolil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior no grupo pirrolila como um substituinte(s)),

(xviii) um grupo alquila inferior substituído por um grupo diidropirazolila que pode ter um único grupo oxo,

(xix) um grupo pirazolil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirazolila),

(xx) um grupo imidazolil alquila inferior,

(xxi) um grupo piridil alquila inferior,

(xxii) um grupo pirazinil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 (preferivelmente 1) grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirazinila),

(xxiii) um grupo pirrolidinil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior como um substituinte(s) no grupo pirrolidinila),

(xxiv) um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo benzoíla e um grupo alcanoíla inferior como um substituinte(s) no grupo piperidinila),

(xxv) um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo piperazinila),

(xxvi) um grupo morfolinil alquila inferior,

(xxvii) um grupo tienil alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo tienila),

(xxviii) um grupo tiazolil alquila inferior,

(xxix) um grupo diidrobenzofuril alquila inferior,

(xxx) um grupo benzopiranil alquila inferior (que pode ter um único grupo oxo como um substituinte no grupo benzopiranila),

(xxxi) um grupo benzimidazolil alquila inferior,

(xxxii) um grupo indolil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alcoxicarbonila inferior no grupo alquila inferior),

(xxxiii) um grupo imidazolil alquila inferior que tem 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior, no grupo alquila inferior,

(xxxiv) um grupo piridila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquiltio inferior alquila inferior como um substituinte(s),

(xxxv) um grupo pirrolidinila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla como um substituinte(s),

(xxxvi) um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um átomo de halogênio como um substituinte(s) no grupo fenila),

(xxxvii) um grupo tetraidrofurila que pode ter um único grupo oxo

(xxxviii) um grupo hexaidroazepinila que pode ter um único grupo oxo,

(xxxix) um grupo pirazolila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo fenila e um grupo furila como um substituinte(s),

(xl) um grupo tiazolila,

(xli) um grupo tiadiazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(xlii) um grupo isoxazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(xliii) um grupo indazolila,

(xliv) um grupo indolila,

(xlv) um grupo tetraidrobenzotiazolila,

(xlvi) um grupo tetraidroquinolila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um átomo de halogênio e um grupo oxo como um substituinte(s),

(xlvii) um grupo quinolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(xlviii) um grupo benzodioxolil alquila inferior,

(xlix) um grupo fenila ou grupo naftila que pode ter 1 a 3 grupos como um substituinte(s), selecionado do grupo que consiste em

um átomo de halogênio; um grupo alquila inferior; um grupo alcóxi inferior; um grupo alquila inferior substituído por halogênio; um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio; um grupo alquenila inferior; um grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo alquila inferior e um grupo arila; um grupo sulfamoíla; um grupo alquiltio inferior; um grupo alcanoíla inferior; um grupo alcoxicarbonila inferior; grupo pirrolila; um grupo alquinila inferior; um grupo ciano; um grupo nitro; um grupo fenilóxi; um grupo fenil alcóxi inferior; um grupo hidróxi; um grupo hidróxi alquila inferior; um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo fenila; um grupo pirazolila; um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo; grupo oxazolila; um grupo imidazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior; um grupo diidrofurila que pode ter um único grupo oxo; grupo tiazolidinil alquila inferior que pode ter dois grupos oxo; grupo imidazolil alcanoíla inferior e grupo piperidinil carbonila,

(l) um grupo ciano alquila inferior,

(li) um grupo diidroquinolila que pode ter 1 a 3 grupo(s) selecionado(s) do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo oxo,

(lii) um grupo alquil inferior amino substituído por halogênio,

(liii) um grupo alquiltio inferior alquila inferior,

(liv) um grupo amidino que pode ter um grupo alquila inferior,

(lv) um grupo amidino alquila inferior,

(lvi) um grupo alquenilóxi inferior alquila inferior,

(lvii) um grupo fenilamino que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio no grupo fenila,

(lviii) um grupo fenil alquenila inferior,

(lix) um grupo piridilamino que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(lx) um grupo fenil alquila inferior (que pode ter como um substituinte(s) no grupo fenila e/ou o grupo alquila inferior 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio, um grupo alcóxi inferior, grupo carbamoíla e um grupo alcoxicarbonila inferior),

(lxi) um grupo alquinila inferior,

(lxii) um grupo fenilóxi alquila inferior (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior, Grupo N-alcóxi inferior-N-alquil inferior carbamoíla e grupo oxo pirrolidinila como um substituinte(s) no grupo fenila),

(lxiii) um grupo isoxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(lxiv) um grupo diidroindenila,

(lxv) um grupo fenil alcóxi inferior alquila inferior,

(lxvi) um grupo tetraidropiranila,

(lxvii) um grupo azetidinila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e grupo benzoíla,

(lxviii) um grupo azetidinil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior e grupo benzoíla,

(lxix) um grupo tetrazolila,

(lxx) um grupo indolinila que pode ter um único grupo oxo,

(lxxi) um grupo triazolila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo

alquiltio inferior,

(lxxii) um grupo imidazolila que pode ter 1 a 3 grupos carbamoíla,

(lxxiii) um grupo oxazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(lxxiv) um grupo isotiazolila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(lxxv) um grupo benzimidazolila,

(lxxvi) um grupo diidrobenzotiazolila que pode ter um único grupo oxo,

(lxxvii) um grupo tienila que pode ter 1 a 3 grupos alcoxicarbonila inferiores, e

(lxxviii) um grupo oxazolil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(29) um grupo amino alquila inferior que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo fenila, um grupo fenil alquila inferior, um grupo benzoíla e um grupo alquila substituído por amino (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo amino), no grupo amino,

(30) um grupo alquila inferior substituído por um único grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(31) um grupo tiocarbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior,

(32) um grupo sulfamoíla,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(34) um grupo imidazolidinila que pode ter 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(36) um grupo imidazolila,

(37) um grupo triazolila,

(38) um grupo isoxazolila,

(39) um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquil inferior fenil sulfonila, um grupo oxo, um grupo hidróxi, e um grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(40) um grupo piperidil carbonila que pode ter 1 a 3 substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo hidróxi, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo carbóxi alquila inferior, um grupo alquil inferior carbamoil alquila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alcóxi inferior, um grupo carbóxi, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino (em que 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo benzoíla pode estar presente), um grupo piperidila (em que 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo benzoíla pode estar presente), um grupo piperazinila (em que 1 a 3 grupos alquila inferior podem estar presentes como um substituinte(s)), um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4,5]decila, um grupo morfolinila, um grupo hexaidro-1,4-diazepinila (em que um único grupo alquila inferior pode estar presente como um substituinte), um grupo piridila,

um grupo piridilóxi, um grupo piridil alcóxi inferior, um grupo tetraidroquinolila (em que um único grupo oxo pode estar presente), um grupo benzodioxolila, um grupo fenil alcóxi inferior (que pode ter no grupo fenila 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alcóxi inferior substituído por halogênio), um grupo fenila (em que 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alcóxi inferior e um grupo hidróxi pode estar presente), grupo fenilóxi (que pode ter no grupo fenila 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo ciano, um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio), um grupo fenil alquila inferior (no grupo fenila, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio, um grupo alquila inferior, um grupo alcóxi inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio pode estar presente), e um grupo benzoíla (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alcóxi inferior no grupo fenila),

(41) um grupo pirrolidinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos como um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo hidróxi alquila inferior, grupo carbamoíla, um grupo hidróxi, um grupo amino (que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo benzoíla no grupo amino), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior, um grupo piperazinil alquila inferior (que pode ter um único grupo alquila inferior como um substituinte no grupo piperazinila), um grupo amino alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior podem estar presentes como um substituinte no grupo amino), grupo fenilóxi (que pode ter 1 a 3 grupo alcóxi inferior substituído por halogênios no grupo fenila), um grupo fenilóxi alquila inferior (que pode

ter 1 a 3 grupo alcóxi inferior substituído por halogênios no grupo fenil) e um grupo tetraidroquinolila (em que um grupo oxo pode estar presente),

(42) um grupo piperazinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos como um substituinte(s) selecionado do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo cicloalquila $C_3$-$C_8$, um grupo alcanoíla inferior, um grupo hidróxi alquila inferior, um grupo alcóxi inferior alquila inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo amino alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo amino), um grupo piperidil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s) no grupo piperidinila), um grupo morfolinil alquila inferior, um grupo pirrolidinil alquila inferior, um grupo 1,3-dioxoranil alquila inferior, um grupo tetraidrofuril alquila inferior, um grupo piridil alquila inferior (que pode ter 1 a 2 grupos fenila como um substituinte(s) no grupo alquila inferior), um grupo imidazolil alquila inferior, um grupo furil alquila inferior, um grupo pirrolidinil carbonil alquila inferior, um grupo piperidila que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior como um substituinte(s)), um grupo piridila (que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo ciano e um grupo alquila inferior substituído por halogênio como um substituinte(s) no grupo piridila), um grupo tieno[2,3-b] piridila, um grupo fenila (em que 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um átomo de halogênio e um grupo alquila inferior pode estar presente), um grupo benzoíla, um furil carbonila, grupo um grupo fenila alcoxicarbonila inferior e um grupo oxo,

(43) um grupo hexaidroazepinil carbonila,

(44) um grupo hexaidro-1,4-diazepinil carbonila que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo piridila,

(45) um grupo diidropirrolil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior,

(46) um grupo tiomorfolinil carbonila,

(47) um grupo morfolinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo piperidil alquila inferior e um grupo fenila,

(48) um grupo tiazolidinil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos fenila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alcóxi inferior e um grupo ciano,

(49) um grupo azabiciclo[3,2,2]nonil carbonila,

(50) um grupo 8-azabiciclo[3,2,1]octil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos fenilóxi substituídos ou não substituídos por halogênio,

(51) um grupo indolinil carbonila,

(52) um grupo tetraidroquinolil carbonila,

(53) um grupo tetraidropirido[3,4-b]indolil carbonila,

(54) um grupo morfolinil alquila inferior,

(55) um grupo piperazinil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior no grupo piperazinila,

(56) um grupo morfolinil carbonil alquila inferior,

(57) um grupo piperazinil carbonil alquila inferior que pode ter 1 a 3 grupos alquila inferior no grupo piperazinila,

(58) um grupo oxo,

(59) um grupo amino alcóxi inferior (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior no grupo amino),

(60) um grupo alcóxi inferior alcóxi inferior,

(61) um grupo piperazinila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior,

(62) um grupo morfolinila,

(63) um grupo 1,3,8-triazaspiro[4,5]decanil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um

grupo fenila,

(64) um grupo tetraidropiridil carbonila que pode ter 1 a 3 grupos piridila,

(65) um grupo imidazolidinil carbonila que pode ter um único grupo tioxo, e

(66) um grupo 1,4-dioxa-8-azaspiro[4,5]decanila.

3. Composto de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizado pelo fato de que A é um grupo alquileno inferior.

4. Composto de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (III) apresentado a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$;

(II) um grupo fenila; e

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado do grupo que consiste em um grupo pirrolidinila, um grupo piperidila, um grupo pirazolila, um grupo piridila, grupo pirimidinila e um grupo tiazolila, e

no grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, o grupo aromático e o grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

5. Composto de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, e, no grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$ representado por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

6. Composto de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (II) um grupo fenila, e, no grupo aromático

representado por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

7. Composto de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado de um grupo pirrolidinila, um grupo piperidila, grupo pirazolila, um grupo piridila, um grupo pirimidinila e um grupo tiazolila, e, em grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1) a (66) definidos na reivindicação 2 podem estar presentes como um substituinte(s).

8. Composto de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, um grupo aromático ou um grupo heterocíclico selecionado do grupo que consiste em (I) a (III) apresentado a seguir:

(I) um grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$;

(II) um grupo fenila; e

(III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionado de um grupo pirrolidinila, um grupo piperidila, um grupo pirazolila, um grupo piridila, um grupo pirimidinila e um grupo tiazolila, e

no grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$, grupo aromático e grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 5 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) apresentado a seguir podem estar presentes como um substituinte(s):

(1) um grupo alquila inferior,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alquilsulfonila inferior, um grupo carbamoíla, um grupo alquil inferior carbamoíla, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonil inferior amino alcanoíla inferior, como um substituinte(s),

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(21) um grupo alcoxicarbonila inferior,

(28) um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste nos grupo (i), (ii), (iv), (xii) e (xxi) a seguir como um substituinte(s):

(i) um grupo alquila inferior,

(ii) um grupo alcóxi inferior,

(iv) um grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(xii) um grupo alquila inferior tendo 1 a 2 grupos alcóxi inferior carbonila,

(xxi) um grupo piridil alquila inferior,

(29) um grupo amino alquila inferior que pode ter, no grupo amino, 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alquila inferior substituído por halogênio, um grupo alcoxicarbonila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo fenila, um grupo fenil alquila inferior, um grupo benzoíla e um grupo alquila inferior substituído por amino (que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior podem estar presentes como um substituinte(s) no grupo amino),

(30) um grupo alquila inferior substituído por um único grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alquila inferior substituído por halogênio,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(34) um grupo imidazolidinila que pode ter 1 a 2 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo e um grupo alquila inferior,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(36) um grupo imidazolila,

(39) um grupo piperidila que pode ter 1 a 3 substituintes selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alquil inferior fenil sulfonila, um grupo oxo, grupo hidróxi, e um grupo amino que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior, um grupo alcoxicarbonila inferior e um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior,

(61) um grupo piperazinila que pode ter 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alquila inferior, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior, e

(62) um grupo morfolinila.

9. Composto de acordo com a reivindicação 8, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (I) um grupo cicloexila, e, no grupo cicloalquila $C_5$-$C_6$ representado por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) definidos na reivindicação 8 podem estar presentes como um substituinte(s).

10. Composto de acordo com a reivindicação 8, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (II) um grupo fenila, e, no grupo aromático representado por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18) (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) definidos na reivindicação 8 podem estar presentes como um substituinte(s).

11. Composto de acordo com a reivindicação 10, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (II) um grupo fenila, e, no grupo aromático representado por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (28), (33), (35), (39) e (61) apresentado a seguir podem estar presentes como um substituinte(s).

(1) um grupo alquila inferior,

(4) um grupo alcóxi inferior,

(10) um grupo hidróxi alquila inferior,

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior, um grupo amino alcanoíla inferior, um grupo alcanoil inferior amino alcanoíla inferior e um grupo alcóxi carbonil inferior amino alcanoíla inferior, como um substituinte(s),

(18) um grupo alcanoíla inferior,

(28) um grupo carbamoíla tendo um único grupo alcóxi inferior alquila inferior,

(33) um grupo oxazolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(35) um grupo pirrolidinila que pode ter um único grupo oxo,

(39) um grupo piperidila, e

(61) um grupo piperazinila que pode ter 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo oxo, um grupo alcanoíla inferior e um grupo alcoxicarbonila inferior.

12. Composto de acordo com a reivindicação 11, caracterizado pelo fato de que $R^1$ é um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo amino tendo 1 ou 2 grupos alquila inferior no grupo amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo carbamoíla tendo um único grupo alquila inferior, que tem dois grupos alcóxi inferior no grupo alquila inferior;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo hidróxi alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo oxazolidinila tendo um único grupo oxo no grupo oxazolidinila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo pirrolidinila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperidila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcanoíla inferior no grupo piperazila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcanoíla inferior e um único grupo oxo no grupo piperazila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcoxicarbonila inferior e um único grupo oxo no grupo piperazila;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo N-[(N-alcóxi inferior-carbonilamino)alcanoíl inferior]amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo N-(amino alcanoil inferior) amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alquila inferior, um único grupo alcóxi inferior e um único grupo N-[(N-alcanoil inferior amino)alcanoil inferior] amino;

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alcóxi inferior, um único grupo alcanoíla inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcoxicarbonila inferior no grupo piperazila; ou

um grupo fenila tendo, no grupo fenila, um único grupo alcóxi inferior, um único grupo hidróxi alquila inferior e um único grupo piperazila tendo um único grupo alcoxicarbonila inferior no grupo piperazila.

13. Composto de acordo com a reivindicação 12, caracterizado pelo fato de que é selecionado do grupo consistindo de:

(1) N-metil-4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il)-piperazin-1-il)propóxi]-3-metóxi-5-metilanilina;

(2) 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il)-piperazin-1-il)propóxi]-N,N-dimetil-3-metóxi-5-metilanilina;

(3) 4-[3-(4-benzo[b]tiofen-4-il)-piperazin-1-il)propóxi]-N-(2,2-dimetoxietil)-3-metóxi-5-metilbenzamida;

(4) 1-(benzo[b]tiofen-4-il)-4-[3-{2-metóxi-6-metil-4-(pirrolidin-1-il)fenóxi}propil]piperazina;

(5) 1-(benzo[b]tiofen-4-il)-4-[3-{2-metóxi-6-metil-4-(piperidin-1-il)fenóxi}propil]piperazina;

(6) 1-Acetil-4-{4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propóxi]-3-metóxi-5-metilfenil}piperazina;

(7) 4-Acetil-1-{4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propóxi]-3-metóxi-5-metilfenil}piperazin-2-ona;

(8) 4-{4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propóxi]-3-metóxi-5-metilfenil}-3-oxo-1-metoxicarbonilpiperazina;

(9) N-(N-{4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propóxi]-3-metóxi-5-metilfenil}carbamoilmetil)carbamato de terc-butila;

(10) 2-Amino-N-{4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propóxi-3-metóxi-5-metilfenil}acetamida;

(11) 2-Acetilamino-N-{4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propóxi}-3-metóxi-5-metilfenil}acetamida;

(12) 4-{4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propóxi]-3-formil-5-metoxifenil}-1-metoxicarbonilpiperazina; e

(13) 4-{4-[3-{4-(benzo[b]tiofen-4-il)piperazin-1-il}propóxi]-3-hidroximetil-5-metoxifenil}-1-metoxicarbonilpiperazina,

ou um sal do mesmo.

14. Composto de acordo com a reivindicação 8, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionados de um grupo piperidila, grupo pirazolila e grupo tiazolila, e, no grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (4), (10), (17), (18), (21), (28), (29), (30), (33), (34), (35), (36), (39), (61) e (62) definidos na reivindicação 8 podem estar presentes como um substituinte(s).

15. Composto de acordo com a reivindicação 14, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa (III) um grupo saturado ou insaturado heteromonocíclico tendo 1 a 2 átomos de nitrogênio selecionados de um grupo piperidila, grupo pirazolila e grupo tiazolila, e, no grupo heterocíclico representados por $R^1$, 1 a 3 grupos selecionados do grupo que consiste em (1), (17) e (28) apresentado a seguir podem estar presentes como um substituinte(s).

(1) um grupo alquila inferior;

(17) um grupo amino tendo 1 a 2 grupos selecionados do grupo que consiste em um grupo alquila inferior e um grupo alcanoíla inferior, como um substituinte(s); e

(28) um grupo carbamoíla que pode ter 1 a 2 grupos alquila inferior.

16. Composto de acordo com a reivindicação 15, caracterizado pelo fato de que $R^1$ representa

um grupo pirazolila tendo um único grupo alquila inferior e um único grupo alcanoil inferior amino;

um grupo pirazolila tendo um único grupo alquila inferior e

um único grupo N,N-di-alquil inferior amino;

um grupo piperidila tendo um único grupo N,N-di-alquil inferior carbamoíla; ou

um grupo tiazolila tendo um único grupo N,N-di-alquil inferior carbamoíla.

17. Composição farmacêutica, caracterizada pelo fato de que compreende um composto heterocíclico da fórmula (1) ou um sal do mesmo, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 16, como um ingrediente ativo e um veículo farmaceuticamente aceitável.

18. Composição farmacêutica de acordo com a reivindicação 17, caracterizada pelo fato de que é para tratar ou prevenir outros distúrbios do sistema nervoso central.

19. Composição farmacêutica de acordo com a reivindicação 18, caracterizada pelo fato de que é para tratar ou prevenir outros distúrbios do sistema nervoso central selecionados do grupo que consiste em esquizofrenia; esquizofrenia refratória, intratável ou crônica; perturbação emocional; distúrbio psicótico; distúrbio de humor; distúrbio bipolar tipo I; distúrbio bipolar tipo II; depressão; endógeno; depressão; depressão maior; depressão de melancolia e refratória; distúrbio distímico; distúrbio ciclotímico; ataque de pânico; distúrbio de pânico; agorafobia; fobia social; distúrbio obsessivo-compulsivo; distúrbio de estresse pós traumático; distúrbio de ansiedade generalizada; distúrbio de estresse agudo; histeria; distúrbio de somatização; distúrbio de conversão; distúrbio de dor; hipocondríase; distúrbio factioso; distúrbio dissociativo; disfunção sexual; distúrbio de desejo sexual; distúrbio de excitação sexual; disfunção erétil; anorexia nervosa; bulimia nervosa; distúrbio do sono; distúrbio do ajuste; abuso de álcool; intoxicação por álcool; abstinência de medicamento; intoxicação por estimulante; narcotismo; anhedonia; anhedonia iatrogênica; anhedonia de uma causa psíquica ou mental; anhedonia associada a

depressão; anhedonia associada a esquizofrenia; delírio; falha cognitiva; falha cognitiva associada ao mal de Alzheimer, mal de Parkinson e outras distúrbios neurodegenerativos; falha cognitiva causada pelo mal de Alzheimer; mal de Parkinson e doenças neurodegenerativas associadas; falha cognitiva de esquizofrenia; falha cognitiva causada por esquizofrenia refratória, intratável ou crônica; vômito; doença do movimento; obesidade; enxaqueca; dor (cabeça); retardo mental; distúrbio de autismo (autismo); distúrbio de Tourette; distúrbio de cacoete; distúrbio de déficit de atenção/hiperatividade; distúrbio de conduta; e síndrome de Down.

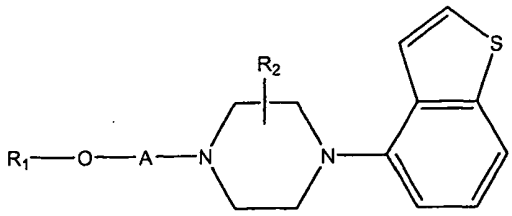
20. Processo para produzir uma composição farmacêutica, caracterizado pelo fato de que compreende misturar um composto heterocíclico da fórmula (1) ou um sal do mesmo, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 16, com um veículo farmaceuticamente aceitável.

21. Uso de um composto heterocíclico da fórmula (1) ou um sal do mesmo, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 16, caracterizado pelo fato de que é como um medicamento.

22. Uso de um composto heterocíclico da fórmula (1) ou um sal do mesmo, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 16, caracterizado pelo fato de que é como um agonista parcial do receptor de dopamina $D_2$ e/ou antagonista do receptor de serotonina 5-$HT_{2A}$ e/ou um antagonista do receptor de adrenalina $\alpha_1$ e/ou um inibidor da absorção de serotonina e/ou um inibidor da reabsorção de serotonina.

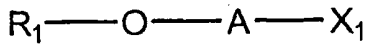
23. Método para tratar ou prevenir um distúrbio do sistema nervoso central, caracterizado pelo fato de que compreende administrar um composto heterocíclico da fórmula (1) ou um sal do mesmo, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 16 a humano ou animal.

24. Processo para produzir um composto heterocíclico representado pela fórmula (1):

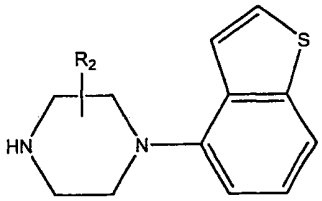



(1)

[em que $R_1$, $R_2$ e A são os mesmos definidos na reivindicação 1] ou um sal do mesmo, caracterizado pelo fato de que compreende uma reação de um composto representado pela fórmula:




[em que $R_1$ e A são os mesmos definidos anteriormente, e $X_1$ representa um átomo de halogênio ou um grupo que provoca uma reação de substituição, a mesma que em um átomo de halogênio] ou um sal do mesmo com um composto representado pela fórmula:




[em que $R_2$ é o mesmo definido anteriormente] ou um sal do mesmo.