

(11) Número de Publicação: **PT 1937664 E**

(51) Classificação Internacional:

C07D 401/04 (2011.01) **C07D 401/14** (2011.01)
C07D 403/04 (2011.01) **C07D 413/14** (2011.01)
C07D 417/14 (2011.01) **C07D 231/14** (2011.01)
C07D 207/34 (2011.01) **A01N 43/36** (2011.01)
A01N 43/56 (2011.01) **A01N 43/40** (2011.01)

(12) **FASCÍCULO DE PATENTE DE INVENÇÃO**

(22) Data de pedido: **2006.10.10**

(30) Prioridade(s): **2005.10.14 JP 2005299843**
2006.05.25 JP 2006144829

(43) Data de publicação do pedido: **2008.07.02**

(45) Data e BPI da concessão: **2011.06.15**
128/2011

(73) Titular(es):

SUMITOMO CHEMICAL COMPANY,LIMITED
27-1, SHINKAWA 2 - CHOME, CHUO-KU,
TOKYO 104-8260, JAPÃO

PT

(72) Inventor(es):

HIROSHI IKEGAMI
MARKUS JACHMANN
YOSHIHIKO NOKURA
CHIEMI IWATA

JP

JP

JP

JP

(74) Mandatário:

PEDRO DA SILVA ALVES MOREIRA
RUA DO PATROCÍNIO, N.º 94 1399-019 LISBOA

PT

(54) Epígrafe: **COMPOSTO DE HIDRAZIDA E UTILIZAÇÃO PESTICIDA DO MESMO**

(57) Resumo:

COMPOSTO DE HIDRAZIDA REPRESENTADO PELA FÓRMULA (1): TEM ACTIVIDADE PESTICIDA EXCELENTE.

DESCRIÇÃO

"COMPOSTO DE HIDRAZIDA E UTILIZAÇÃO PESTICIDA DO MESMO"

Campo Técnico

A presente invenção refere-se a compostos de hidrazida e à utilização pesticida dos mesmos.

Técnica Antecedente

Nos documentos WO 01/70671, WO 03/015518, WO 03/016284, WO 03/016300 e WO 03/024222, determinados compostos de amida são conhecidos como sendo compostos com actividade pesticida.

O documento EP-A-524041 refere-se a penta-2,4-dienamidas específicas e à sua utilização como pesticidas.

J. Agric. Food Chem. 2005, 53, 38-41 descreve a síntese e avaliação insecticida de pró-pesticidas de benzoilfenilureias.

Divulgação da invenção

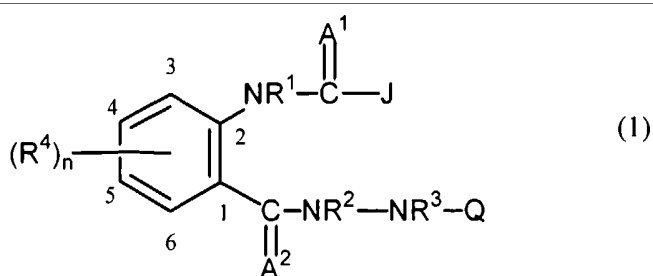
A presente invenção pretende proporcionar compostos possuindo excelente eficácia no controlo de pragas.

A actual requerente estudou intensamente para identificar compostos com eficácia excelente no controlo de pragas e, como

consequência, constatou que um composto de hidrazida representado pela seguinte fórmula (1) tem uma excelente eficácia de controlo. Assim, realizou-se a presente invenção.

De acordo com a presente invenção, é proporcionado:

(1) Um composto de hidrazida representado pela fórmula (1):



em que

R^1 representa um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo cianoalquilo C2-C6, um grupo alcoxialquilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 e R^3 representam, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo acilo C1-C6, um grupo alcóxicarbonilo C2-C6, um grupo N,N-dialquilcarbamoílo C3-C7 ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro e (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^4 representa um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo nitro, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou dois grupos R^4 que estão ligados aos átomos de carbono adjacentes são ligados um ao outro nas suas extremidades para formar um grupo T1 ou T2

T1: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

T2: $-(CR^{45}R^{46})_h-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo nitro, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxilo C1-C6

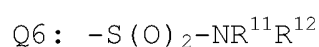
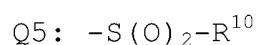
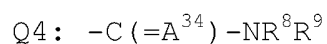
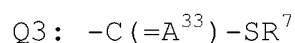
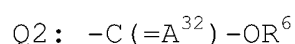
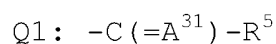
opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{45} e R^{46} representam, independentemente, um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

h representa um número inteiro de 3 ou 4),

n representa um número inteiro de 0 a 4 (desde que, quando n é um número inteiro de 2 ou mais, os $R^{4'}$ podem ser iguais ou diferentes),

Q representa um grupo seleccionado de Q1 a Q6:



(em que A^{31} , A^{32} , A^{33} e A^{34} representam um átomo de oxigénio ou um átomo de enxofre,

R^5 representa um átomo de hidrogénio; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alcoxilo C1-C6, (3) um grupo alquiltio C1-C6, (4) um grupo alquilsulfinilo C1-C6, (5) um grupo alquilsulfonilo C1-C6, (6) um grupo dialquilamino C2-C6 e (7) um grupo cicloalquilo C3-C6; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcóxicarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo naftilo opcionalmente substituído com 1 a 9 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo

de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenoxialquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^6 e R^7 representam um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcoxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um

átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e

(5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R⁸ e R⁹ representam, independentemente, um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcoxialquilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo

alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou R⁸ e R⁹ são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros, o grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros pode conter, no anel, um ou mais grupos independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de oxigénio, (2) um grupo de enxofre e (3) um grupo -NR^a- (em que R^a representa um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo) e o átomo ou átomos de carbono no anel podem estar substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (3) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R¹⁰ representa um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo

cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

R¹¹ e R¹² representam, independentemente, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou R¹¹ e R¹² são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros, o grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros pode conter, no anel, um ou mais grupos independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de oxigénio, (2) um átomo de enxofre e (3) um grupo -NR^b- (em que R^b representa um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxicarbonilo C2-C6

opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo), e o átomo ou átomos de carbono no anel podem estar substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (3) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

J representa um grupo representado por J1 ou J2:



(em que X^a , Y^a , Z^a , X^b , Y^b e Z^b representam, independentemente, CH ou um átomo de azoto,

R^{13a} e R^{13b} representam um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cianoalquilo C2-C6; um grupo alcoxialquilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo

cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo piridinilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de piridina pode estar substituída com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo

de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14a} e R^{14b} representam um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo nitro; um grupo isocianato; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cianoalquilo C2-C6; um grupo alcoxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alceniloxilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alciniloxilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenoxilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo

ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

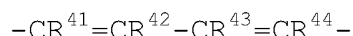
p representa um número inteiro de 0 a 3, e

q representa um número inteiro de 0 a 3 (desde que, quando p é um número inteiro de 2 ou 3, dois ou mais R^{14a} podem ser iguais ou diferentes e, quando q é um número inteiro de 2 ou 3, dois ou mais R^{14b} podem ser iguais ou diferentes), e

A^1 e A^2 representam, independentemente, um átomo de oxigénio ou um átomo de enxofre (daqui em diante referido como o presente composto)

(2) O composto de acordo com o (1) acima, em que n é um número inteiro de 0 a 3.

(3) O composto de acordo com o (2) acima, em que R^4 é um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou dois grupos R^4 que estão ligados aos átomos de carbono adjacentes são ligados nas suas extremidades para formar um grupo T1:



(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam um átomo de hidrogénio).

(4) O composto de acordo com o (3) acima, em que R^4 é um átomo de flúor, um átomo de cloro, um átomo de bromo, um átomo de iodo, um grupo ciano, um grupo metilo, um grupo etilo, um grupo trifluorometilo, um grupo metoxilo, um grupo fenilo ou dois grupos R^4 que estão ligados aos átomos de carbono adjacentes são ligados nas suas extremidades para formar um grupo T1: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$ (em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam um átomo de hidrogénio).

(5) O composto de acordo com qualquer um de (1) a (4) acima, em que

J é J1,

Y^a é CH,

R^{13a} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo heteroarilo de 5 a

6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14a} é um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

p é um número inteiro de 0 a 2.

(6) O composto de acordo com qualquer um de (1) a (4) acima, em que

J é J2, Y^b é CH,

R^{13b} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14b} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

q é 1.

(7) O composto de acordo com qualquer um de (1) a (6) acima, em que A^1 e A^2 são um átomo de oxigénio, e R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo.

(8) O composto de acordo com qualquer um de (1) a (7) acima, em que

Q é Q^1 ,

A^{31} é um átomo de oxigénio, e

R^5 é um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alcoxilo C1-C6, (3) um grupo alquiltio C1-C6, (4) um grupo alquilsulfinilo C1-C6, (5) um grupo alquilsulfonilo C1-C6, (6) um grupo dialquilamino C2-C6 e (7) um grupo cicloalquilo C3-C6; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo

opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros opcionalmente substituído com um ou mais grupos independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6.

(9) O composto de acordo com o (8) acima, em que R⁵ é um átomo de hidrogénio, um grupo metilo, um grupo etilo, um grupo terc-butilo, um grupo ciclopropilo, um grupo fenilo, um grupo 3-metilfenilo, um grupo 4-metoxifenilo, um grupo 2-piridinilo ou um grupo morfolino.

(10) O composto de acordo com qualquer um de a (1) a (7) acima, em que

Q é Q2,

A³² é um átomo de oxigénio, e

R⁶ é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

(11) O composto de acordo com o (10) acima, em que R⁶ é um grupo metilo, um grupo etilo, um grupo propilo, um grupo isopropilo, um grupo butilo, um grupo sec-butilo, um grupo 2-propenilo ou um grupo fenilo.

(12) O composto de acordo com qualquer um de (1) a (7) acima, em que

Q é Q4,

A³⁴ é um átomo de oxigénio, e

R⁸ e R⁹ representam, independentemente, um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

(13) O composto de acordo com o (12) acima, em que R⁸ e R⁹ representam, cada, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo metilo, um grupo etilo ou um grupo fenilo.

(14) O composto de acordo com qualquer um de (1) a (13) acima, em que R² é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo, e R³ é um átomo de hidrogénio, um grupo metilo, um grupo isopropilo ou um grupo metoxycarbonilo.

(15) O composto de acordo com o (1) acima, em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

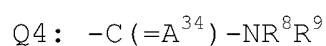
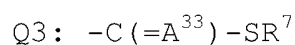
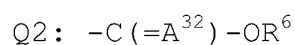
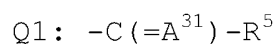
R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^4 é um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou dois grupos R^4 que estão ligados aos átomos de carbono adjacentes são ligados nas suas extremidades para formar um grupo T1: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam um átomo de hidrogénio),

n é um número inteiro de 0 a 3,

Q é um grupo representado por Q1 a Q6:



Q5: $-S(O)_2-R^{10}$

Q6: $-S(O)_2-NR^{11}R^{12}$

(em que A^{31} , A^{32} e A^{33} são um átomo de oxigénio, A^{34} é um átomo de oxigénio ou um átomo de enxofre,

R^5 é um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alcóxido C1-C6, (3) um grupo alquiltio C1-C6, (4) um grupo alquilsulfinilo C1-C6, (5) um grupo alquilsulfonilo C1-C6, (6) um grupo dialquilamino C2-C6 e (7) um grupo cicloalquilo C3-C6; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcóxicarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído

com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6,

R⁶ é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

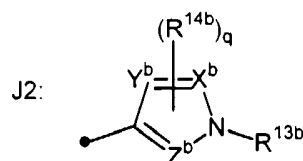
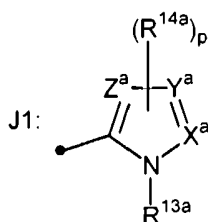
R⁷ é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^8 e R^9 representam, independentemente, um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{10} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

R^{11} e R^{12} representam, independentemente, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

J é um grupo representado por J1 ou J2:



(em que X^a é CH ou um átomo de azoto, Y^a é CH, Z^a é CH ou um átomo de azoto, X^b é CH ou um átomo de azoto, Y^b é CH e Z^b é CH ou um átomo de azoto,

R^{13a} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{13b} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14a} é um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de

halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14b} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

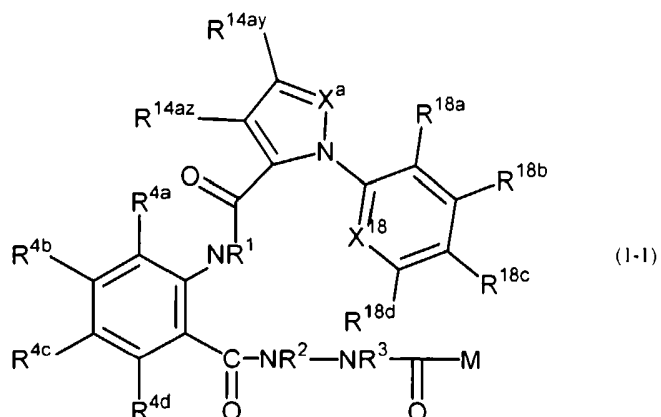
p é um número inteiro de 0 a 2,

q é 1,

(desde que, quando p é 2, dois R^{14a} podem ser iguais ou diferentes)), e

A^1 e A^2 são um átomo de oxigénio.

(16) Um composto de hidrazida representado pela fórmula (1-1):



em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são independentemente um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou

R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$ (em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam um átomo de hidrogénio),

M é OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9

(em que R^6 e R^7 são, independentemente, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^8 e R^9 são independentemente um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou

R^8 e R^9 são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo pirrolidin-1-ilo, um grupo piperidino, um grupo hexametilenoimin-1-ilo, um grupo heptametilenoimin-1-ilo, um grupo morfolino, um grupo tiomorfolin-4-ilo ou um grupo 4-fenilpiperazin-1-ilo),

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que R^{14ax} representa um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo

alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo,

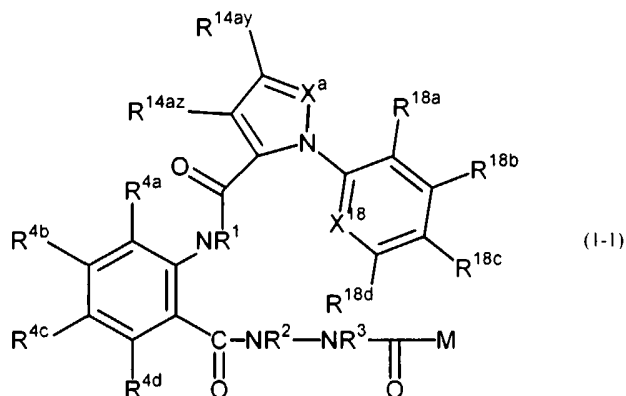
R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e}

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),
e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo.

(17) Um composto de hidrazida representado pela fórmula (1-1):



em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou

R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$ (em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam um átomo de hidrogénio),

M é um átomo de hidrogénio,

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e}

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),
e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo.

(18) Um pesticida compreendendo o composto de acordo com qualquer um de (1) a (17) acima como um ingrediente activo.

(19) Um método de controlo de uma praga que compreende aplicar o composto de acordo com qualquer um de (1) a (17) acima a uma planta, a um solo ou em casa.

(20) Utilização do composto de acordo com qualquer um de (1) a (17) acima para controlar uma praga aplicando o composto a uma planta, a um solo ou em casa.

(21) Utilização do composto de acordo com qualquer um de (1) a (17) acima para fabricar uma preparação pesticida.

Daqui em diante serão ilustradas formas de realização preferidas da presente invenção.

R^{14a} aqui utilizado representa um grupo que pode substituir um átomo de hidrogénio de um CH endocíclico de um grupo representado por J1 e R^{14b} representa um grupo que pode substituir um átomo de hidrogénio de um CH endocíclico de um grupo representado por J2.

Na presente invenção, exemplos de um átomo de halogéneo incluem um átomo de flúor, um átomo de cloro, um átomo de bromo e um átomo de iodo.

Em R^1 , R^2 e R^3 , exemplos do “grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilo, um grupo etilo, um grupo 2,2,2-trifluoroetilo, um grupo propilo, um grupo isopropilo, um grupo butilo, um grupo isobutilo, um grupo sec-butilo, um grupo terc-butilo, um grupo pentilo e um grupo hexilo.

Em R^1 , exemplos do “grupo cianoalquilo C2-C6” incluem um grupo cianometilo e um grupo 2-cianoetilo;

exemplos do “grupo alcoxialquilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-metoxietilo, um grupo 2-etoxietilo e um grupo 2-isopropiloxietilo;

exemplos do “grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-propenilo, um grupo 3-cloro-2-propenilo, um grupo 2-cloro-2-propenilo, um grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, um grupo 2-butenilo, um grupo 3-butenilo, um grupo 2-metil-2-propenilo, um grupo 3-metil-2-butenilo, um grupo 2-pentenilo e um grupo 2-hexenilo;

exemplos do “grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-propinilo, um grupo 3-cloro-2-propinilo, um grupo 3-bromo-2-propinilo, um grupo 2-butinilo e um grupo 3-butinilo; e

exemplos do “grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 grupos independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo

de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo benzilo, um grupo 1-feniletilo, um grupo 2-feniletilo, um grupo 2-clorobenzilo, um grupo 3-clorobenzilo, um grupo 4-clorobenzilo, um grupo 2-cianobenzilo, um grupo 3-cianobenzilo, um grupo 4-cianobenzilo, um grupo 2-nitrobenzilo, um grupo 3-nitrobenzilo, um grupo 4-nitrobenzilo, um grupo 2-metilbenzilo, um grupo 3-metilbenzilo, um grupo 4-metilbenzilo, um grupo 2-(trifluorometil)benzilo, um grupo 3-(trifluorometil)benzilo, um grupo 4-(trifluorometil)benzilo, um grupo 2-metoxibenzilo, um grupo 3-metoxibenzilo e um grupo 4-metoxibenzilo.

Em R^2 e R^3 , exemplos do "grupo acilo C1-C6" incluem um grupo formilo, um grupo acetilo, um grupo propionilo, um grupo isobutirilo e um grupo trimetilacetilo;

exemplos do "grupo alcoxycarbonilo C2-C6" incluem um grupo metoxycarbonilo, um grupo etoxycarbonilo, um grupo isopropoxycarbonilo e um grupo terc-butoxycarbonilo;

exemplos do "grupo N,N-dialquilcarbamoílo C3-C7" incluem um grupo N,N-dimetilcarbamoílo e um grupo N,N-dietilcarbamoílo; e

exemplos do "grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 grupos independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo fenilo, um grupo 2-clorofenilo, um grupo 3-clorofenilo, um grupo 4-clorofenilo, um grupo 2-cianofenilo,

um grupo 3-cianofenilo, um grupo 4-cianofenilo, um grupo 2-nitrofenilo, um grupo 3-nitrofenilo, um grupo 4-nitrofenilo, um grupo 2-metilfenilo, um grupo 3-metilfenilo, um grupo 4-metilfenilo, um grupo 2-(trifluorometil)fenilo, um grupo 3-(trifluorometil)fenilo e um grupo 4-(trifluorometil)fenilo.

Em R^4 , R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} , exemplos do “grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilo, um grupo trifluorometilo, um grupo etilo, um grupo propilo, um grupo isopropilo, um grupo butilo, um grupo isobutilo, um grupo sec-butilo, um grupo terc-butilo, um grupo pentilo e um grupo hexilo.

Em R^4 , R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} , exemplos do “grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metóxido, um grupo trifluorometóxido, um grupo etóxido, um grupo 2,2,2-trifluoroetóxido, um grupo propilóxido, um grupo isopropilóxido, um grupo butóxido, um grupo isobutilóxido, um grupo sec-butoxido, um grupo terc-butoxido, um grupo pentilóxido e um grupo hexilóxido.

Em R^4 , R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} , exemplos do “grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metiltio, um grupo trifluorometiltio e um grupo etiltio.

Em R^4 , R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} , exemplos do “grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilsulfinilo, um grupo trifluorometilsulfinilo e um grupo etilsulfinilo.

Em R^4 , R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} , exemplos do “grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilsulfonilo, um grupo trifluorometilsulfonilo e um grupo etilsulfonilo.

Em R^4 , exemplos do “grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo fenilo, um grupo 2-clorofenilo, um grupo 3-clorofenilo e um grupo 4-clorofenilo.

Em R^{45} e R^{46} , exemplos do “grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilo, um grupo trifluorometilo e um grupo etilo.

Em R^5 , exemplos do “grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo vinilo, um grupo 1-propenilo, um grupo 2-propenilo, um grupo 1-metilvinilo, um grupo 2-clorovinilo e um grupo 2-metil-1-propenilo;

exemplos do “grupo alcinilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo etinilo;

exemplos do “grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alcóxido C1-C6, (3) um grupo alquiltio C1-C6, (4) um grupo alquilsulfinilo C1-C6, (5) um grupo alquilsulfonilo C1-C6, (6) um grupo dialquilamino C2-C6 e (7) um grupo cicloalquilo C3-C6” incluem um grupo metilo, um grupo trifluorometilo, um grupo triclorometilo, um grupo clorometilo, um grupo diclorometilo, um grupo fluorometilo, um grupo difluorometilo, um grupo

metoximetilo, um grupo etoximetilo, um grupo metiltiometilo, um grupo etiltiometilo, um grupo metilsulfinilmetilo, um grupo metilsulfonilmetilo, um grupo dimetilaminometilo, um grupo ciclopropilmetilo, um grupo ciclopentilmetilo, um grupo ciclohexilmetilo, um grupo etilo, um grupo pentafluoroetilo, um grupo propilo, um grupo isopropilo, um grupo butilo, um grupo isobutilo, um grupo sec-butilo, um grupo terc-butilo, um grupo pentilo e um grupo hexilo;

exemplos do "grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6" incluem um grupo ciclopropilo, um grupo 2-metilciclopropilo, um grupo ciclobutilo, um grupo ciclopentilo e um grupo ciclo-hexilo;

exemplos do "grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo fenilo, um grupo 2-clorofenilo, um grupo 3-clorofenilo, um grupo 4-clorofenilo, um grupo 4-fluorofenilo,

um grupo 4-bromofenilo, um grupo 4-iodofenilo, um grupo 2-cianofenilo, um grupo 3-cianofenilo, um grupo 4-cianofenilo, um grupo 2-nitrofenilo, um grupo 3-nitrofenilo, um grupo 4-nitrofenilo, um grupo 2-metilfenilo, um grupo 3-metilfenilo, um grupo 4-metilfenilo, um grupo 2-(trifluorometil)fenilo, um grupo 3-(trifluorometil)fenilo, um grupo 4-(trifluorometil)fenilo, um grupo 2-metoxifenilo, um grupo 3-metoxifenilo, um grupo 4-metoxifenilo, um grupo 4-(trifluorometoxi)fenilo, um grupo 4-(metiltio)fenilo, um grupo 4-(metilsulfinil)fenilo, um grupo 4-(metilsulfonil)fenilo e um grupo 4-(metoxicarbonil)fenilo;

exemplos do "grupo naftilo opcionalmente substituído com 1 a 9 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo 1-naftilo e um grupo 2-naftilo;

exemplos do "grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo 1-metil-2-pirrolilo, um grupo 2-furilo, um grupo 3-furilo, um grupo 5-bromo-2-furilo, um grupo 5-nitro-2-furilo, um grupo 2-metil-3-furilo, um grupo 2,5-dimetil-3-furilo, um grupo 2,4-dimetil-3-furilo, um grupo 2-tienilo, um grupo 3-tienilo, um grupo 5-metil-2-tienilo, um grupo 3-metil-2-tienilo, um grupo 1-metil-

3-trifluorometil-5-pirazolilo, um grupo 5-cloro-1,3-dimetil-4-pirazolilo, um grupo 2-piridinilo, um grupo 3-piridinilo, um grupo 4-piridinilo, um grupo 2-metil-3-piridinilo, um grupo 6-metil-3-piridinilo, um grupo 2-cloro-3-piridinilo, um grupo 6-cloro-3-piridinilo e um grupo pirazinilo;

exemplos do “grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados de um grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6” incluem um grupo tetra-hidro-2-furilo, um grupo tetra-hidro-3-furilo e um grupo morfolino;

exemplos do “grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo benzilo, um grupo 1-feniletilo, um grupo 2-feniletilo, um grupo 2-clorobenzilo, um grupo 3-clorobenzilo, um grupo 4-clorobenzilo, um grupo 2-cianobenzilo, um grupo 3-cianobenzilo, um grupo 4-cianobenzilo, um grupo 2-nitrobenzilo, um grupo 3-nitrobenzilo, um grupo 4-nitrobenzilo, um grupo 2-metilbenzilo, um grupo 3-metilbenzilo, um grupo 4-metilbenzilo, um grupo 2-(trifluorometil)benzilo, um grupo 3-(trifluorometil)benzilo, um grupo 4-(trifluorometil)benzilo, um grupo 2-metoxibenzilo, um grupo 3-metoxibenzilo e um grupo 4-metoxibenzilo; e

exemplos do “grupo fenoxialquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcóxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo fenoximetilo, um grupo 2-fenoxietilo e um grupo 1-fenoxietilo.

Em R⁶ e R⁷, exemplos do “grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilo, um grupo etilo, um grupo 2,2,2-trifluoroetilo, um grupo 2,2,2-tricloroetilo, um grupo propilo, um grupo isopropilo, um grupo butilo, um grupo isobutilo, um grupo sec-butilo, um grupo terc-butilo, um grupo pentilo e um grupo hexilo;

exemplos do “grupo alcóxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-metoxietilo, um grupo 2-etoxietilo e um grupo 2-isopropiloxietilo;

exemplos do “grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 1-propenilo, um grupo 2-propenilo, um grupo 3-cloro-2-propenilo, um grupo 2-cloro-2-propenilo, um grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, um grupo 2-butenilo, um grupo 3-butenilo, um grupo 2-metil-2-propenilo, um grupo 3-metil-2-butenilo, um grupo 2-pentenilo e um grupo 2-hexenilo;

exemplos do “grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-propinilo, um grupo 3-cloro-2-propinilo, um grupo 3-bromo-2-propinilo, um grupo 2-butinilo e um grupo 3-butinilo;

exemplos do “grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6” incluem um grupo ciclopropilo, um grupo ciclobutilo, um grupo ciclopentilo e um grupo ciclo-hexilo;

exemplos do “grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo fenilo, um grupo 2-clorofenilo, um grupo 3-clorofenilo, um grupo 4-clorofenilo, um grupo 4-fluorofenilo, um grupo 4-bromofenilo, um grupo 4-iodofenilo, um grupo 2-cianofenilo, um grupo 3-cianofenilo, um grupo 4-cianofenilo, um grupo 2-nitrofenilo, um grupo 3-nitrofenilo, um grupo 4-nitrofenilo, um grupo 2-metilfenilo, um grupo 3-metilfenilo, um grupo 4-metilfenilo, um grupo 2-(trifluorometil)fenilo, um

grupo 3-(trifluorometil)fenilo, um grupo 4-(trifluorometil)fenilo, um grupo 2-metoxifenilo, um grupo 3-metoxifenilo, um grupo 4-metoxifenilo, um grupo 4-(trifluorometoxi)fenilo, um grupo 4-(metiltio)fenilo, um grupo 4-(metilsulfinil)fenilo, um grupo 4-(metilsulfonil)fenilo e um grupo 4-(metoxicarbonil)fenilo;

exemplos do "grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo 2-piridinilo; e

exemplos do "grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo benzilo, um grupo 1-feniletilo, um grupo 2-feniletilo, um grupo 2-clorobenzilo, um grupo 3-clorobenzilo, um grupo 4-clorobenzilo, um grupo 2-cianobenzilo, um grupo 3-cianobenzilo, um grupo 4-cianobenzilo, um grupo 2-nitrobenzilo, um grupo 3-nitrobenzilo, um grupo 4-nitrobenzilo, um grupo 2-metilbenzilo, um grupo 3-metilbenzilo, um grupo 4-metilbenzilo, um grupo 2-(trifluorometil)benzilo, um grupo 3-(trifluorometil)benzilo, um grupo 4-(trifluorometil)benzilo, um grupo 2-metoxibenzilo, um grupo 3-metoxibenzilo e um grupo 4-metoxibenzilo.

Em R⁸ e R⁹, exemplos do “grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilo, um grupo etilo, um grupo 2,2,2-trifluoroetilo, um grupo 2,2,2-tricloroetilo, um grupo propilo, um grupo isopropilo, um grupo butilo, um grupo isobutilo, um grupo sec-butilo, um grupo terc-butilo, um grupo pentilo e um grupo hexilo;

exemplos do “grupo alcóxialquilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-metoxietilo, um grupo 2-etoxietilo e um grupo 2-isopropiloxietilo;

exemplos do “grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-propenilo, um grupo 3-cloro-2-propenilo, um grupo 2-cloro-2-propenilo, um grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, um grupo 2-butenilo, um grupo 3-butenilo, um grupo 2-metil-2-propenilo, um grupo 3-metil-2-butenilo, um grupo 2-pentenilo e um grupo 2-hexenilo;

exemplos do “grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-propinilo, um grupo 3-cloro-2-propinilo, um grupo 3-bromo-2-propinilo, um grupo 2-butinilo e um grupo 3-butinilo;

exemplos do “grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6 incluem um grupo ciclopropilo, um grupo ciclobutilo, um grupo ciclopentilo e um grupo ciclo-hexilo;

exemplos do "grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo fenilo, um grupo 2-clorofenilo, um grupo 3-clorofenilo, um grupo 4-clorofenilo, um grupo 4-fluorofenilo, um grupo 4-bromofenilo, um grupo 4-iodofenilo, um grupo 2-cianofenilo, um grupo 3-cianofenilo, um grupo 4-cianofenilo, um grupo 2-nitrofenilo, um grupo 3-nitrofenilo, um grupo 4-nitrofenilo, um grupo 2-metilfenilo, um grupo 3-metilfenilo, um grupo 4-metilfenilo, um grupo 2-(trifluorometil)fenilo, um grupo 3-(trifluorometil)fenilo, um grupo 4-(trifluorometil)fenilo, um grupo 2-metoxifenilo, um grupo 3-metoxifenilo, um grupo 4-metoxifenilo, um grupo 4-(trifluorometoxi)fenilo, um grupo 4-(metiltio)fenilo, um grupo 4-(metilsulfinil)fenilo, um grupo 4-(metilsulfonil)fenilo e um grupo 4-(metoxycarbonil)fenilo;

exemplos do "grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6

opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo 3-piridinilo;

exemplos do "grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo benzilo, um grupo 1-feniletilo, um grupo 2-feniletilo, um grupo 2-clorobenzilo, um grupo 3-clorobenzilo, um grupo 4-clorobenzilo, um grupo 2-cianobenzilo, um grupo 3-cianobenzilo, um grupo 4-cianobenzilo, um grupo 2-nitrobenzilo, um grupo 3-nitrobenzilo, um grupo 4-nitrobenzilo, um grupo 2-metilbenzilo, um grupo 3-metilbenzilo, um grupo 4-metilbenzilo, um grupo 2-(trifluorometil)benzilo, um grupo 3-(trifluorometil)benzilo, um grupo 4-(trifluorometil)benzilo, um grupo 2-metoxibenzilo, um grupo 3-metoxibenzilo e um grupo 4-metoxibenzilo; e

exemplos do "grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros" quando "R⁸ e R⁹ são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros" incluem um grupo pirrolidin-1-ilo, grupo piperidino, um grupo 3,5-dimetilpiperidino, um grupo hexametilenoimin-1-ilo, um grupo heptametilenoimin-1-ilo, um grupo morfolino, um grupo 2,6-dimetilmorfolino, um grupo tiomorfolin-4-ilo, um grupo 4-metilpiperazin-1-ilo, um grupo 4-(etoxicarbonil)piperazin-1-ilo e um grupo 4-fenilpiperazin-1-ilo.

Em R^{10} , exemplos do “grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilo, um grupo trifluorometilo, um grupo triclorometilo, um grupo etilo, um grupo 2-cloroetilo, um grupo 2,2,2-trifluoroetilo, um grupo propilo, um grupo isopropilo, um grupo butilo, um grupo isobutilo, um grupo sec-butilo, um grupo terc-butilo, um grupo pentilo e um grupo hexilo;

exemplos do “grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo ciclopropilo, um grupo ciclobutilo, um grupo ciclopentilo e um grupo ciclo-hexilo; e

exemplos do “grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo fenilo, um grupo 4-clorofenilo, um grupo 4-nitrofenilo e um grupo 4-metilfenilo.

Em R^{11} e R^{12} , exemplos do “grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilo, um grupo etilo, um grupo 2,2,2-trifluoroetilo, um grupo 2,2,2-tricloroetilo, um grupo propilo, um grupo isopropilo, um grupo butilo, um grupo isobutilo, um grupo sec-butilo, um grupo terc-butilo, um grupo pentilo e um grupo hexilo;

exemplos do “grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo ciclopropilo, um grupo ciclobutilo, um grupo ciclopentilo e um grupo ciclo-hexilo;

exemplos do “grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 grupos independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo fenilo e um grupo 4-metilfenilo; e

exemplos do “grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros” quando “R¹¹ e R¹² são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros” incluem um grupo pirrolidin-1-ilo, um grupo piperidino, um grupo 3,5-dimetilpiperidino, um grupo morfolino, um grupo 2,6-dimetilmorfolino, um grupo tiomorfolin-4-ilo, um grupo 4-metilpiperazin-1-ilo, um grupo 4-(etoxicarbonil)piperazin-1-ilo e um grupo 4-fenilpiperazin-1-ilo.

Em R^{13a} e R^{13b}, exemplos do “grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilo, um grupo fluorometilo, um grupo difluorometilo, um grupo trifluorometilo, um grupo etilo, um grupo 2,2,2-trifluoroetilo, um grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetilo, um grupo propilo, um grupo isopropilo, um grupo butilo, um grupo

isobutilo, um grupo sec-butilo, um grupo terc-butilo, um grupo pentilo e um grupo hexilo;

exemplos do “grupo cianoalquilo C2-C6” incluem um grupo cianometilo e um grupo 2-cianoetilo;

exemplos do “grupo alcoxialquilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metoximetilo, um grupo etoximetilo, um grupo 2-metoxietilo, um grupo 2-etoxietilo e um grupo 2-isopropiloxietilo;

exemplos do “grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-propenilo, um grupo 3-cloro-2-propenilo, um grupo 2-cloro-2-propenilo, um grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, um grupo 2-butenilo, um grupo 3-butenilo, um grupo 2-metil-2-propenilo, um grupo 3-metil-2-butenilo, um grupo 2-pentenilo e um grupo 2-hexenilo;

exemplos do “grupo alcinilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-propinilo, um grupo 3-cloro-2-propinilo, um grupo 3-bromo-2-propinilo, um grupo 2-butinilo e um grupo 3-butinilo;

exemplos do “grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6” incluem um grupo ciclopropilo, um grupo ciclobutilo, um grupo ciclopentilo e um grupo ciclo-hexilo;

exemplos do “grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados de um grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano,

(3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo fenilo, um grupo 2-fluorofenilo, um grupo 3-fluorofenilo, um grupo 4-fluorofenilo, um grupo 2-clorofenilo, um grupo 3-clorofenilo, um grupo 4-clorofenilo, um grupo 2-bromofenilo, um grupo 2-iodofenilo, um grupo 2,6-difluorofenilo, um grupo 2,6-diclorofenilo, um grupo 2-cloro-6-fluorofenilo, um grupo 2-cloro-4-fluorofenilo, um grupo 2-cianofenilo, um grupo 3-cianofenilo, um grupo 4-cianofenilo, um grupo 2-nitrofenilo, um grupo 3-nitrofenilo, um grupo 4-nitrofenilo, um grupo 2-metilfenilo, um grupo 3-metilfenilo, um grupo 4-metilfenilo, um grupo 2-etilfenilo, um grupo 2-isopropilfenilo, um grupo 2-terc-butilfenilo, um grupo 2-(trifluorometil)fenilo, um grupo 3-(trifluorometil)fenilo, um grupo 4-(trifluorometil)fenilo, um grupo 2-metoxifenilo, um grupo 3-metoxifenilo, um grupo 4-metoxifenilo, um grupo 2-etoxifenilo, um grupo 2-(trifluorometoxi)fenilo, um grupo 2-(metiltio)fenilo, um grupo 2-(metilsulfinil)fenilo e um grupo 2-(metilsulfonil)fenilo;

exemplos do "grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente

substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo 2-piridinilo, um grupo 3-fluoro-2-piridinilo, um grupo 3-cloro-2-piridinilo, um grupo 3-bromo-2-piridinilo, um grupo 3-iodo-2-piridinilo, um grupo 3-metil-2-piridinilo, um grupo 3-trifluorometil-2-piridinilo, um grupo 3-metoxi-2-piridinilo, um grupo 3-ciano-2-piridinilo, um grupo 3-nitro-2-piridinilo, um grupo 3-piridinilo, um grupo 2-cloro-3-piridinilo, um grupo 4-cloro-3-piridinilo, um grupo 4-piridinilo, um grupo 3-cloro-4-piridinilo, um grupo 3,5-dicloro-4-piridinilo, um grupo 2-pirimidinilo, um grupo 4-metil-2-pirimidinilo, um grupo 4,6-dimetil-2-pirimidinilo, um grupo 4-pirimidinilo, um grupo 5-cloro-4-pirimidinilo, um grupo pirazinilo, um grupo 3-metil-2-pirazinilo, um grupo 2-tiazolilo, um grupo 1-metil-5-pirazolilo, um grupo 4-cloro-1-metil-5-pirazolilo, um grupo 4-cloro-1,3-dimetil-5-pirazolilo e um grupo 4-cloro-5-metil-3-isooxazolilo;

exemplos do "grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo benzilo, um grupo 1-feniletilo, um grupo 2-feniletilo, um grupo 2-clorobenzilo, um grupo 3-clorobenzilo, um grupo 4-clorobenzilo, um grupo 2-cianobenzilo, um grupo 3-cianobenzilo, um grupo 4-cianobenzilo, um grupo 2-nitrobenzilo, um grupo 3-nitrobenzilo, um grupo 4-nitrobenzilo, um grupo 2-metilbenzilo, um grupo 3-metilbenzilo, um grupo 4-metilbenzilo, um grupo 2-(trifluorometil)benzilo, um grupo 3-(trifluorometil)benzilo,

um grupo 4-(trifluorometil)benzilo, um grupo 2-metoxibenzilo, um grupo 3-metoxibenzilo e um grupo 4-metoxibenzilo; e

exemplos do “grupo piridinilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de piridina pode estar substituída com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-piridinilmetilo, um grupo 3-piridinilmetilo, um grupo 4-piridinilmetilo, um grupo 3-cloro-2-piridinilmetilo grupo e um 2-cloro-3-piridinilmetilo.

Em R^{14a} e R^{14b} , exemplos do “grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilo, um grupo trifluorometilo, um grupo triclorometilo, um grupo clorometilo, um grupo diclorometilo, um grupo fluorometilo, um grupo difluorometilo, um grupo etilo, um grupo pentafluoroetilo, um grupo propilo, um grupo isopropilo, um grupo butilo, um grupo isobutilo, um grupo sec-butilo, um grupo terc-butilo, um grupo pentilo e um grupo hexilo;

exemplos do “grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metóxido, um grupo etóxido, um grupo 2,2,2-trifluoroetóxido, um grupo propóxido, um grupo isopropilóxido, um grupo butóxido, um grupo isobutilóxido, um grupo sec-butoxido e um grupo terc-butoxido;

exemplos do “grupo cianoalquilóxido C2-C6” incluem um grupo cianometóxido e um grupo 2-cianoetóxido;

exemplos do “grupo alcoxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-(metoxi)etoxilo;

exemplos do “grupo alcenilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-propenilo e um grupo 2-metil-2-propenilo;

exemplos do “grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo 2-propinilo e um grupo 2-butinilo;

exemplos do “grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metiltio, um grupo trifluorometiltio, um grupo etiltio, um grupo propiltio, um grupo isopropiltio, um grupo butiltio, um grupo isobutiltio, um grupo sec-butiltio, um grupo terc-butiltio, um grupo pentiltio e um grupo hexiltio;

exemplos do “grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilsulfinilo, um grupo trifluorometilsulfinilo, um grupo etilsulfinilo, um grupo propilsulfinilo, um grupo isopropilsulfinilo, um grupo butilsulfinilo, um grupo isobutilsulfinilo, um grupo sec-butilsulfinilo, um grupo terc-butilsulfinilo, um grupo pentilsulfinilo e um grupo hexilsulfinilo;

exemplos do “grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo metilsulfonilo, um grupo trifluorometilsulfonilo, um grupo etilsulfonilo, um grupo propilsulfonilo, um grupo

isopropilsulfonilo, um grupo butilsulfonilo, um grupo isobutilsulfonilo, um grupo sec-butilsulfonilo, um grupo terc-butilsulfonilo, um grupo pentilsulfonilo e um grupo hexilsulfonilo;

exemplos do "grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo fenilo, um grupo 2-clorofenilo, um grupo 3-clorofenilo, um grupo 4-clorofenilo, um grupo 4-fluorofenilo, um grupo 4-bromofenilo, um grupo 4-iodofenilo, um grupo 2-cianofenilo, um grupo 3-cianofenilo, um grupo 4-cianofenilo, um grupo 2-nitrofenilo, um grupo 3-nitrofenilo, um grupo 4-nitrofenilo, um grupo 2-metilfenilo, um grupo 3-metilfenilo, um grupo 4-metilfenilo, um grupo 2-(trifluorometil)fenilo, um grupo 3-(trifluorometil)fenilo, um grupo 4-(trifluorometil)fenilo, um grupo 2-metoxifenilo, um grupo 3-metoxifenilo, um grupo 4-metoxifenilo e um grupo 4-(trifluorometoxi)fenilo;

exemplos do "grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo" incluem um grupo 2-furilo, um grupo 3-furilo, um grupo 2-piridinilo, um grupo 3-piridinilo, um grupo 4-piridinilo e um grupo pirazinilo;

e

exemplos do “grupo fenoxilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo” incluem um grupo fenoxilo, um grupo 2-clorofenoxilo, um grupo 3-clorofenoxilo, um grupo 4-clorofenoxilo, um grupo 2-cianofenoxilo, um grupo 3-cianofenoxilo, um grupo 4-cianofenoxilo, um grupo 2-nitrofenoxilo, um grupo 3-nitrofenoxilo, um grupo 4-nitrofenoxilo, um grupo 2-metilfenoxilo, um grupo 3-metilfenoxilo, um grupo 4-metilfenoxilo, um grupo 2-(trifluorometil)fenoxilo, um grupo 3-(trifluorometil)fenoxilo, um grupo 4-(trifluorometil)fenoxilo, um grupo 2-metoxifenoxilo, um grupo 3-metoxifenoxilo, um grupo 4-metoxifenoxilo e um grupo 4-(trifluorometoxi)fenoxilo.

Exemplos do grupo representado por J1 incluem um grupo 1-fenilpirazol-5-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-fluoro-1-fenilpirazol-5-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-3-fluoropirazol-5-ilo, um grupo 3-fluoro-1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-fluoro-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-fenilpirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(2-clorofenil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-fenilpirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(2-clorofenil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-iodo-1-

fenilpirazol-5-ilo, um grupo 3-iodo-1-(2-clorofenil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-iodo-1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-iodo-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-metil-1-fenilpirazol-5-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-3-metilpirazol-5-ilo, um grupo 3-metil-1-(2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metilpirazol-5-ilo, um grupo 1-fenil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo,

um grupo 3-cloro-1-metilpirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-etilpirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-isopropilpirazol-5-ilo, um grupo 1-terc-butil-3-cloropirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(3-fluoro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-bromo-2-piridinil)-3-cloropirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(3-iodo-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(3-metil-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(3-metoxi-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(3-ciano-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(3-nitro-2-piridinil)pirazol-5-ilo,

um grupo 3-bromo-1-metilpirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-etilpirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-isopropilpirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-terc-butilpirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(3-fluoro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(3-bromo-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(3-iodo-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(3-metil-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(3-metoxi-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(3-ciano-2-

piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(3-nitro-2-piridinil)pirazol-5-ilo,

um grupo 1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-etil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-isopropil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-terc-butil-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-fluoro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-bromo-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-iodo-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-metil-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-metoxi-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-ciano-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-nitro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)pirazol-5-ilo,

um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-etilpirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropilpirazol-5-ilo, um grupo 3-terc-butil-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(metiltio)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(etiltio)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(isopropiltio)pirazol-5-ilo, um grupo 3-terc-butiltio-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(metilsulfinil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(etilsulfinil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(isopropilsulfinil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-terc-butilsulfinil-1-(3-cloro-2-piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(metilsulfonil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(etilsulfonil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(isopropilsulfonil)pirazol-5-ilo, um grupo 3-terc-butilsulfonil-1-(3-cloro-2-

piridinil)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(2,2,2-trifluoroetoxi)pirazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-cianopirazol-5-ilo,

um grupo 1-(2-clorofenil)pirrol-2-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)pirrol-2-ilo, um grupo 4-cloro-1-(2-clorofenil)pirrol-2-ilo, um grupo 4-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)pirrol-2-ilo, um grupo 5-cloro-1-(2-clorofenil)pirrol-2-ilo, um grupo 5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)pirrol-2-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-4,5-dicloropirrol-2-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-4,5-dicloropirrol-2-ilo, um grupo 4-bromo-1-(2-clorofenil)pirrol-2-ilo, um grupo 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)pirrol-2-ilo, um grupo 5-bromo-1-(2-clorofenil)pirrol-2-ilo, um grupo 5-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)pirrol-2-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-4,5-dibromopirrol-2-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-4,5-dibromopirrol-2-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-4-iodopirrol-2-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-4-iodopirrol-2-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-5-iodopirrol-2-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodopirrol-2-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-4,5-diiiodopirrol-2-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-4,5-diiiodopirrol-2-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-4-(trifluorometil)pirrol-2-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-4-(trifluorometil)pirrol-2-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-5-(trifluorometil)pirrol-2-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-(trifluorometil)pirrol-2-ilo,

um grupo 1-(2-clorofenil)imidazol-2-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)imidazol-2-ilo, um grupo 4-cloro-1-(2-clorofenil)imidazol-2-ilo, um grupo 4-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)imidazol-2-ilo, um grupo 4-bromo-1-(2-clorofenil)imidazol-2-ilo, um grupo 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)imidazol-2-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-4-

(trifluorometil)imidazol-2-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-4-(trifluorometil)imidazol-2-ilo,

um grupo 1-(2-clorofenil)-1,2,4-triazol-5-ilo, um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-1,2,4-triazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(2-clorofenil)-1,2,4-triazol-5-ilo, um grupo 3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1,2,4-triazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(2-clorofenil)-1,2,4-triazol-5-ilo, um grupo 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1,2,4-triazol-5-ilo, um grupo 1-(2-clorofenil)-3-(trifluorometil)-1,2,4-triazol-5-ilo e um grupo 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1,2,4-triazol-5-ilo.

Exemplos do grupo representado por J2 incluem um grupo 1-metil-3-fenilpirazol-4-ilo, um grupo 3-(2-clorofenil)-1-metilpirazol-4-ilo, um grupo 1-metil-3-(2-piridinil)pirazol-4-ilo, um grupo 3-(3-cloro-2-piridinil)-1-metilpirazol-4-ilo, um grupo 1-metil-5-fenilpirazol-4-ilo, um grupo 5-(2-clorofenil)-1-metilpirazol-4-ilo, um grupo 1-metil-5-(2-piridinil)pirazol-4-ilo, um grupo 5-(3-cloro-2-piridinil)-1-metilpirazol-4-ilo, um grupo 3-fenil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, um grupo 3-(2-clorofenil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, um grupo 3-(2-piridinil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, um grupo 3-(3-cloro-2-piridinil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, um grupo 5-fenil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, um grupo 5-(2-clorofenil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, um grupo 5-(2-piridinil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, um grupo 5-(3-cloro-2-piridinil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo, um grupo 1-(difluorometil)-3-fenilpirazol-4-ilo, um grupo 3-(2-clorofenil)-1-(difluorometil)pirazol-4-ilo, um grupo 1-(difluorometil)-3-(2-piridinil)pirazol-4-ilo, um grupo 3-(3-cloro-2-piridinil)-1-(difluorometil)pirazol-4-ilo, um grupo 1-(difluorometil)-5-fenilpirazol-4-ilo, um grupo

5-(2-clorofenil)-1-(difluorometil)pirazol-4-ilo, um grupo
1-(difluorometil)-5-(2-piridinil)pirazol-4-ilo, um grupo
5-(3-cloro-2-piridinil)-1-(difluorometil)pirazol-4-ilo, um grupo
3-(2-clorofenil)-1-etilpirazol-4-ilo, um grupo 3-(3-cloro-2-
piridinil)-1-etilpirazol-4-ilo, um grupo 5-(2-clorofenil)-1-
etilpirazol-4-ilo, um grupo 5-(3-cloro-2-piridinil)-1-
etilpirazol-4-ilo, um grupo 3-(2-clorofenil)-1-isopropilpirazol-
4-ilo, um grupo 3-(3-cloro-2-piridinil)-1-isopropilpirazol-4-
ilo, um grupo 5-(2-clorofenil)-1-isopropilpirazol-4-ilo, um
grupo 5-(3-cloro-2-piridinil)-1-isopropilpirazol-4-ilo, um grupo
3-(2-clorofenil)-1-terc-butilpirazol-4-ilo, um grupo 3-(3-cloro-
2-piridinil)-1-terc-butilpirazol-4-ilo, um grupo
5-(2-clorofenil)-1-terc-butilpirazol-4-ilo e um grupo
5-(3-cloro-2-piridinil)-1-terc-butilpirazol-4-ilo.

Como um exemplo do composto representado pela fórmula (1),
o seguinte composto é mencionado:

Um composto da fórmula (1), em que

R¹ é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6
opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R² é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6
opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R³ é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente
substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo
alcoxycarbonilo C2-C6,

R⁴ é um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo
alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo

de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou

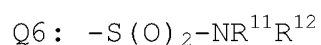
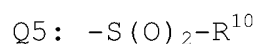
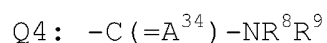
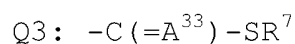
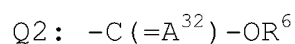
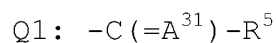
dois grupos R^4 que estão ligados aos átomos de carbono adjacentes são ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo



(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam um átomo de hidrogénio),

n é um número inteiro de 0 a 3,

Q é um grupo representado por Q1 a Q6:



(em que A^{31} , A^{32} e A^{33} são um átomo de oxigénio, A^{34} é um átomo de oxigénio ou um átomo de enxofre,

R⁵ é um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alcoxilo C1-C6, (3) um grupo alquiltio C1-C6, (4) um grupo alquilsulfinilo C1-C6, (5) um grupo alquilsulfonilo C1-C6, (6) um grupo dialquilamino C2-C6 e (7) um grupo cicloalquilo C3-C6; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcóxicarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros opcionalmente substituído com um ou

mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6,

R⁶ é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R⁷ é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

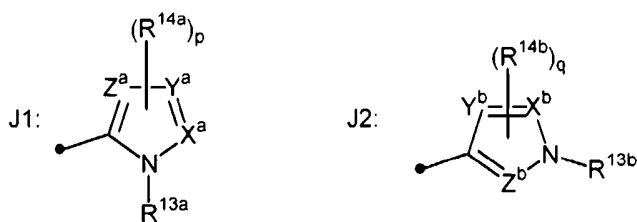
R⁸ e R⁹ são independentemente um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo

alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{10} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{11} e R^{12} são independentemente um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

J é um grupo representado por J1 ou J2:



(em que X^a é CH ou um átomo de azoto, Y^a é CH, Z^a é CH ou um átomo de azoto, X^b é CH ou um átomo de azoto, Y^b é CH, e Z^b é CH ou um átomo de azoto,

R^{13a} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes

independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{13b} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14a} é um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo

de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14b} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

p é um número inteiro de 0 a 2,

q é 1,

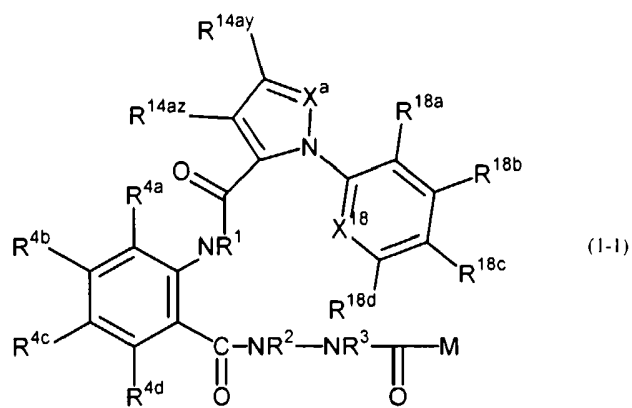
(desde que quando p é 2, dois R^{14a} podem ser iguais ou diferentes)), e

A^1 e A^2 são um átomo de oxigénio.

Exemplos dos espectos específicos do presente composto incluem os seguintes "Aspectos 1 a 32":

"Aspecto 1"

Um composto da fórmula (1-1):



em que

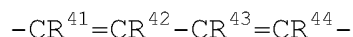
R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo:



(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são um átomo de hidrogénio),

M é R^5 , OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9

(em que

R^5 é um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com um substituinte seleccionado do grupo consistindo de (1) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (2) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros; ou um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros,

R^6 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo,

R^7 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^8 e R^9 são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo, ou R^8 e R^9 são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo morfolino),

X^a é um átomo de azoto,

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e}

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),
e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo.

"Aspecto 2"

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são um átomo de hidrogénio),

M é R^5 , OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9

(em que R^5 é um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com um substituinte seleccionado do grupo consistindo de (1) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (2) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros; ou um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros,

R⁶ é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo,

R⁷ é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R⁸ e R⁹ são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo,

ou R⁸ e R⁹ são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo morfolino),

X^a é CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio; um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio; um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfonilo C1-C6

opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo;
ou um grupo fenilo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e}

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),
e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo.

“Aspecto 3”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6
opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6
opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente
substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo
alcoxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6
opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} é um átomo de hidrogénio,

R^{4c} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4d} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

M é OR^6

(em que R^6 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

X^a é um átomo de azoto,

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto,

R^{18a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,
e

R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

“Aspecto 4”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} é um átomo de hidrogénio,

R^{4c} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4d} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

M é OR^6

(em que R^6 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

X^a é CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto,

X^{18a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,
e

R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

“Aspecto 5”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo metilo ou um grupo metoxicarbonilo,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio, um átomo de cloro, um átomo de bromo, um átomo de iodo, um grupo metilo, um grupo etilo, um grupo trifluorometilo, um grupo metoxilo ou um grupo fenilo,

R^{4c} é um átomo de hidrogénio, um átomo de flúor, um átomo de cloro, um átomo de bromo, um átomo de iodo, um grupo metilo ou um grupo ciano,

R^{4b} e R^{4d} são um átomo de hidrogénio, um átomo de cloro ou um grupo metilo,

M é OR^6

(em que R^6 é um grupo metilo),

X^a é um átomo de azoto,

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de cloro, um átomo de bromo, um grupo ciano, um grupo metilo, um grupo isopropilo, um grupo trifluorometilo, um grupo metiltio, um grupo metilsulfinilo, um grupo metilsulfonilo ou um grupo fenilo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de bromo,

X^{18} é um átomo de azoto,

R^{18a} é um átomo de cloro, e

R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

“Aspecto 6”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo metilo ou um grupo metoxicarbonilo

R^{4a} é um átomo de hidrogénio, um átomo de cloro, um átomo de bromo, um átomo de iodo, um grupo metilo, um grupo etilo, um grupo trifluorometilo, um grupo metoxilo ou um grupo fenilo,

R^{4c} é um átomo de hidrogénio, um átomo de flúor, um átomo de cloro, um átomo de bromo, um átomo de iodo, um grupo metilo ou um grupo ciano,

R^{4b} e R^{4d} são um átomo de hidrogénio, um átomo de cloro ou um grupo metilo,

M é OR^6

(em que R^6 é um grupo metilo),

X^a é CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de cloro, um átomo de bromo, um grupo ciano, um grupo metilo, um grupo isopropilo, um

grupo trifluorometilo, um grupo metiltio, um grupo metilsulfinilo, um grupo metilsulfonilo ou um grupo fenilo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de bromo,

X^{18} é um átomo de azoto,

R^{18a} é um átomo de cloro, e

R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

"Aspecto 7"

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou

R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são um átomo de hidrogénio),

M é OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9

(em que R^6 e R^7 são um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^8 e R^9 são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^8 e R^9 são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo pirrolidin-1-ilo, um grupo piperidino, um grupo hexametilenoimin-1-ilo, um grupo heptametilenoimin-1-ilo, um grupo morfolino, um grupo tiomorfolin-4-ilo ou um grupo 4-fenilpiperazin-1-ilo),

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que X^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto ou um CR^{18e}

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),
e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo.

“Aspecto 8”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é a hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é a hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou

R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são um átomo de hidrogénio),

M é um átomo de hidrogénio,

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído

com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e}

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),
e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo.

“Aspecto 9”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

M é R^5 , OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9 ,

(em que R^5 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^6 e R^7 são um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxiálquilo C3-C6

opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcinilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R⁸ e R⁹ são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R⁸ e R⁹ são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo pirrolidin-1-ilo, um grupo piperidino, um grupo hexametilenoimin-1-ilo, um grupo heptametilenoimin-1-ilo, um grupo morfolino ou um grupo tiomorfolin-4-ilo),

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com um átomo de halogéneo),

R^{14ay} e R^{14az} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos

um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e} ,

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo), e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

"Aspecto 10"

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

M é R^5 , OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9 ,

(em que R^5 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^6 e R^7 são um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^8 e R^9 são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^8 e R^9 são tomados em conjunto com um átomo de azoto ao qual estão ligados para representar um grupo pirrolidin-1-ilo, um grupo piperidino, um grupo hexametilenoimin-1-ilo, um grupo heptametilenoimin-1-ilo, um morfolino ou um grupo tiomorfolin-4-ilo),

X^a é um átomo de azoto,

R^{14ay} e R^{14az} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e} ,

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo), e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

“Aspecto 11”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

M é R^5 , OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9 ,

(em que R^5 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^6 e R^7 são um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^8 e R^9 são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^8 e R^9 são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo pirrolidin-1-ilo, um grupo piperidino, um grupo hexametilenoimin-1-ilo, um grupo heptametilenoimin-1-ilo, um grupo morfolino ou um grupo tiomorfolin-4-ilo),

X^a é CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo

ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} e R^{14az} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e} ,

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo), e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

"Aspecto 12"

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

M é R^5 , OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9 ,

(em que R^5 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^6 e R^7 são um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxiálquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos

um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^8 e R^9 são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^8 e R^9 são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo pirrolidin-1-ilo, um grupo piperidino, um grupo hexametilenoimin-1-ilo, um grupo heptametilenoimin-1-ilo, um grupo morfolino ou um grupo tiomorfolin-4-ilo),

X^a é CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} e R^{14az} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente

substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e} ,

(em que R^{18e} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),
e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

"Aspecto 13"

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} é um átomo de hidrogénio,

R^{4c} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4d} é um átomo de hidrogénio,

M é OR^6 ,

R^6 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

X^a é um átomo de azoto,

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto,

R^{18a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,
e

R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

“Aspecto 14”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} é um átomo de hidrogénio,

R^{4c} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4d} é um átomo de hidrogénio,

M é OR^6 ,

R^6 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

X^a é um CR^{14ax}

(em que R^{14ax} representa um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto,

R^{18a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

"Aspecto 15"

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo metilo ou um grupo metoxicarbonilo,

R^{4a} é um átomo de cloro, um átomo de bromo, um átomo de iodo ou um grupo metilo,

R^{4c} é um átomo de cloro, um átomo de bromo, um átomo de iodo, um grupo metilo ou um grupo ciano,

R^{4b} e R^{4d} são um átomo de hidrogénio,

M é um OR^6 ,

(em que R^6 é um grupo metilo),

X^a é um átomo de azoto,

R^{14ay} é um átomo de cloro, um átomo de bromo ou um grupo trifluorometilo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto,

R^{18a} é um átomo de cloro ou um átomo de bromo, e

R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

"Aspecto 16"

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo metilo ou um grupo metoxicarbonilo,

R^{4a} é um átomo de cloro, um átomo de bromo ou um átomo de iodo, ou um grupo metilo,

R^{4c} é um átomo de cloro, um átomo de bromo, um átomo de iodo, um grupo metilo ou um grupo ciano,

R^{4b} e R^{4d} são um átomo de hidrogénio,

M é OR^6

(em que R^6 é um grupo metilo),

X^a é CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de cloro ou um átomo de bromo),

R^{14ay} é um átomo de cloro, um átomo de bromo ou um grupo trifluorometilo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto,

R^{18a} é um átomo de cloro ou um átomo de bromo, e

R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

“Aspecto 17”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

M é OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9 ,

(em que R^6 e R^7 são um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^8 e R^9 são, cada, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^8 e R^9 são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo pirrolidin-1-ilo, um grupo piperidino, um grupo hexametilenoimin-1-ilo, um grupo heptametilenoimin-1-ilo, um grupo morfolino ou um grupo tiomorfolin-4-ilo),

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} e R^{14az} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e} ,

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo), e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

“Aspecto 18”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^4 são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelos seus terminais para formar um grupo $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} , e R^{44} são, cada, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

M é um átomo de hidrogénio,

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} e R^{14az} são, cada, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e} ,

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo), e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

"Aspecto 19"

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo nitro ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo nitro ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{4d} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo nitro ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

M é R^5 , OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9 ,

(em que R^5 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo cicloalquilo C3-C6,

R^6 e R^7 são um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxiálquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^8 e R^9 são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^8 e R^9 são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo pirrolidin-1-ilo, um grupo piperidino, um grupo hexametilenoimin-1-ilo, um grupo heptametilenoimin-1-ilo, um grupo morfolino, um grupo tiomorfolin-4-ilo ou um grupo 4-metilpiperazin-1-ilo),

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

R^{14ax} , R^{14ay} e R^{14az} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

X^{18} é um átomo de azoto ou um CR^{18e} , e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} e R^{18e} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

“Aspecto 20”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo,

R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são, independentemente, um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),

R^{4d} é um átomo de hidrogénio,

M é R^5 , OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9 ,

(em que R^5 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo cicloalquilo C3-C6,

R^6 e R^7 são um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxialquilo C3-C6

opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R⁸ e R⁹ são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R⁸ e R⁹ são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo pirrolidin-1-ilo, um grupo piperidino, um grupo hexametilenoimin-1-ilo, um grupo heptametilenoimin-1-ilo, um grupo morfolino, um grupo tiomorfolin-4-ilo grupo ou um grupo 4-metilpiperazin-1-ilo),

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax},

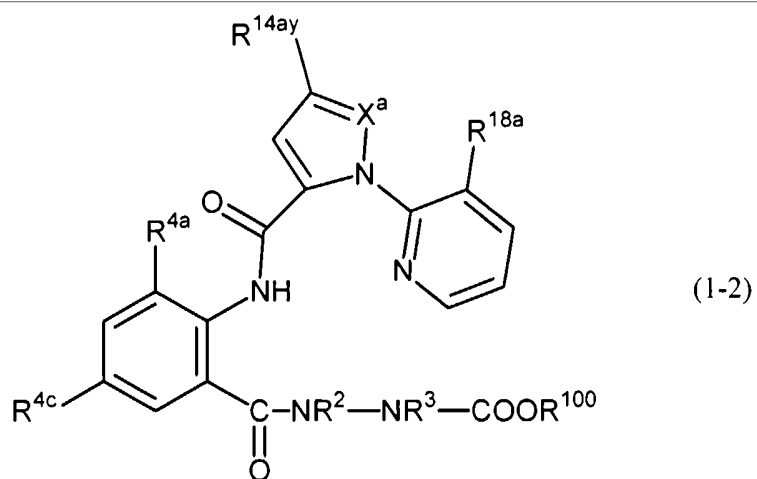
R^{14ax}, R^{14ay} e R^{14az} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

X¹⁸ é um átomo de azoto ou um CR^{18e}, e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} e R^{18e} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

“Aspecto 21”

Um composto representado pela fórmula (1-2):



em que,

R^2 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6,

R^3 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^{4a} representa um átomo de halogéneo ou um grupo metilo,

R^{4c} representa um átomo de halogéneo,

R^{14ay} representa um átomo de halogéneo ou um grupo trifluorometilo,

X^a representa um átomo de azoto ou CH,

R^{18a} representa um átomo de halogéneo, e

R^{100} representa um grupo alquilo C1-C6.

“Aspecto 22”

Um composto da fórmula (1-2), em que

R^2 é um grupo alquilo C1-C6,

R^3 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo metilo,

R^{4c} é um átomo de halogéneo,

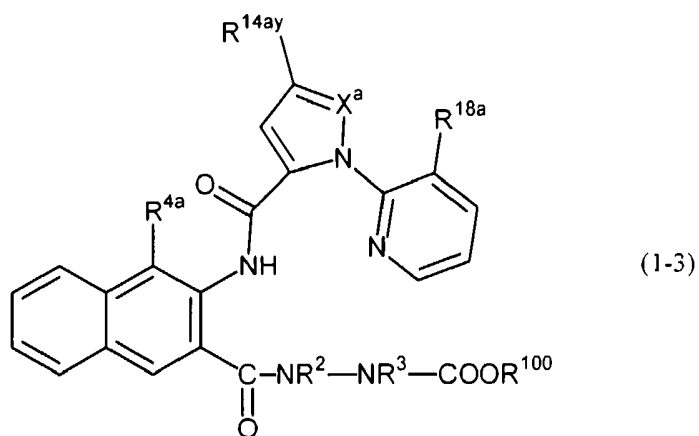
R^{14ay} é um átomo de halogéneo ou um grupo trifluorometilo,

X^a é um átomo de azoto ou CH, e

R^{18a} é um átomo de halogéneo.

“Aspecto 23”

Um composto representado pela fórmula (1-3):



em que

R^2 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6,

R^3 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^{4a} representa um átomo de halogéneo ou um grupo metilo,

R^{14ay} representa um átomo de halogéneo ou um grupo trifluorometilo,

X^a representa um átomo de azoto ou CH,

R^{18a} representa um átomo de halogéneo, e

R^{100} representa um grupo alquilo C1-C6.

“Aspecto 24”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} é um átomo de hidrogénio,

R^{4c} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4d} é um átomo de hidrogénio,

M é OR^6

(em que R^6 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto

R^{18a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,
e

R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

“Aspecto 25”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} é um átomo de hidrogénio,

R^{4c} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4d} é um átomo de hidrogénio,

M é OR^6 ,

(em que R^6 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxiálquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos

um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

X^a é um átomo de azoto,

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X¹⁸ é um átomo de azoto,

R^{18a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

R^{18b}, R^{18c}, R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

"Aspecto 26"

Um composto da fórmula (1-1), em que

R¹ é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} é um átomo de hidrogénio,

R^{4c} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4d} é um átomo de hidrogénio,

M é OR^6 ,

(em que R^6 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxiálquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

X^a é a CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído

com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto,

R^{18a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

“Aspecto 27”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} é um átomo de hidrogénio,

R^{4c} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4d} é um átomo de hidrogénio,

M é OR^6 ,

(em que R^6 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto,

R^{18a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,
e

R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

“Aspecto 28”

Um composto da fórmula (1-1), em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo nitro ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} são, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo nitro ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{4d} é um átomo de hidrogénio,

M é OR^6 ,

(em que R^6 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxiálquilo C3-C6

opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto,

R^{18a} é um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} são um átomo de hidrogénio.

“Aspecto 29”

Um composto representado pela fórmula (1-2), em que

R^2 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6,

R^3 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6,

R^{4a} representa um átomo de halogéneo ou um grupo metilo,

R^{4c} representa um átomo de halogéneo,

R^{14ay} representa um átomo de halogéneo ou um grupo trifluorometilo,

X^a representa um átomo de azoto ou CR^{14ax} (em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),

R^{18a} representa um átomo de halogéneo, e

R^{100} representa um grupo alquilo C1-C6.

“Aspecto 30”

Um composto da fórmula (1-2), em que

R^2 é um grupo alquilo C1-C6,

R^3 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo metilo,

R^{4c} é um átomo de halogéneo,

R^{14ay} é um átomo de halogéneo ou um grupo trifluorometilo,

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax} (em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),

R^{18a} é um átomo de halogéneo, e

R^{100} é um grupo alquilo C1-C6.

“Aspecto 31”

Um composto da fórmula (1-2), em que

R^2 é um grupo alquilo C1-C6,

R^3 é um grupo alquilo C1-C6,

R^{4a} é um átomo de halogéneo ou um grupo metilo,

R^{4c} é um átomo de halogéneo,

R^{14ay} é um átomo de halogéneo ou um grupo trifluorometilo,

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax} (em que R^{14ax} representa um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),

R^{18a} é um átomo de halogéneo, e

R^{100} é um grupo alquilo C1-C6.

"Aspecto 32"

Um composto representado pela fórmula (1-3), em que

R^2 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6,

R^3 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6,

R^{4a} representa um átomo de halogéneo ou um grupo metilo,

R^{14ay} representa um átomo de halogéneo ou um grupo trifluorometilo,

X^a representa um átomo de azoto ou CR^{14ax} (em que R^{14ax} representa um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo),

R^{18a} representa um átomo de halogéneo, e

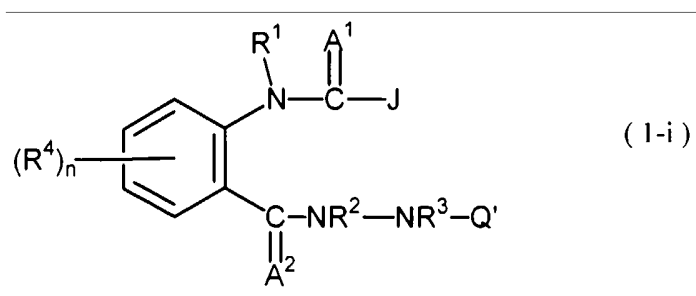
R^{100} representa um grupo alquilo C1-C6.

Daqui em diante será explicado um processo de produção do presente composto.

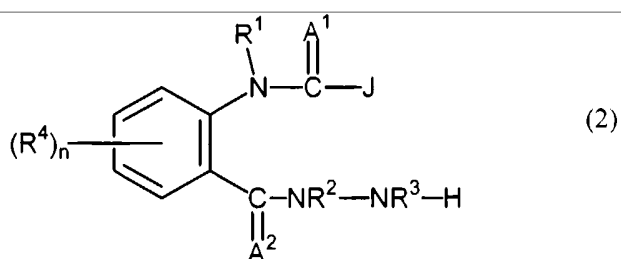
O presente composto pode ser produzido, por exemplo, pelo seguinte Processo A-1 a Processo C-1.

Processo A-1

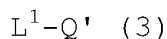
Entre os presentes compostos, um composto representado pela fórmula (1-i):



em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A^1 , A^2 , J e n são como definidos acima, Q' representa um grupo seleccionado do grupo consistindo de $Q1$ a $Q6$ (desde que seja excluído o composto em que Q' é $Q4$, e R^8 e R^9 são um átomo de hidrogénio) (daqui em diante, referido como o composto (1-i)) pode ser produzido fazendo reagir um composto representado pela fórmula (2):



em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A^1 , A^2 , J e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (2)), e um composto representado pela fórmula (3):



em que Q' é como definido acima e L^1 representa um átomo de halogéneo ou um grupo $Q'-O-$ (desde que seja excluído o caso em que Q' é Q_4 , e R^8 e R^9 são um átomo de hidrogénio) (daqui em diante, referido como o composto (3)).

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente a ser utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter metílico e terc-butílico, e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

A quantidade do composto (3) a ser utilizada na reacção é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (2).

A reacção é realizada na presença de uma base, se necessário. Exemplos da base incluem compostos heterocíclicos contendo azoto tais como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]7-undeceno (DBU), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]5-noneno (DBN) e semelhantes, aminas terciárias tais

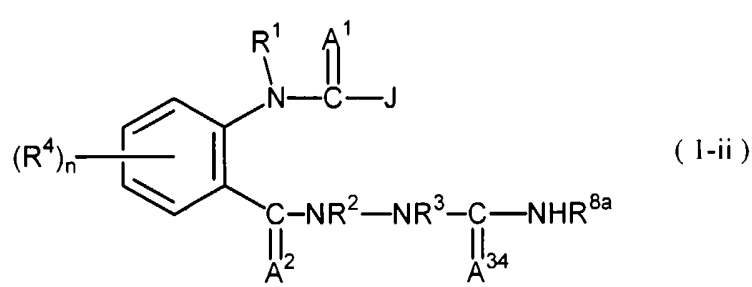
como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina e semelhantes, e bases inorgânicas tais como carbonato de potássio, hidreto de sódio e semelhantes. A quantidade da base, quando a reacção é realizada na presença da base, é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (2), embora a base possa ser utilizada numa quantidade em excesso no caso de a base utilizada ser líquida nas condições reaccionais tal como a piridina e semelhantes.

A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 0 a 100 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (1-i) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico ou recolhendo um precipitado depositado por filtração. O composto (1-i) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

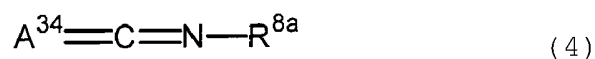
Processo A-2

Entre os presentes compostos, um composto representado pela fórmula (1-ii):



em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A^1 , A^2 , A^{34} , J e n são como definidos acima, e R^{8a} representa um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcoxialquilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com um 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxicarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes

independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo (daqui em diante, referido como o composto (1-ii)) pode ser produzido fazendo reagir o composto (2) com um composto representado pela fórmula (4):



em que A^{34} e R^{8a} são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (4)).

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente a ser utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

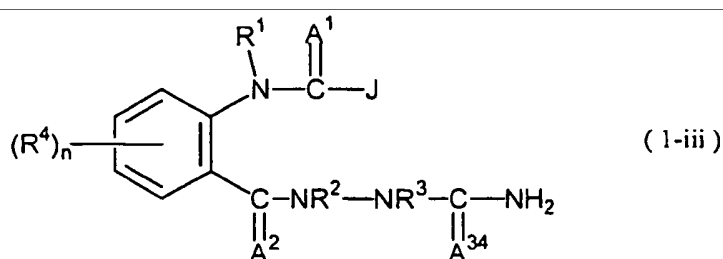
A quantidade do composto (4) utilizada na reacção é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (2).

A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 0 a 100 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (1-ii) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico, ou recolhendo um precipitado depositado por filtração. O composto (1-ii) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Processo A-3

Entre os presentes compostos, um composto representado pela fórmula (1-iii):



em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A^1 , A^2 , A^{34} , J e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (1-iii)) pode ser produzido fazendo reagir o composto (2) e um cianato ou um tiocianato.

A reacção é realizada na presença de um solvente. Exemplos do solvente utilizado na reacção incluem ácidos tais como ácidos orgânicos tais como ácidos acéticos e semelhantes e ácidos

minerais tal como ácido clorídrico e semelhantes, como também uma mistura destes ácidos e água, clorofórmio ou semelhantes.

A quantidade do cianato ou do tiocianato utilizado na reacção é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (2).

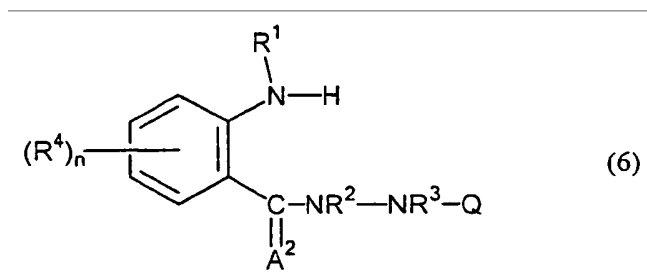
A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 0 a 100 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Exemplos do cianato ou do tiocianato incluem cianato de potássio, cianato de sódio, cianato de amónio, tiocianato de potássio, tiocianato de sódio e tiocianato de amónio.

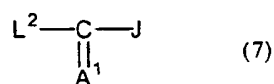
Uma vez concluída a reacção, o composto (1-iii) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico ou recolhendo um precipitado depositado por filtração. O Composto (1-iii) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Processo B-1

O presente composto pode ser produzido fazendo reagir um composto representado pela fórmula (6):



em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A^2 , Q e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como Composto (6)) e um composto representado pela fórmula (7):



em que A^1 e J são como definidos acima e L^2 representa um átomo de halogéneo (daqui em diante, referido como o composto (7)).

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

A quantidade do composto (7) utilizada na reacção é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (6).

A reacção é realizada na presença de uma base, se necessário. Exemplos da base incluem compostos heterocíclicos contendo azoto tais como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]7-undeceno (DBU), 1,5-diazadicyclo[4.3.0]5-noneno (DBN) e semelhantes, aminas terciárias tais como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina e

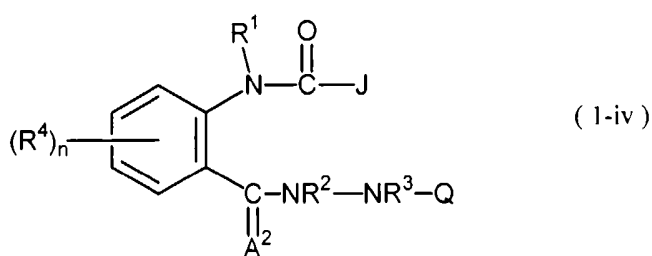
semelhantes, e bases inorgânicas tais como carbonato de potássio, hidreto de sódio e semelhantes. A quantidade da base, quando a reacção é realizada na presença da base, é habitualmente 1 a 2 mole por 1 mol do composto (6), embora a base possa ser utilizada numa quantidade em excesso no caso de a base utilizada ser líquida nas condições reaccionais tal como a piridina e semelhantes.

A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 0 a 100 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o presente composto pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico, ou recolhendo um precipitado depositado por filtração. O presente composto isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

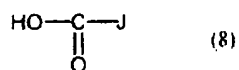
Processo B-2

Entre os presentes compostos, um composto representado pela fórmula (I-iv):



em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A^2 , J , Q e n são como definidos acima (daqui em diante referido como o composto (I-iv)) pode ser

produzido fazendo reagir o composto (6) e um composto representado pela fórmula (8):



em que J é como definido acima (daqui em diante, referido como o composto (8)) na presença de um agente de desidratação.

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente a ser utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

A quantidade do composto (8) utilizada na reacção é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (6).

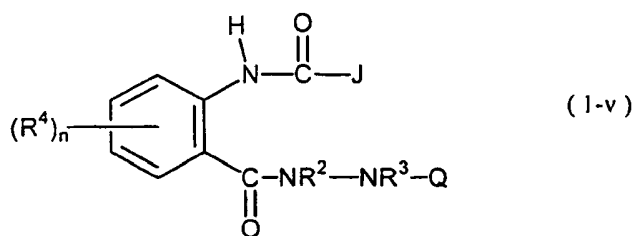
Exemplos do agente de desidratação a ser utilizado na reacção incluem carbodiimidas tais como diciclo-hexilcarbodiimida (DCC), cloridrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida (WSC) e semelhantes. A quantidade da agente de desidratação a ser utilizada é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (6).

A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 0 a 100 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

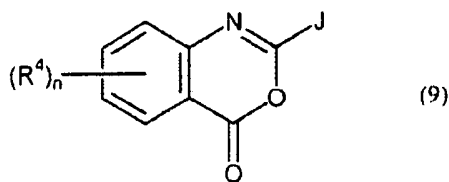
Uma vez concluída a reacção, o composto (I-iv) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico, ou recolhendo um precipitado depositado por filtração. O composto (1-iv) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Processo C-1

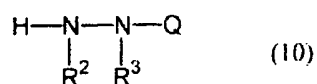
Entre os presentes compostos, um composto representado pela fórmula (1-v):



em que R^2 , R^3 , R^4 , J, Q e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (1-v)) pode ser produzido fazendo reagir um composto representado pela fórmula (9):



em que R^4 , J e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (9)) e um composto representado pela fórmula (10):



em que R^2 , R^3 e Q são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (10)).

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

A quantidade do composto (10) a ser utilizada na reacção é habitualmente 1 a 20 mol por 1 mol do composto (9).

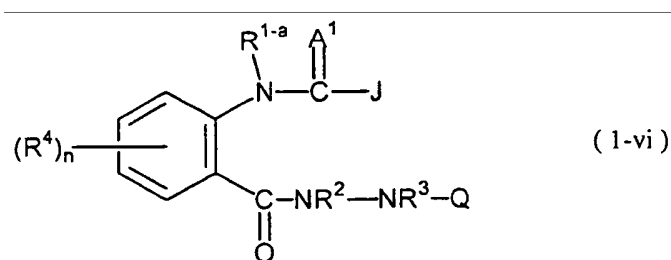
A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 0 a 100 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 48 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (1-v) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico, ou recolhendo um precipitado

depositado por filtração. O composto (1-v) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

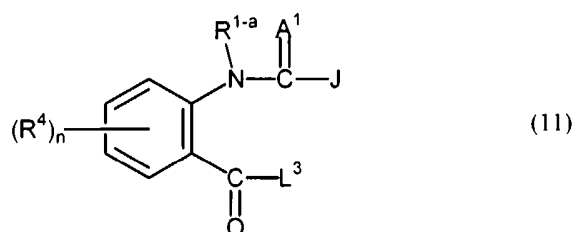
Processo C-2

Entre os presentes compostos, um composto representado pela fórmula (1-vi):



em que R^2 , R^3 , R^4 , A^1 , J , Q e n são como definidos acima, R^{1-a} representa um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cianoalquilo C2-C6; um grupo alcoxialquilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilalquilo C7-C9 em que a parte de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo (daqui em diante, referido como o composto (1-vi)) pode ser

produzido fazendo reagir um composto representado pela fórmula (11):



em que R^{1-a} , R^4 , A^1 , J e n são como definidos acima, e L^3 representa um átomo de halogéneo (daqui em diante, referido como o composto (11)) e o composto (10).

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente a ser utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dietilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

A quantidade do composto (10) a ser utilizada na reacção é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (11).

A reacção é realizada na presença de uma base, se necessário. Exemplos da base incluem compostos heterocíclicos contendo azoto tais como piridina, picolina, 2,6-lutidina,

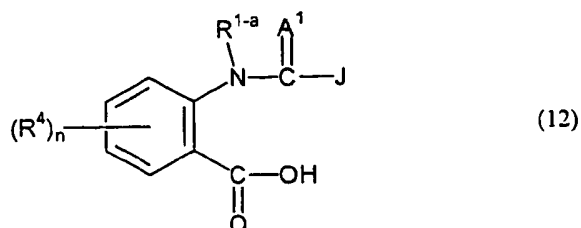
1,8-diazabicyclo[5.4.0]7-undeceno (DBU),
1,5-diazabicyclo[4.3.0]5-noneno (DBN) e semelhantes, amins terciárias tais como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina e semelhantes, e bases inorgânicas tais como carbonato de potássio, hidreto de sódio e semelhantes. A quantidade da base a ser utilizada, quando a reacção é realizada na presença da base, é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (11), embora a base possa ser utilizada numa quantidade em excesso no caso da base utilizada ser líquida nas condições reaccionais tal como a piridina e semelhantes.

A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 0 a 100 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (1-vi) pode ser isolado depois de verter a mistura reaccional para água e extrair a mistura com um solvente orgânico, ou recolher um precipitado depositado por filtração. O composto (1-vi) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Processo C-3

O composto (1-vi) também pode ser produzido fazendo reagir um composto representado pela fórmula (12):



em que R^4 , R^{1-a} , A^1 , J e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como Composto (12)) e o composto (10) na presença de um agente de desidratação.

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente a ser utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

A quantidade do composto (10) utilizada na reacção é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (12).

Exemplos do agente de desidratação utilizado na reacção incluem carbodiimidas tais como diciclo-hexilcarbodiimida (DCC), cloridrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida (WSC) e semelhantes. A quantidade da agente de desidratação a ser utilizada é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (12).

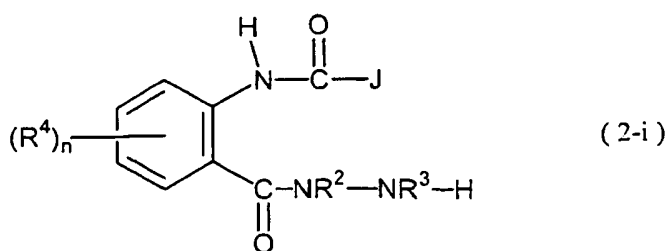
A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 0 a 100 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (1-vi) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico, ou recolhendo um precipitado depositado por filtração. O composto (1-vi) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

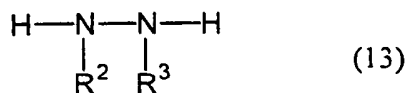
Em seguida será explicado um processo para produzir intermediários para produzir o presente composto.

Processo de Referência 1

Entre o composto (2), um composto representado pela fórmula (2-i):



em que R^2 , R^3 , R^4 , J e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (2-i)) pode ser produzido fazendo reagir o composto (9) e um composto representado pela fórmula (13):



em que R^2 e R^3 são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (13)).

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, álcoois tais como metanol, etanol, 2-propanol e semelhantes, e uma sua mistura.

A quantidade do composto (13) a ser utilizada na reacção é habitualmente 1 a 5 mol por 1 mol do composto (9).

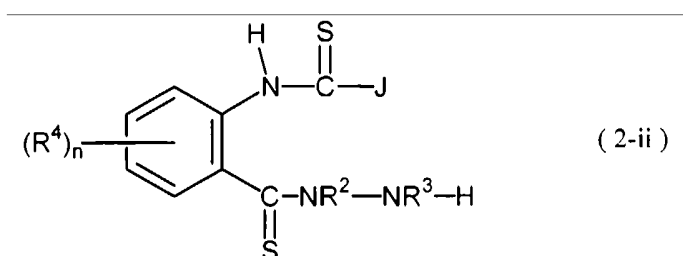
A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de -50 a 100 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (2-i) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico, ou recolhendo um precipitado depositado por filtração. O composto (2-i) isolado pode ser

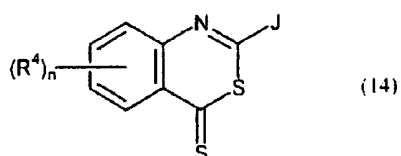
ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Processo de Referência 2

Entre o composto (2), um composto representado pela fórmula (2-ii):



em que R^2 , R^3 , R^4 , J e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como Composto (2-ii)) pode ser produzido fazendo reagir um composto representado pela fórmula (14):



em que R^4 , J e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (14)) e o composto (13).

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente a ser utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano,

clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, álcoois tais como metanol, etanol, 2-propanol e semelhantes, e uma sua mistura.

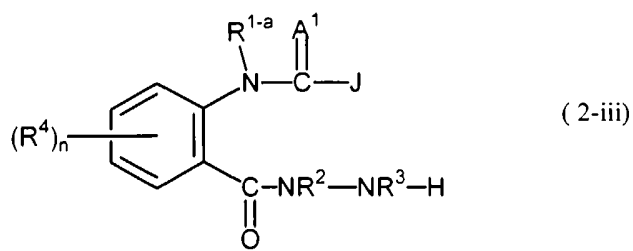
A quantidade do composto (13) a ser utilizada na reacção é habitualmente 1 a 5 mol por 1 mol do composto (14).

A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de -50 a 100 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (2-ii) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico, ou recolhendo um precipitado depositado por filtração. O composto (2-ii) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Processo de Referência 3

Entre o composto (2), um composto representado pela fórmula (2-iii):



em que R^{1-a} , R^2 , R^3 , R^4 , A^1 , J e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (2-iii)) pode ser produzido fazendo reagir o composto (11) e o composto (13).

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

A quantidade de Composto (13) utilizada na reacção é habitualmente 2 a 10 mol por 1 mol do composto (11).

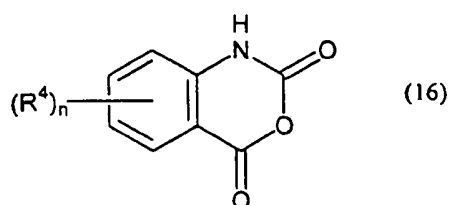
A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de -50 a 100 °C e o tempo de reacção é na gama de 0,1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (2-iii) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico, ou recolhendo um precipitado depositado por filtração. O composto (2-iii) isolado pode ser

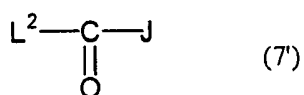
ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Processo de Referência 4

O composto (9) pode ser produzido fazendo reagir um composto representado pela fórmula (16).



em que R^4 e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (16)) e um composto representado pela fórmula (7'):



em que J e L^2 são como definidos acima (daqui em diante, referido como Composto (7')).

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente na presença de uma base. Exemplos do solvente a ser utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos

tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

A quantidade do composto (7') utilizada na reacção é habitualmente 0,5 a 2 mol por 1 mol do composto (16).

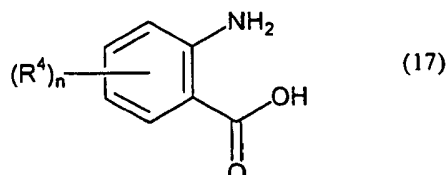
Exemplos da base a ser utilizada na reacção incluem compostos heterocíclicos contendo azoto tais como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]7-undeceno (DBU), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]5-noneno (DBN) e semelhantes, aminas terciárias tais como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina e semelhantes, e bases inorgânicas tais como carbonato de potássio, hidreto de sódio e semelhantes. A quantidade da base a ser utilizada é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (16), embora a base possa ser utilizada numa quantidade em excesso no caso de a base ser líquida nas condições reaccionais tal como a piridina e semelhantes.

A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 50 a 150 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (9) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico, ou recolhendo um precipitado depositados por filtração. O composto (9) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Processo de Referência 5

O composto (9) pode ser produzido fazendo reagir um composto representado pela fórmula (17):



em que R^4 e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como Composto (17)) e o composto (7').

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente a ser utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

O processo compreende o seguinte passo 5-1 e passo 5-2.

Passo 5-1

Este passo é realizado fazendo reagir o composto (17) e o composto (7') na presença de uma base.

A quantidade do composto (7') a ser utilizada neste passo é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (17). Exemplos da base incluem compostos heterocíclicos contendo azoto tais como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]7-undeceno (DBU), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]5-noneno (DBN) e semelhantes, aminas terciárias tais como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina e semelhantes, e bases inorgânicas tais como carbonato de potássio, hidreto de sódio e semelhantes. A quantidade da base a ser utilizada é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (17).

A temperatura de reacção deste passo é habitualmente numa gama de 0 a 50 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Após conclusão deste passo, a mistura reaccional é, habitualmente, utilizada tal e qual no passo 5-2 seguinte.

Passo 5-2

Este passo é realizado fazendo reagir a mistura reaccional do passo 5-1 e um halogeneto de sulfonilo na presença de uma base.

Exemplos do halogeneto de sulfonilo utilizado neste passo incluem cloreto de metanossulfonilo, cloreto de

p-toluenossulfonilo e cloreto de trifluorometanossulfonilo. A quantidade da halogeneto de sulfonilo a ser utilizada neste passo é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (17) utilizado no passo 5-1.

Exemplos da base incluem as mesmas bases como as descritas em relação ao passo 5-1. A quantidade da base é habitualmente 2 a 4 mol por 1 mol do composto (17) utilizado no passo 5-1.

A temperatura de reacção deste passo é habitualmente numa gama de 0 a 50 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Após conclusão deste passo, o composto (9) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água, seguido de extracção convencional com um solvente orgânico. O composto (9) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Processo de Referência 6

O composto (14) pode ser produzido fazendo reagir o composto (9) com um agente de tiocarbonilação.

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente a ser utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico, diglima e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos

tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, piridinas tais como piridina, picolina, lutidina e semelhantes, e uma sua mistura.

Exemplos do agente de tiocarbonilação a ser utilizado na reacção incluem pentassulfureto de difósforo, reagente de Lawesson (2,4-dissulfureto de 2,4-bis-(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano) e semelhantes.

A quantidade da agente de tiocarbonilação a ser utilizada na reacção é habitualmente 1 a 3 mol por 1 mol do composto (9).

A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 0 °C a 200 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (14) pode ser isolado recolhendo um precipitado depositado na mistura reaccional por filtração ou extraíndo a mistura reaccional com um solvente orgânico. O isolado composto (14) pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Processo de Referência 7

O composto (11) pode ser produzido fazendo reagir o composto (12) com um agente de halogenação.

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente a ser utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes,

hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

Exemplos do agente de halogenação a ser utilizado na reacção incluem cloreto de tionilo, brometo de tionilo, oxicloreto de fósforo, oxibrometo de fósforo, pentacloreto de fósforo, cloreto de oxalilo e fosgénio.

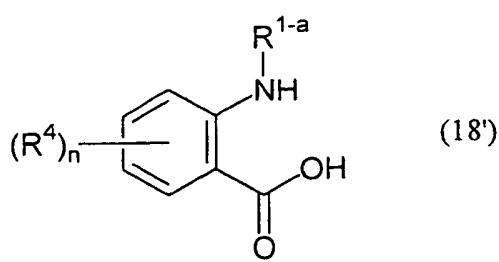
A quantidade do agente de halogenação a ser utilizada na reacção é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (12) e, em alguns casos, o agente de halogenação pode ser utilizado numa quantidade em excesso.

A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 0 °C a 150 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (11) pode ser isolado recolhendo um precipitado depositado na mistura reaccional ou concentrando a mistura reaccional. O composto (11) isolado é habitualmente utilizado tal e qual no passo seguinte e, se necessário, pode ser ainda purificado por recristalização ou semelhantes.

Processo de Referência 8

O composto (12) pode ser produzido fazendo reagir um composto representado pela fórmula (18'):



em que R^{1-a} , R^4 e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto (18')) e o composto (7).

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, e uma sua mistura.

A quantidade do composto (7) a ser utilizada na reacção é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (18').

A reacção é realizada na presença de uma base. Exemplos da base a ser utilizada incluem compostos heterocíclicos contendo

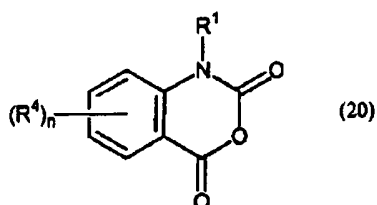
azoto tais como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]7-undeceno (DBU), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]5-noneno (DBN) e semelhantes, aminas terciárias tais como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina e semelhantes, bases inorgânicas tais como carbonato de potássio, hidreto de sódio e semelhantes. A quantidade da base a ser utilizada é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (18').

A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de 0 a 50 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

Uma vez concluída a reacção, o composto (12) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água, seguida de extracção convencional com um solvente orgânico ou recolhendo um precipitado depositado por filtração. O composto (12) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Processo de Referência 9

O composto (6) pode ser produzido fazendo reagir um composto representado pela fórmula (20):



em que R^1 , R^4 e n são como definidos acima (daqui em diante, referido como o composto 20)) e o composto (10).

A reacção é realizada na presença ou ausência de um solvente. Exemplos do solvente utilizado na reacção incluem éteres tais como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetra-hidrofurano, éter terc-butil-metílico e semelhantes, hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno e semelhantes, hidrocarbonetos tais como tolueno, benzeno, xileno e semelhantes, nitrilos tal como acetonitrilo e semelhantes, solventes polares apróticos tais como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, dimetilsulfóxido e semelhantes, álcoois tais como metanol, etanol, álcool isopropílico e semelhantes, e uma sua mistura.

A quantidade do composto (10) a ser utilizada na reacção é habitualmente 1 a 2 mol por 1 mol do composto (20).

A temperatura de reacção é habitualmente numa gama de -20 a 150 °C e o tempo de reacção é habitualmente numa gama de 0,1 a 24 horas.

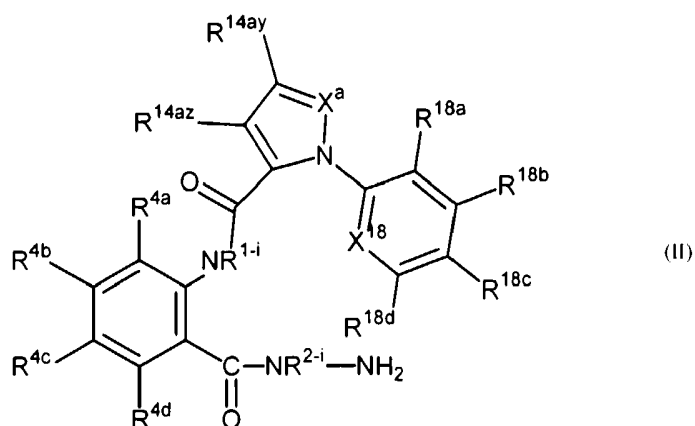
Uma vez concluída a reacção, o composto (20) pode ser isolado vertendo a mistura reaccional para água e extraíndo a mistura com um solvente orgânico, ou recolhendo um precipitado depositado por filtração. O Composto (20) isolado pode ser ainda purificado por recristalização, cromatografia ou semelhantes.

Os compostos (3), (4) e (13) são compostos conhecidos ou podem ser produzidos a partir de compostos conhecidos de acordo com processos conhecidos (e. g. ver Organic Functional Group

Preparations, 2^a edição, Vol. 1, capítulo 12, p. 359-376 (Stanley R. Sandler, Wolf Karo.) ou Organic Functional Group Preparations, 2nd edition, Vol. 1, capítulo 14, p. 434-465 (Stanley R. Sandler, Wolf Karo.)).

Como um aspecto do composto (2), o qual não faz parte da presente invenção, é mencionado o seguinte composto:

Um composto de hidrazida da fórmula (II):



em que

R^{1-i} representa um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{2-i} representa um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo,

R^{4a} representa um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} representam, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo

alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

ou R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo T1: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

X^a representa um átomo de azoto ou CR^{14ax} (em que R^{14ax} representa um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} e R^{14az} representam, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

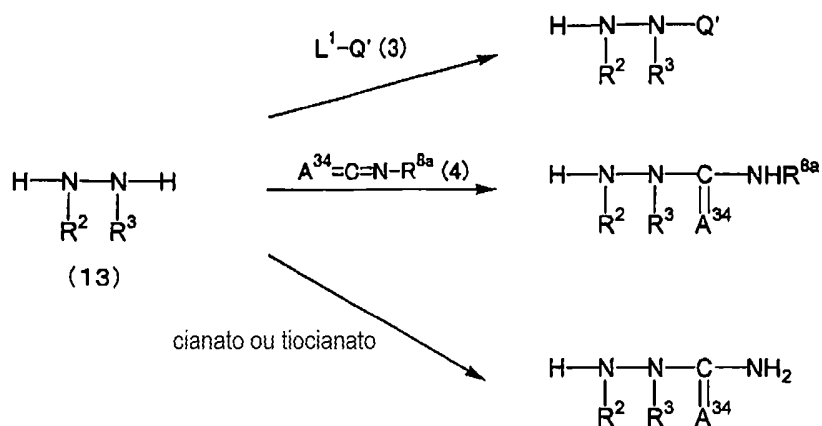
X^{18} representa um átomo de azoto ou CR^{18e} (em que R^{18e} representa um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{18a} representa um átomo de halogéneo, ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} representam, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

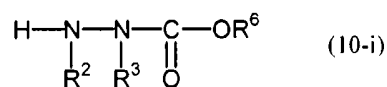
O composto (10) pode ser produzido, por exemplo, segundo o esquema (1) seguinte.

Esquema (1)



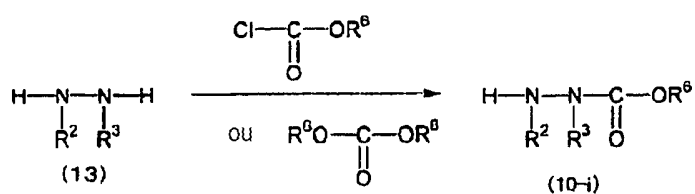
No Esquema (I), A^{34} , L^1 , Q' , R^2 , R^3 e R^{8a} são como definidos acima.

Entre o composto (10), um composto representado pela fórmula (10-i):



em que R^2 , R^3 e R^6 são como definidos acima, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o esquema (2) seguinte.

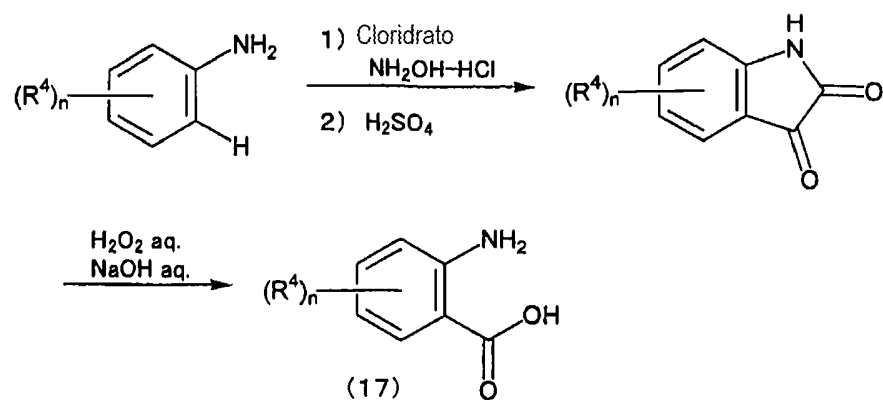
Esquema (2)



No Esquema (2), R^2 , R^3 e R^6 são como definidos acima.

O composto (17) pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o seguinte Esquema (3).

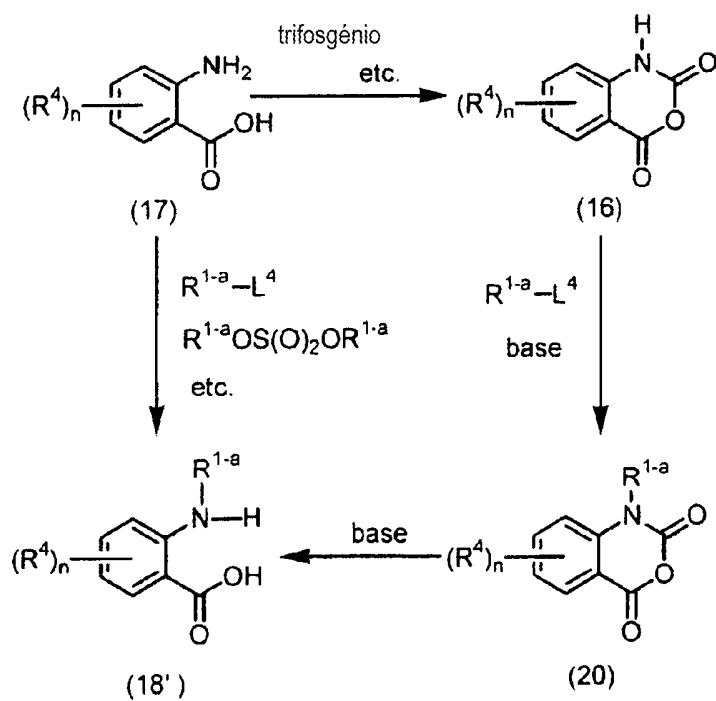
Esquema (3)



No Esquema (3), R^4 e n são como definidos acima.

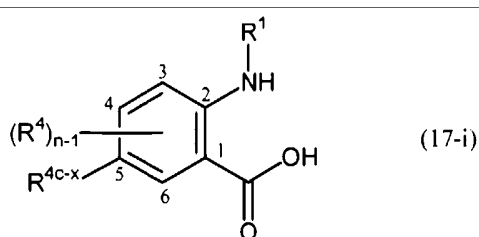
Os compostos (16), (18') e (20) podem ser produzidos, por exemplo, de acordo com o Esquema (4) seguinte.

Esquema (4)



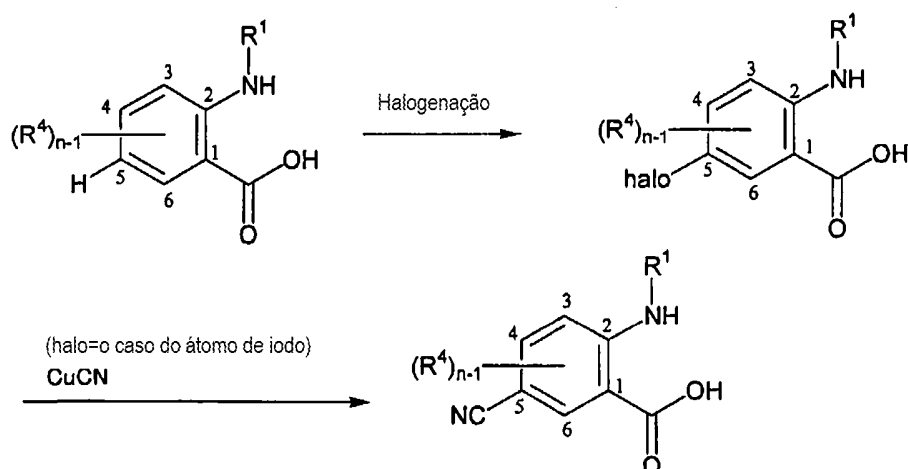
No Esquema (4), R^{1-a} , R^4 e n são como definidos acima, e L^4 representa um grupo de saída (e. g. um átomo de halogéneo, um grupo metanossulfoniloxilo, um grupo p-toluenossulfoniloxilo etc.).

Entre os compostos (17) e (18), um composto representado pela fórmula (17-i):



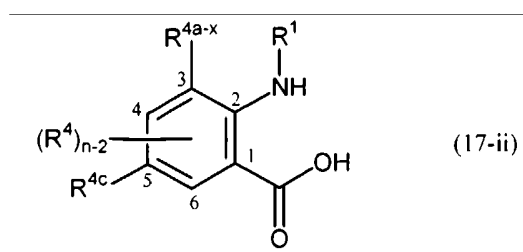
em que R^1 e R^4 são como definidos acima, R^{4c-x} representa um átomo de halogéneo ou um grupo ciano, e $n-1$ representa um número inteiro de 0 a 3, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o seguinte Esquema (5).

Esquema (5)



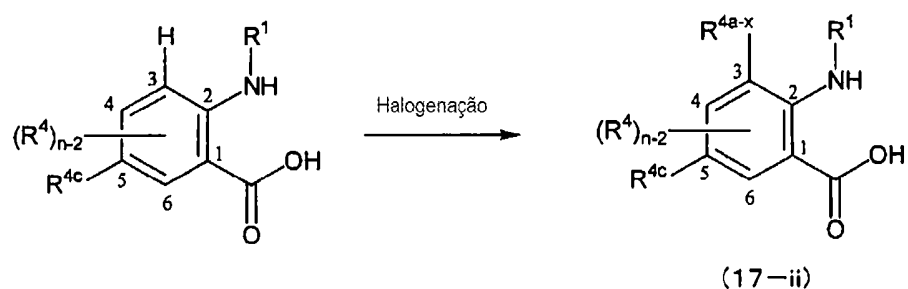
No Esquema (5), R^1 , R^4 e $n-1$ são como definidos acima e halo representa um átomo de halogéneo.

Entre os compostos (17) e (18), um composto representado pela fórmula (17-ii):



em que R^1 e R^4 são como definidos acima, R^{4a-x} representa um átomo de halogéneo, R^{4c} representa o mesmo significado que o de R^4 e $n-2$ representa um número inteiro de 0 a 2, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o seguinte Esquema (6).

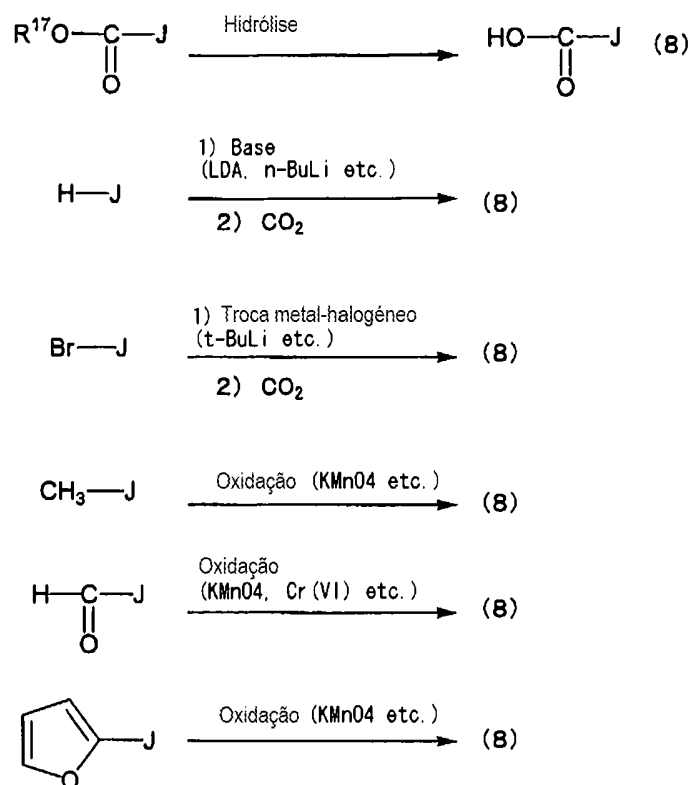
Esquema (6)



No Esquema (6), R^1 , R^4 , R^{4a-x} , R^{4c} e $n-2$ são como definidos acima.

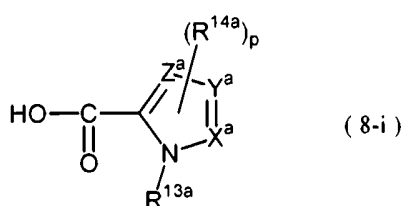
O composto (8) pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (7) seguinte.

Esquema (7)



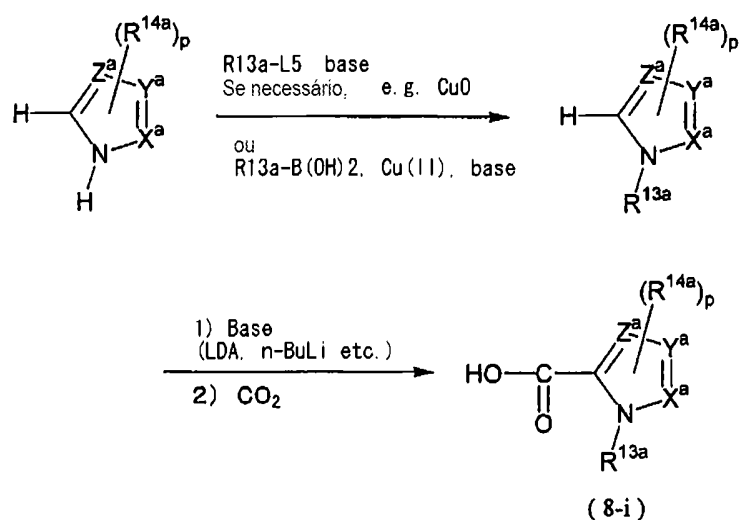
No Esquema (7), J é como definido acima, R¹⁷ representa um grupo metilo ou um grupo etilo, LDA representa diisopropilamida de lítio, n-BuLi representa butil normal-lítio e t-BuLi representa butil terciário-lítio.

Entre o composto (8), um composto representado pela fórmula (8-i)



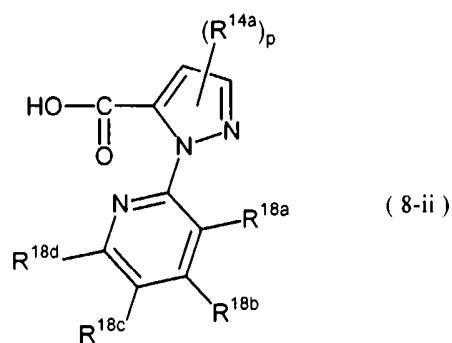
em que R^{13a} , R^{14a} , X^a , Y^a , Z^a e p são como definidos acima, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (8) seguinte.

Esquema (8)



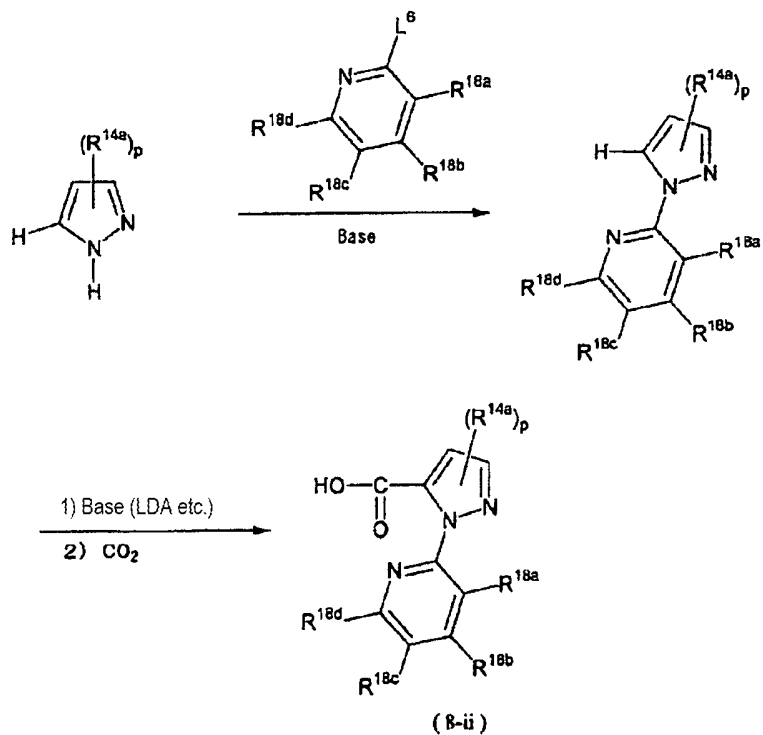
No Esquema (8), R^{13a} , R^{14a} , X^a , Y^a , Z^a , p , LDA e $n-BuLi$ são como definidos acima e L^5 representa um grupo de saída (e. g. um átomo de halogéneo, um grupo metanossulfoniloxilo, um grupo p-toluenossulfoniloxilo, um grupo metilsulfonilo etc.).

Entre o composto (8), um composto representado pela fórmula (8-ii):



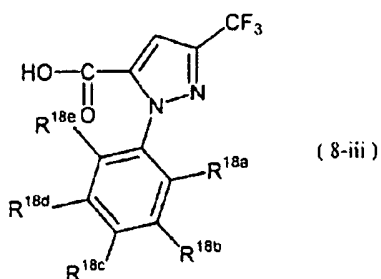
em que R^{14a} e p são como definidos acima, R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} representam, cada, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo nitro, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (9) seguinte.

Esquema (9)



No Esquema (9), R^{14a} , R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} , LDA e p são como definidos acima e L^6 representa um grupo de saída (e. g. um átomo de halogéneo, um grupo metilsulfonilo etc.).

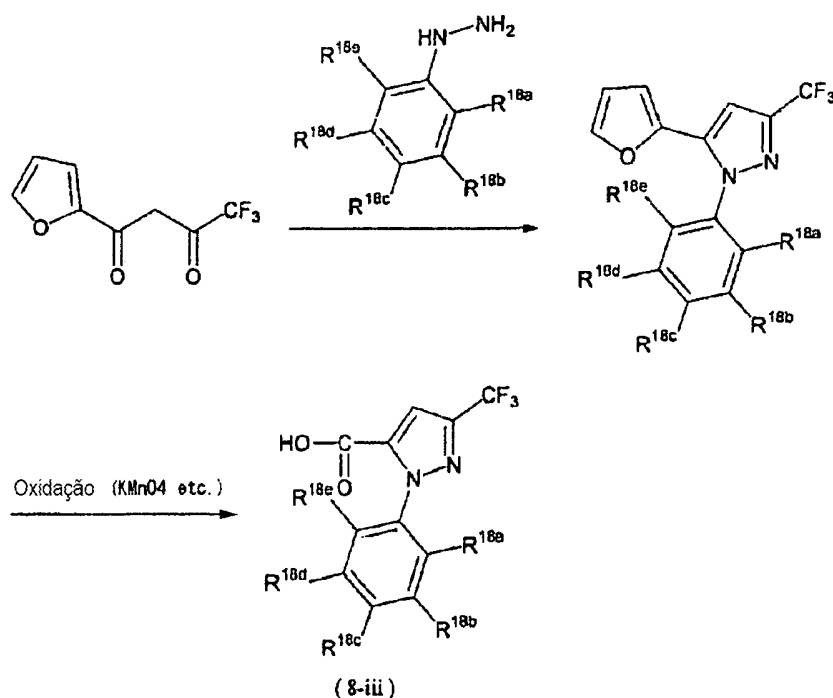
Entre o composto (8), um composto representado pela fórmula (8-iii):



em que R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} e R^{18e} representam, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano,

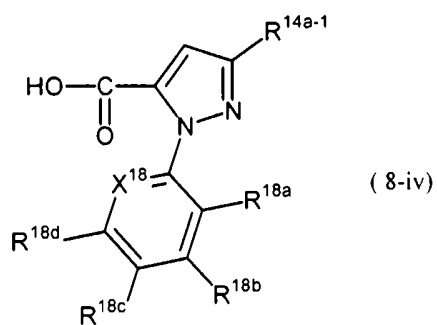
um grupo nitro, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (10) seguinte.

Esquema (10)



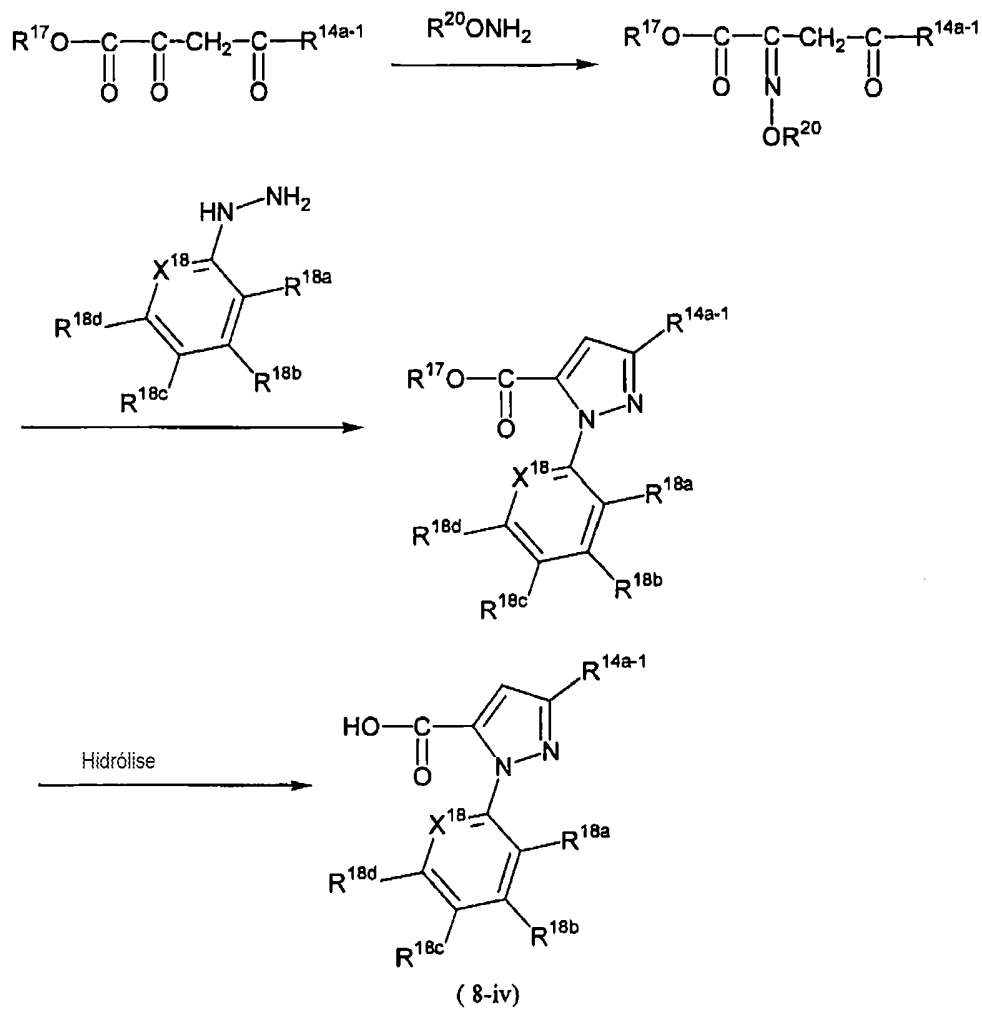
No Esquema (10), R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} e R^{18e} são como definidos acima.

Entre o composto (8), um composto representado pela fórmula (8-iv):



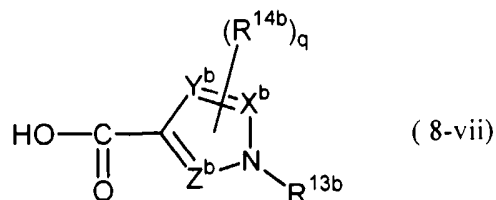
em que X^{18} representa $-N-$, ou $-CR^{18e}-$; R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} e R^{18e} são como definidos acima e R^{14a-1} representa um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (11) seguinte.

Esquema (11)



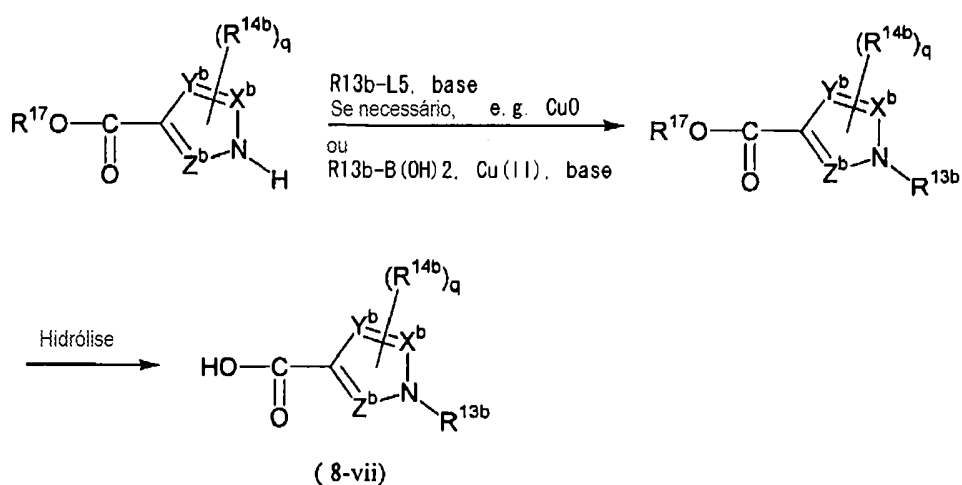
No Esquema (11), $\text{R}^{14\text{a-1}}$, R^{17} , $\text{R}^{18\text{a}}$, $\text{R}^{18\text{b}}$, $\text{R}^{18\text{c}}$, $\text{R}^{18\text{d}}$ e X^{18} são como definidos acima e R^{20} representa um grupo metilo ou um grupo etilo.

Entre o composto (8), um composto representado pela fórmula (8-vii):



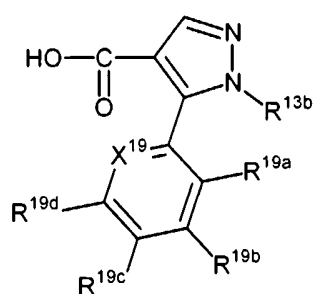
em que R^{13b} , R^{14b} , X^b , Y^b , Z^b e q são como definidos acima, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (14) seguinte.

Esquema (14)

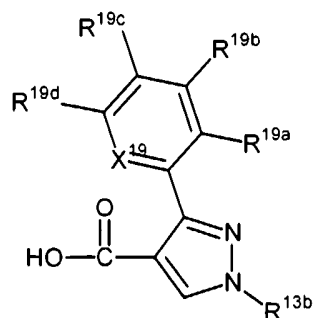


No Esquema (14), R^{13b} , R^{14b} , R^{17} , X^b , Y^b , Z^b , L^5 e q são como definidos acima.

Entre o composto (8), um composto representado pela fórmula (8-viii) e pela fórmula (8-ix):



(8-viii)



(8-ix)

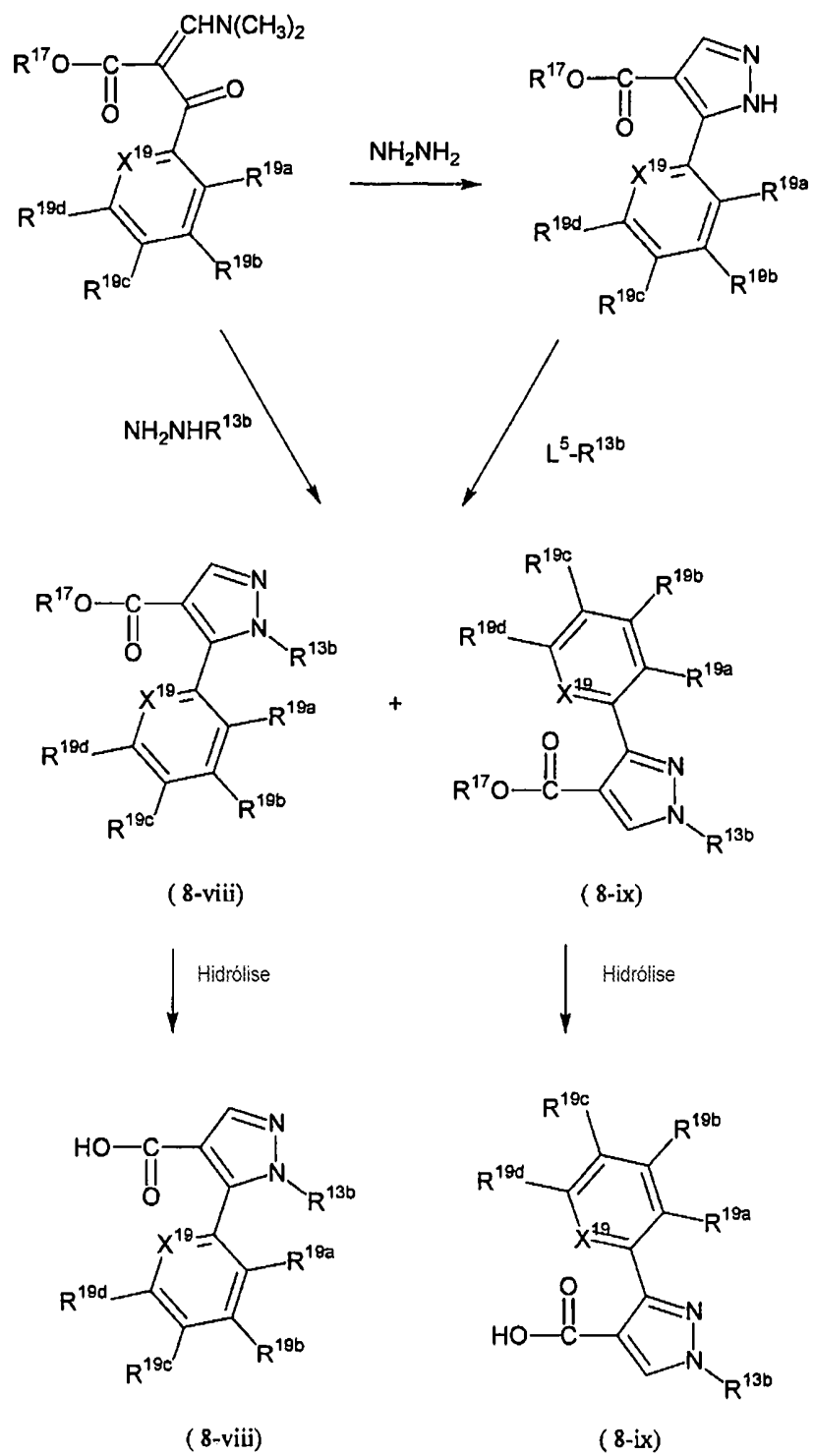
[em que R^{13b} é como definido acima,

X^{19} representa $-N-$, ou $-CR^{19e}-$,

R^{19a} , R^{19b} , R^{19c} , R^{19d} e R^{19e} representam, cada, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo nitro, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo]

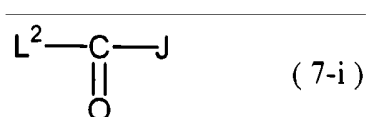
pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (15) seguinte.

Esquema (15)



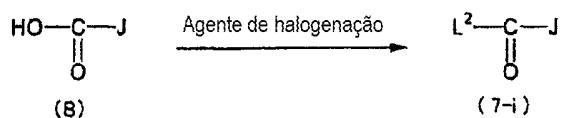
No Esquema (15), R^{13b} , R^{17} , R^{19a} , R^{19b} , R^{19c} , R^{19d} , L^5 e X^{19} são como definidos acima.

Entre o composto (7), um composto representado pela fórmula (7-i):



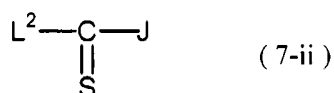
em que L^2 e J são como definidos acima, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (16) seguinte.

Esquema (16)



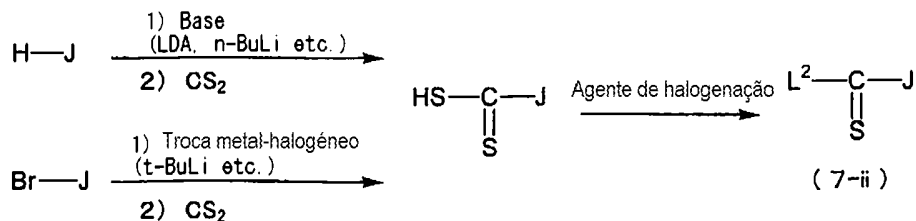
No Esquema (16), L^2 e J são como definidos acima.

Entre o composto (7), um composto representado pela fórmula (7-ii):



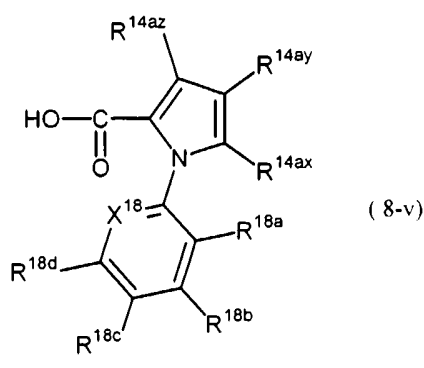
em que L^2 e J são como definidos acima, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (17) seguinte.

Esquema (17)



No Esquema (17), L^2 e J são como definidos acima, LDA representa diisopropilamida de lítio, n-BuLi representa butil normal-lítio e t-BuLi representa butil terciário-lítio.

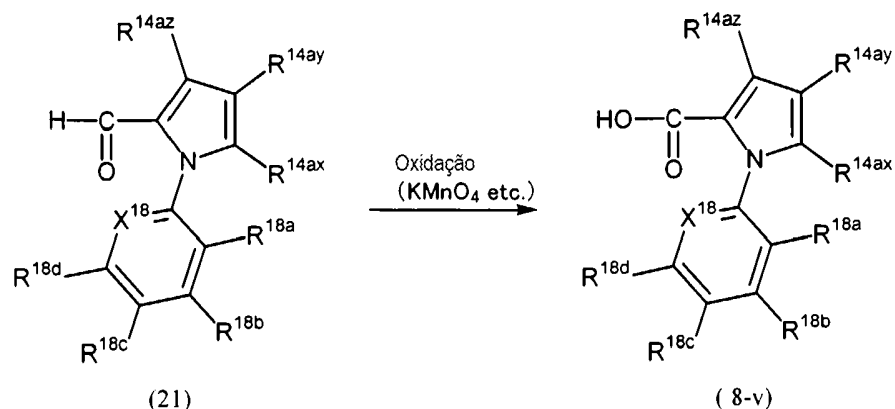
Entre o composto (8), um composto representado pela fórmula (8-v):



em que R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} e X^{18} são como definidos acima, e R^{14ax} , R^{14ay} e X^{14az} representam, independentemente, um átomo de hidrogénio, um átomo de halogéneo, um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo

alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (18) seguinte.

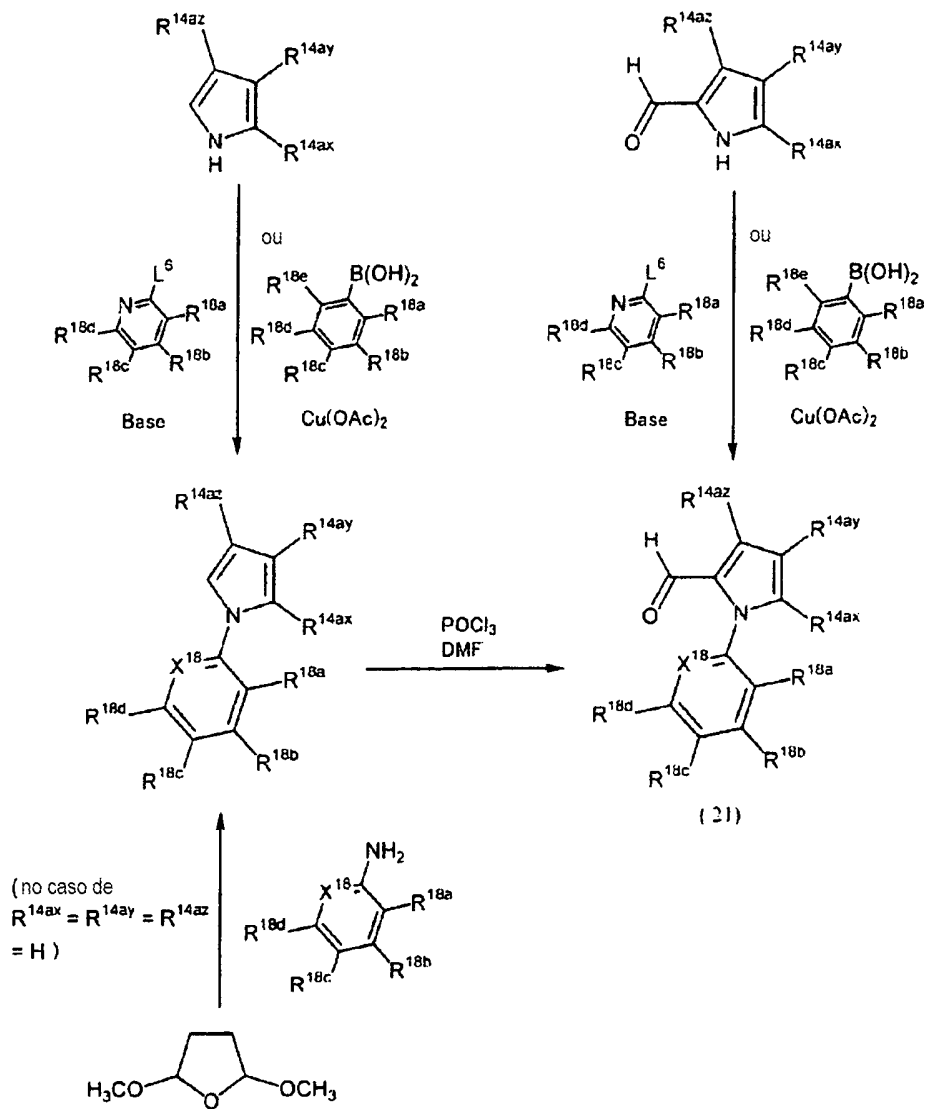
Esquema (18)



No Esquema (18), R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} , X^{18} , R^{14ax} , R^{14ay} e X^{14az} são como definidos acima.

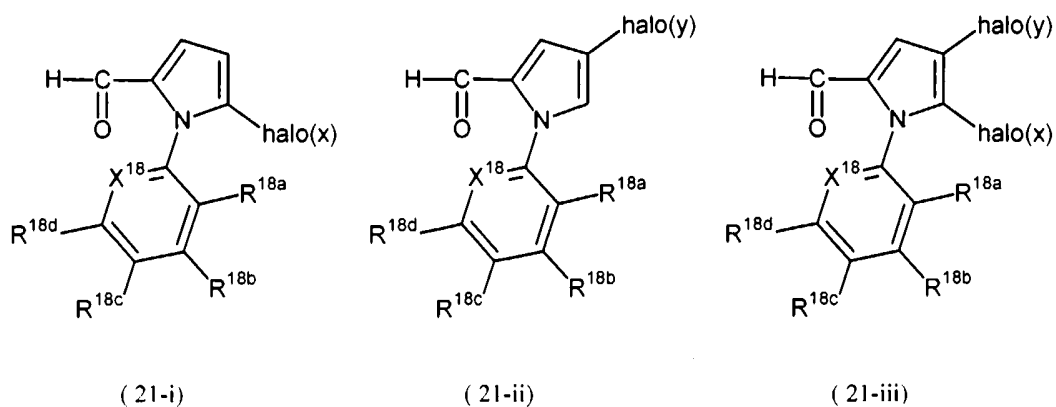
Os compostos (21) no esquema (18) podem ser produzidos, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (19) seguinte.

Esquema (19)



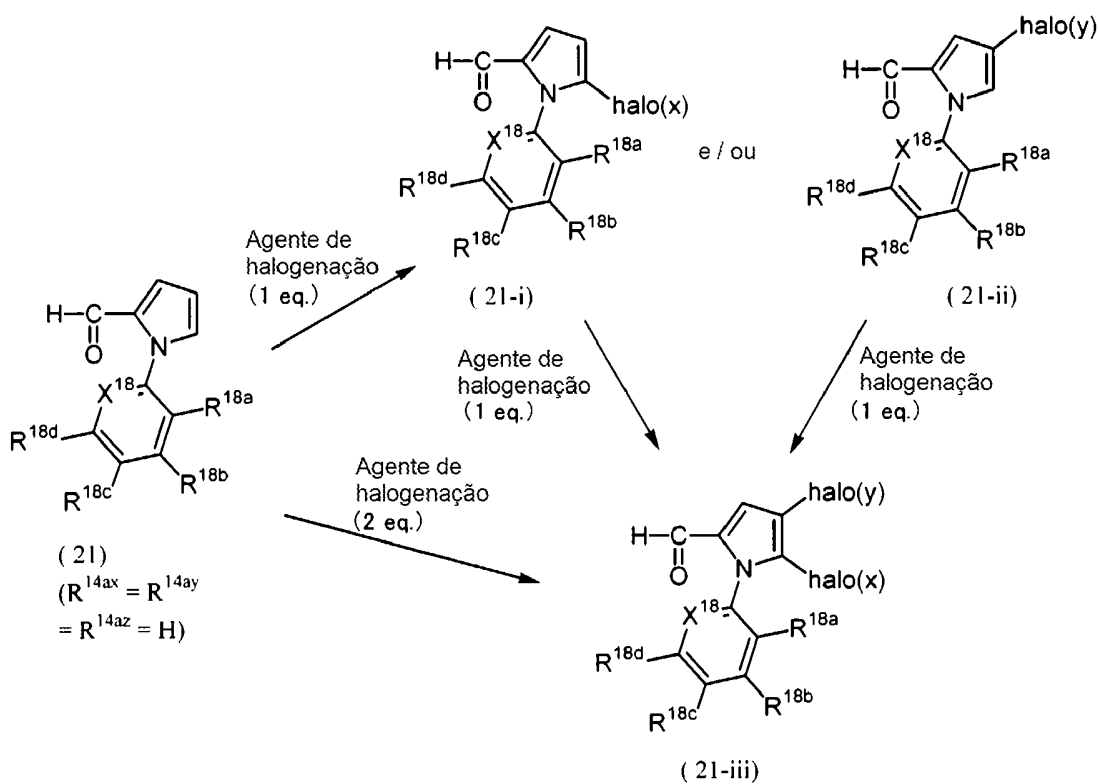
No Esquema (19), R^{18a}, R^{18b}, R^{18c}, R^{18d}, R^{18e}, X¹⁸, R^{14ax}, R^{14ay}, X^{14az} e L⁶ são como definidos acima.

Entre os compostos (21) no esquema (18), um composto representado pela fórmula (21-i), pela fórmula (21-ii) e pela fórmula (21-iii):



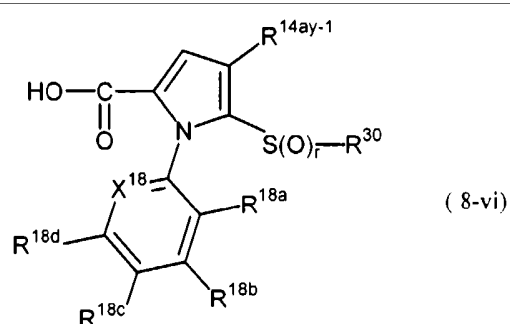
em que R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} e X^{18} são como definidos acima e halo (x) e halo (y) representam, independentemente, um átomo de halogéneo, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no seguinte Esquema (20).

Esquema (20)



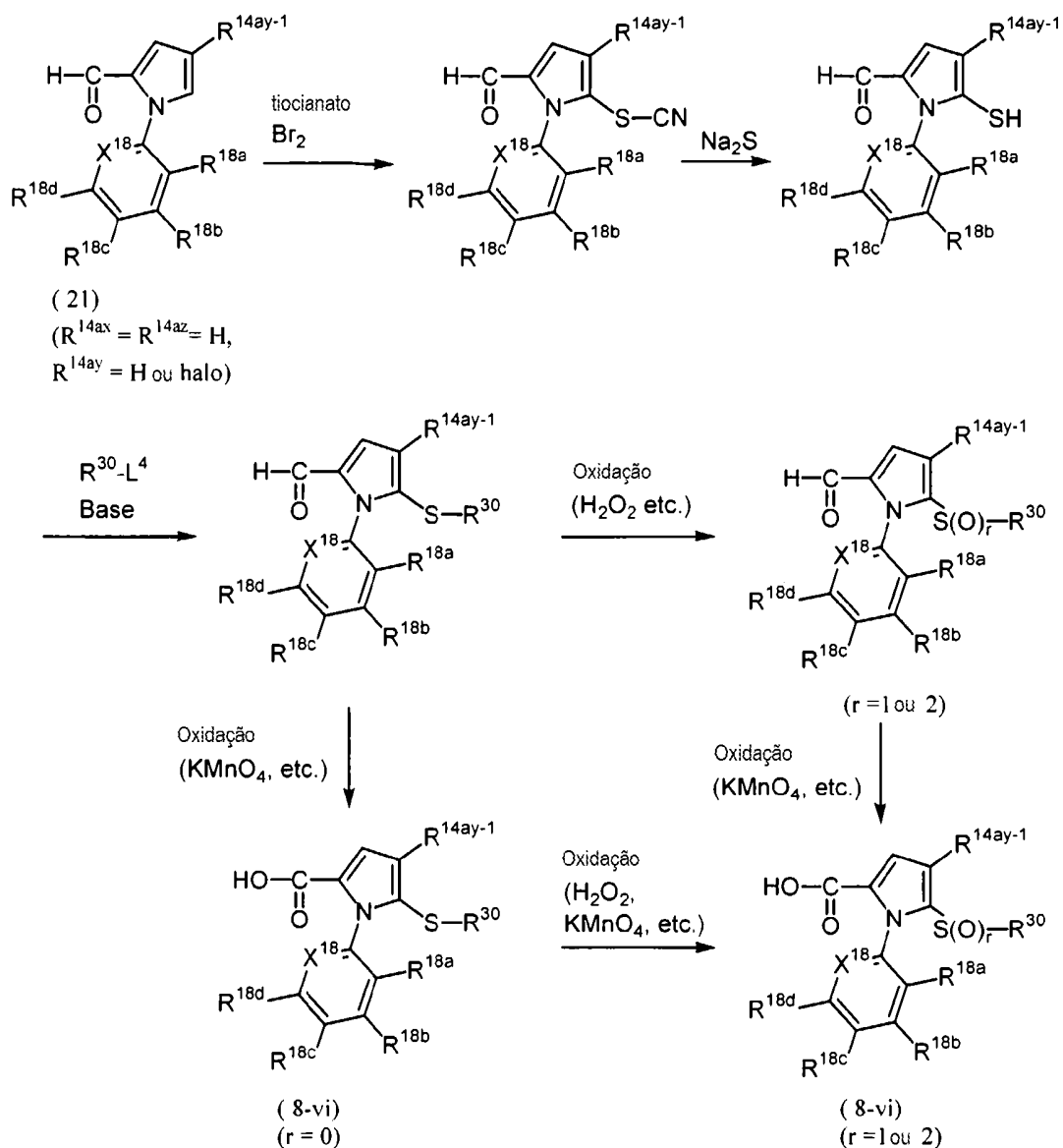
No Esquema (20), R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} , X^{18} , halo (x) e halo (y) são como definidos acima.

Entre o composto (8), um composto representado pela fórmula (8-vi):



em que R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} e X^{18} são como definidos acima, R^{14ay-1} representa um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo, R^{30} representa um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e r representa um número inteiro de 0 a 2, pode ser produzido, por exemplo, de acordo com o processo mostrado no Esquema (21) seguinte.

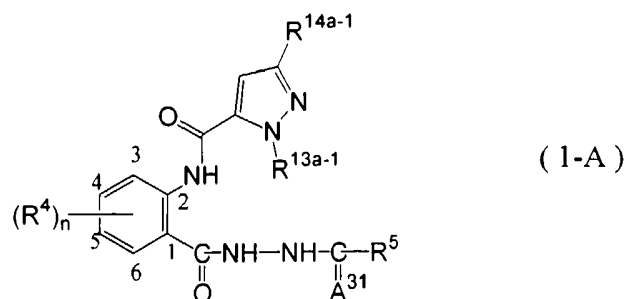
Esquema (21)



No Esquema (21), R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} , R^{18d} , X^{18} , R^{14ay-1} , R^{30} , r e L^4 são como definidos acima.

Os exemplos específicos do presente composto são resumidos nos quadros seguintes.

Um composto representado pela fórmula (1-A):



em que R^5 , A^{31} , $(R^4)_n$, R^{13a-1} e R^{14a-1} são combinações mostradas nos Quadro 1 a Quadro 7.

Quadro 1

R^5	A^{31}	$(R^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
H	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
H	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
H	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
H	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
H	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
H	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
H	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
H	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 2

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br

(continuação)

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 3

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
C(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
C(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H

(continuação)

R^5	A^{31}	$(R^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
$C(CH_3)_3$	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
$C(CH_3)_3$	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
$C(CH_3)_3$	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
$C(CH_3)_3$	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
$C(CH_3)_3$	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
$C(CH_3)_3$	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
$C(CH_3)_3$	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
$C(CH_3)_3$	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
$C(CH_3)_3$	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
$C(CH_3)_3$	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
$C(CH_3)_3$	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
$C(CH_3)_3$	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
$C(CH_3)_3$	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
$C(CH_3)_3$	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CF ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CF ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CF ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CF ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CF ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CF ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CF ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CF ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CF ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CF ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CF ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CF ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CF ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CF ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CF ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CF ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 4

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ OCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ OCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ OCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ OCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ OCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ OCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ OCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ OCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ OCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ OCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ OCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ OCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ OCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ OCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ OCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ OCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ SCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ SCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ SCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ SCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ SCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ SCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ SCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ SCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ SCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ SCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ SCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ SCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ SCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ SCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ SCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ SCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 5

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopropilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopropilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopropilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopropilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopropilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopropilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclopropilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopropilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopropilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopropilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopropilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopropilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopropilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopropilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopropilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopropilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 6

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclobutilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclobutilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclobutilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclobutilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclobutilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclobutilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclobutilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclobutilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopentilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopentilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopentilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopentilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopentilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopentilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopentilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopentilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

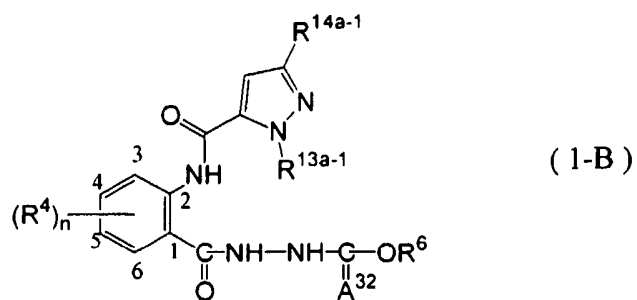
Quadro 7

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclo-hexilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclo-hexilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclo-hexilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclo-hexilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclo-hexilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclo-hexilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclo-hexilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclo-hexilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

R ⁵	A ³¹	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclo-hexilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclo-hexilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclo-hexilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclo-hexilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Um composto representado pela fórmula (1-B):



em que R^6 , A^{32} , $(R^4)_n$, R^{13a-1} e R^{14a-1} representam combinações mostradas nos Quadro 8 a Quadro 31.

Quadro 8

R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	H

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H

Quadro 9

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	F

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	F
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	F

Quadro 10

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl

Quadro 11

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₂ CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH(CH ₃) ₂	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-C(CH ₃) ₃	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CF ₃	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-OCH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-fenilo	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₂ CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH(CH ₃) ₂ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-C(CH ₃) ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CF ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-OCH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-fenilo, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 4-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl, 4-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 4-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl, 4-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-F	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-I, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Me, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Cl, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-I, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	Cl

Quadro 12

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Br

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br

Quadro 13

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₂ CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH(CH ₃) ₂	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-C(CH ₃) ₃	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CF ₃	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-OCH ₃	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-fenilo	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₂ CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH(CH ₃) ₂ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-C(CH ₃) ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CF ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-OCH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-fenilo, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 4-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl, 4-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 4-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl, 4-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-F	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-I, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Me, 4,5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Cl, 4,5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 4,5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-I, 4,5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	Br

Quadro 14

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	I

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	I
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	I

Quadro 15

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃

Quadro 16

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 17

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₂ CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH(CH ₃) ₂	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-C(CH ₃) ₃	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CF ₃	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-OCH ₃	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-fenilo	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₂ CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH(CH ₃) ₂ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-C(CH ₃) ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CF ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-OCH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-fenilo, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 4-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 4-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 4-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 4-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-F	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-I, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Me, 4,5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 4,5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 4,5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-I, 4,5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 18

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₃

Quadro 19

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	S(=O)CH ₃

Quadro 20

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	S(=O) ₂ CH ₃

Quadro 21

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	SCH ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	SCH(CH ₃) ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	SCH(CH ₃) ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	SCH(CH ₃) ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	SCH(CH ₃) ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	OCH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	OCH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	OCH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	OCH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	OCH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	OCH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	OCH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	OCH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CH ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CH(CH ₃) ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CH(CH ₃) ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CH(CH ₃) ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CH(CH ₃) ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CN
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CN
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CN
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CN

Quadro 22

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-fluoro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-fluoro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-fluoro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-fluoro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-fluoro-2-piridinilo	Br

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-fluoro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-fluoro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-fluoro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-bromo-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-bromo-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-bromo-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-bromo-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-bromo-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-bromo-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-bromo-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-bromo-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 23

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-metil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-metil-2-piridinilo	H

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-metil-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-metil-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-metil-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-metil-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-metil-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-metil-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-trifluorometil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-trifluorometil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-trifluorometil-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-trifluorometil-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-trifluorometil-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-trifluorometil-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-trifluorometil-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-trifluorometil-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 24

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-ciano-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-ciano-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-ciano-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-ciano-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-ciano-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-ciano-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-ciano-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-ciano-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-nitro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-nitro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-nitro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-nitro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-nitro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-nitro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-nitro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-nitro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 25

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-diclorofenilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2,6-diclorofenilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2,6-diclorofenilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-diclorofenilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-diclorofenilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2,6-diclorofenilo	Cl

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2,6-diclorofenilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-diclorofenilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-diclorofenilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2,6-diclorofenilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2,6-diclorofenilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-diclorofenilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-diclorofenilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2,6-diclorofenilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2,6-diclorofenilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-diclorofenilo	CF ₃

Quadro 26

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 27

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 28

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
C(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
C(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
C(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
C(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
C(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
C(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
C(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
C(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
C(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
C(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
C(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
C(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
C(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
C(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
C(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
C(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH=CH ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 29

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CCH	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CCH	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CCH	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CCH	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CCH	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CCH	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CCH	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CCH	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CCH	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CCH	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CCH	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CCH	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CCH	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CCH	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CCH	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CCH	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 30

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H

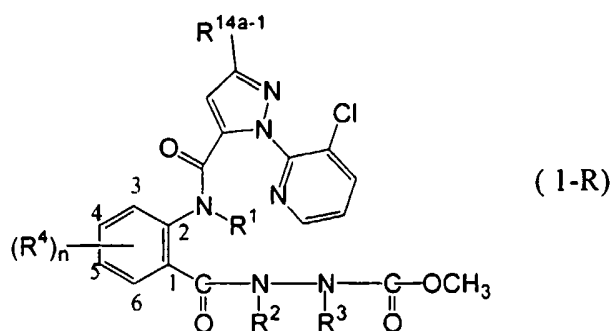
(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 31

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Um composto representado pela fórmula (1-R):



em que R¹, R², R³, (R⁴)_n e R^{14a-1} representam combinações mostradas nos Quadro 32 a Quadro 39.

Quadro 32

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

Quadro 33

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl

(continuação)

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	R^{14a-1}
H	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-CN	Cl
H	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	Br
H	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Br	Br
H	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-CN	Br
H	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-Cl	CF_3
H	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Cl	CF_3
H	H	CH_2CH_3	3-Br, 5-Br	CF_3
H	H	CH_2CH_3	3- CH_3 , 5-CN	CF_3

Quadro 34

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	R^{14a-1}
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	H
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	Cl
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-CN	Br
H	H	$CH(CH_3)_2$	3- CH_3 , 5-Cl	CF_3
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	CF_3
H	H	$CH(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	CF_3

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

Quadro 35

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

Quadro 36

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	H

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

Quadro 37

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl

(continuação)

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	R^{14a-1}
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

Quadro 38

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	R^{14a-1}
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

Quadro 39

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	Br

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

Quadro 39 continuação

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	Br

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃

Quadro 39 continuação

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	R^{14a-1}
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃

Quadro 39 continuação

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃

Quadro 39 continuação

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃

Quadro 39 continuação

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃

Quadro 39 continuação

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃

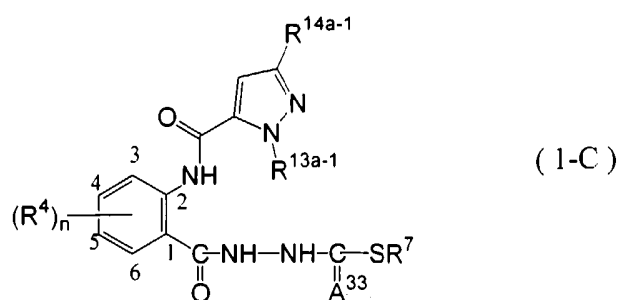
Quadro 39 continuação

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	Br
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	CF ₃

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	R ^{14a-1}
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	CF ₃
H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃

Um composto representado pela fórmula (1-C):



em que R⁷, A³³, (R⁴)_n, R^{13a-1} e R^{14a-1} representam combinações mostradas nos Quadro 40 a Quadro 41.

Quadro 40

R ⁷	A ³³	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

R ⁷	A ³³	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

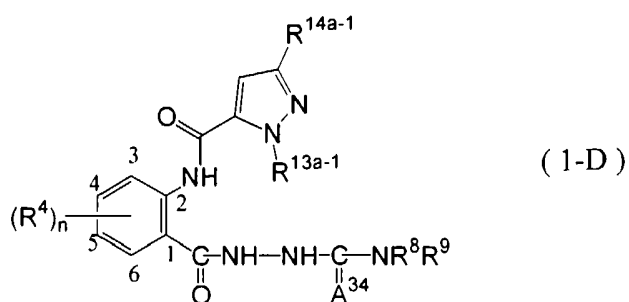
Quadro 41

R ⁷	A ³³	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br

(continuação)

R ⁷	A ³³	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Um composto representado pela fórmula (1-D):



em que NR⁸R⁹, A³⁴, (R⁴)_n, R^{13a-1} e R^{14a-1} representam combinações mostradas nos Quadro 42 a Quadro 57.

Quadro 42

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NH ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NH ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NH ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
NH ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
NH ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NH ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NH ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NH ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NH ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NH ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NH ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
NH ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
NH ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NH ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NH ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NH ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 43

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NHCH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NHCH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NHCH(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 44

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NHC(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHC(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHC(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
NHC(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
NHC(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHC(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHC(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHC(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHC(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHC(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHC(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHC(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHC(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHC(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHC(CH ₃) ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHC(CH ₃) ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 45

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₂ CH ₃) ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N{CH(CH ₃) ₂ } ₂	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 46

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclopropilamino	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopropilamino	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopropilamino	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopropilamino	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopropilamino	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopropilamino	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopropilamino	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopropilamino	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopropilamino	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopropilamino	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclopropilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopropilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopropilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopropilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopropilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopropilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclobutilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclobutilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclobutilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclobutilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclobutilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclobutilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclobutilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclobutilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 47

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclopentilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopentilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopentilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclopentilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopentilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopentilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopentilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopentilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclo-hexilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclo-hexilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclo-hexilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclo-hexilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclo-hexilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclo-hexilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclo-hexilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclo-hexilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclo-hexilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilamino	0	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclo-hexilamino	0	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclo-hexilamino	0	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclo-hexilamino	0	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 48

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
anilino	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
anilino	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
anilino	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
anilino	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
pirrolidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
pirrolidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
pirrolidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
pirrolidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
pirrolidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
pirrolidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
pirrolidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
pirrolidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
pirrolidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
pirrolidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
pirrolidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
pirrolidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
pirrolidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
pirrolidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
pirrolidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
pirrolidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 49

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
piperidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
piperidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
piperidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
piperidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
piperidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
piperidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
piperidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
piperidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
piperidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
piperidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
piperidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
piperidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
piperidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
piperidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
piperidin-1-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
piperidin-1-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
morfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
morfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
morfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
morfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
morfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
morfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
morfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
morfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
morfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
morfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
morfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
morfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
morfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
morfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
morfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
morfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 50

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
tiomorfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
tiomorfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
tiomorfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
tiomorfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
tiomorfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
tiomorfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
tiomorfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
tiomorfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
tiomorfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
tiomorfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
tiomorfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
tiomorfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
tiomorfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
tiomorfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
tiomorfolin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
tiomorfolin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
1-metilpiperazin-4-ilo	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 51

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NH ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NH ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NH ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
NH ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
NH ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NH ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NH ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NH ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NH ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NH ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NH ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
NH ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
NH ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NH ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NH ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NH ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 52

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NHCH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NHCH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₂ CH ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH ₂ CH ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NHCH(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 53

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
NHC(CH ₃) ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHC(CH ₃) ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
NHC(CH ₃) ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
NHC(CH ₃) ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
NHC(CH ₃) ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHC(CH ₃) ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHC(CH ₃) ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHC(CH ₃) ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
NHC(CH ₃) ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHC(CH ₃) ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHC(CH ₃) ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHC(CH ₃) ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
NHC(CH ₃) ₃	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHC(CH ₃) ₃	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHC(CH ₃) ₃	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
NHC(CH ₃) ₃	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
N(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 54

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₂ CH ₃) ₂	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopropilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclopropilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopropilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopropilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopropilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopropilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopropilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopropilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopropilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopropilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopropilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopropilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopropilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopropilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopropilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopropilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 55

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclobutilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclobutilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclobutilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclobutilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br

(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclobutilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclobutilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclobutilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclobutilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclobutilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclobutilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopentilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopentilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopentilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopentilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclopentilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclopentilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclopentilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopentilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopentilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclopentilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 56

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclo-hexilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclo-hexilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclo-hexilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H

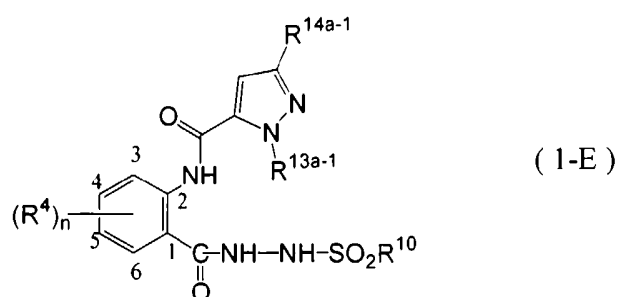
(continuação)

NR ⁸ R ⁹	A ³⁴	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
ciclo-hexilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
ciclo-hexilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclo-hexilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclo-hexilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclo-hexilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
ciclo-hexilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
ciclo-hexilamino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclo-hexilamino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclo-hexilamino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
ciclo-hexilamino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
anilino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	S	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
anilino	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
anilino	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
anilino	S	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 57

NR^8R^9	A^{34}	$(\text{R}^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
morfolin-4-ilo	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
morfolin-4-ilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
morfolin-4-ilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
morfolin-4-ilo	S	3- CH_3 , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
morfolin-4-ilo	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
morfolin-4-ilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
morfolin-4-ilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
morfolin-4-ilo	S	3- CH_3 , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
morfolin-4-ilo	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
morfolin-4-ilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
morfolin-4-ilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
morfolin-4-ilo	S	3- CH_3 , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
morfolin-4-ilo	S	3- CH_3 , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF_3
morfolin-4-ilo	S	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF_3
morfolin-4-ilo	S	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF_3
morfolin-4-ilo	S	3- CH_3 , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF_3

Um composto representado pela fórmula (1-E):



em que R^{10} , $(\text{R}^4)_n$, R^{13a-1} e R^{14a-1} representam combinações mostradas nos Quadro 58 a Quadro 60.

Quadro 58

R ¹⁰	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

R ¹⁰	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Quadro 59

R ¹⁰	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
CF ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CF ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CF ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CF ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CF ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CF ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CF ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CF ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CF ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CF ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CF ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CF ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CF ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CF ₃	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
fenilo	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl

(continuação)

R ¹⁰	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
fenilo	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
fenilo	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
fenilo	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
fenilo	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

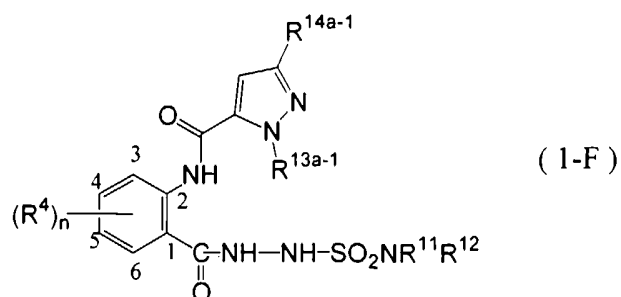
Quadro 60

R ¹⁰	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
4-metilfenilo	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
4-metilfenilo	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
4-metilfenilo	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
4-metilfenilo	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
4-metilfenilo	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
4-metilfenilo	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
4-metilfenilo	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
4-metilfenilo	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
4-metilfenilo	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
4-metilfenilo	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
4-metilfenilo	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
4-metilfenilo	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
4-metilfenilo	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
4-metilfenilo	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
4-metilfenilo	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

R^{10}	$(R^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
4-metilfenilo	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Um composto representado pela fórmula (1-F):



em que $NR^{11}R^{12}$, $(R^4)_n$, R^{13a-1} e R^{14a-1} representam combinações mostradas no Quadro 61.

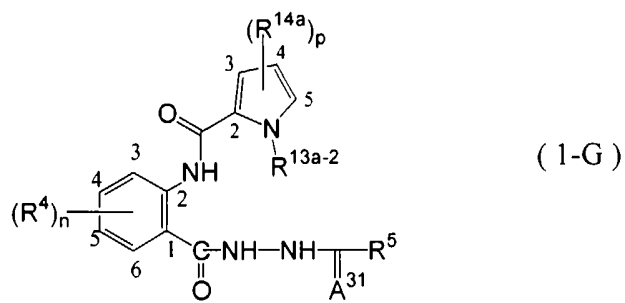
Quadro 61

$NR^{11}R^{12}$	$(R^4)_n$	R^{13a-1}	R^{14a-1}
$N(CH_3)_2$	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
$N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
$N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
$N(CH_3)_2$	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
$N(CH_3)_2$	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
$N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
$N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
$N(CH_3)_2$	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
$N(CH_3)_2$	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
$N(CH_3)_2$	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br

(continuação)

NR ¹¹ R ¹²	(R ⁴) _n	R ^{13a-1}	R ^{14a-1}
N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
anilino	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
anilino	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
anilino	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
anilino	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
anilino	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
anilino	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
anilino	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Um composto representado pela fórmula (1-G):



em que R^5 , A^{31} , $(R^4)_n$, R^{13a-2} e $(R^{14a})_p$ representam combinações no Quadro 62.

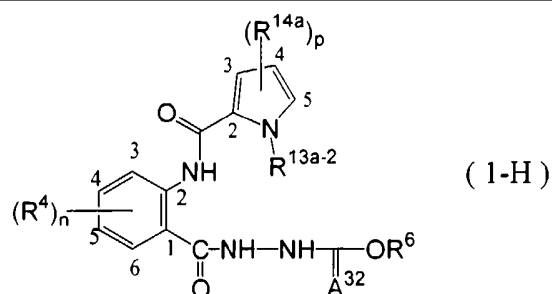
Quadro 62

R^5	A^{31}	$(R^4)_n$	R^{13a-2}	$(R^{14a})_p$
H	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
H	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
H	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
H	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
H	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
H	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
H	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
H	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
H	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
H	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
H	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
H	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
H	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
H	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
H	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃

(continuação)

R^5	A^{31}	$(R^4)_n$	R^{13a-2}	$(R^{14a})_p$
H	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃

Um composto representado pela fórmula (1-H):



em que R^6 , A^{32} , $(R^4)_n$, R^{13a-2} e $(R^{14a})_p$ representam combinações mostradas nos Quadro 63 a Quadro 74.

Quadro 63

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H

Quadro 64

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl

Quadro 65

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-CH ₂ CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH(CH ₃) ₂	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-C(CH ₃) ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CF ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-OCH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-fenilo	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₂ CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH(CH ₃) ₂ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-C(CH ₃) ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CF ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-OCH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-fenilo, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 4-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 4-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 4-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 4-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-F	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-I, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Me, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-I, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl

Quadro 66

R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{13a-2}	$(R^{14a})_p$
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Br

Quadro 67

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-CH ₂ CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH(CH ₃) ₂	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-C(CH ₃) ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CF ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-OCH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-fenilo	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₂ CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH(CH ₃) ₂ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-C(CH ₃) ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CF ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-OCH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-fenilo, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 4-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl, 4-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 4-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl, 4-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl, 6-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-F	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-I, 5-F	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Me, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Cl, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-I, 4, 5-CH=CH-CH=CH-	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₂ CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-Br

Quadro 68

R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{13a-2}	$(R^{14a})_p$
CH ₃	O	3-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-I	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-I, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-I, 5-I	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CH ₃	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-I, 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃

Quadro 69

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-F
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-F
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-F
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-F
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-I
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-I
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-I
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-I
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	5-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	5-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	5-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	5-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	5-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	5-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	5-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	5-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	5-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	5-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	5-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	5-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4,5-Cl ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4,5-Cl ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4,5-Cl ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4,5-Cl ₂

Quadro 70

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-fluoro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-fluoro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-fluoro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-fluoro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-fluoro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-fluoro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-fluoro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-fluoro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-fluoro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-bromo-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-bromo-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-bromo-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-bromo-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-bromo-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-bromo-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	4-CF ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-bromo-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-bromo-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-bromo-2-piridinilo	4-CF ₃

Quadro 71

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-metil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-metil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-metil-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-metil-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-metil-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-metil-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-metil-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-metil-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-metil-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-trifluorometil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-trifluorometil-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-Cl

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-trifluorometil-2-piridinilo	4-CF ₃

Quadro 72

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-ciano-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-ciano-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-ciano-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-ciano-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-ciano-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-ciano-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-ciano-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-ciano-2-piridinilo	4-CF ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-ciano-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-nitro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-nitro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-nitro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-nitro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-nitro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-nitro-2-piridinilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-nitro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-nitro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-nitro-2-piridinilo	4-CF ₃

Quadro 73

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	4-Cl

(continuação)

R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{13a-2}	$(R^{14a})_p$
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-diclorofenilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2,6-diclorofenilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2,6-diclorofenilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-diclorofenilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-diclorofenilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2,6-diclorofenilo	4-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2,6-diclorofenilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-diclorofenilo	4-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-diclorofenilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2,6-diclorofenilo	4-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2,6-diclorofenilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-diclorofenilo	4-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2,6-diclorofenilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2,6-diclorofenilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2,6-diclorofenilo	4-CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2,6-diclorofenilo	4-CF ₃

Quadro 74

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃

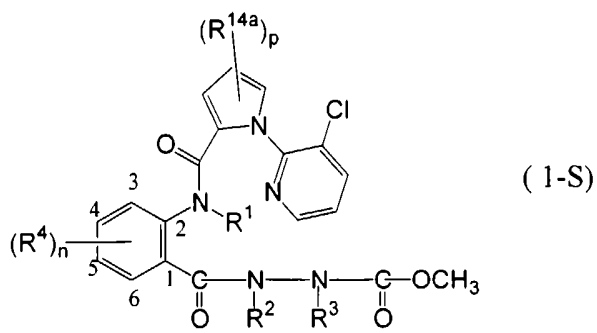
Quadro 74 continuação

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-F
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-I
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CH ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	5-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	5-Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	5-CF ₃
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4,5-Cl ₂
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4,5-Br ₂

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-2}	(R ^{14a}) _p
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl, 5-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl, 5-Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl, 5-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl, 5-Br
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl, 5-Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br, 5-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br, 5-Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Br, 5-Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Br, 5-Cl
CH ₃	O	3-Cl, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br, 5-Cl

Um composto representado pela fórmula (1-S):



em que R¹, R², R³, (R⁴)_n e (R^{14a})_p representam combinações mostradas nos Quadro 75 a Quadro 82.

Quadro 75

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	H

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃

Quadro 76

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl

(continuação)

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
H	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃

Quadro 77

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
H	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃

Quadro 78

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
H	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃

Quadro 79

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	H

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-Br
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃

Quadro 80

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃

(continuação)

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃

Quadro 81

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃

Quadro 82

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Br	4-CF ₃

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Br, 5-Br	4-CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-CH ₃ , 5-CN	4-CF ₃

Quadro 82 continuação

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	H
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4,5-Cl ₂
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4,5-Br ₂
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-Cl, 5-Br

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	H	3-Br, 5-Br	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	H	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4,5-Cl ₂
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4,5-Br ₂
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl, 5-Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl, 5-Br
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	H	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br, 5-Cl
H	H	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br, 5-Cl
H	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br, 5-Cl

Quadro 82 continuação

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H

(continuação)

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4,5-Cl ₂
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4,5-Br ₂
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl, 5-Br
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Br, 5-Br	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-CH ₃ , 5-CN	4-Br, 5-Cl
H	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br, 5-Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃

Quadro 82 continuação

R ¹	R ²	R ³	(R ⁴) _n	(R ^{14a}) _p
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl

(continuação)

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	$C(CH_3)_3$	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	$C(=O)OCH_3$	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4-Br
H	H	$C(=O)N(CH_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	CH ₃	H	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃

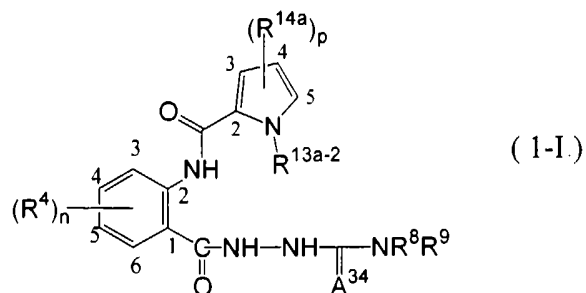
(continuação)

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃

Quadro 82 continuação

R^1	R^2	R^3	$(R^4)_n$	$(R^{14a})_p$
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-Cl
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-Br
CH ₃	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	4-CF ₃
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-CH ₃ , 5-Cl	H
CH ₃	H	C(=O)OCH ₃	3-Br, 5-Cl	H

Um composto representado pela fórmula (1-I):

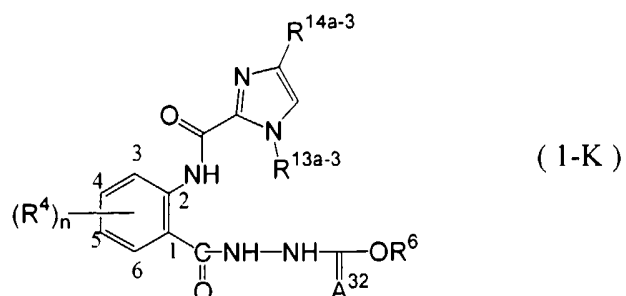


em que NR^8R^9 , A^{34} , $(R^4)_n$, R^{13-2} e $(R^{14a})_p$ representam combinações mostradas no Quadro 83.

Quadro 83

NR^8R^9	A^{34}	$(R^4)_n$	R^{13a-2}	$(R^{14a})_p$
$N(CH_3)_2$	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
$N(CH_3)_2$	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
$N(CH_3)_2$	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
$N(CH_3)_2$	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
$N(CH_3)_2$	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
$N(CH_3)_2$	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
$N(CH_3)_2$	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
$N(CH_3)_2$	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Cl
$N(CH_3)_2$	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
$N(CH_3)_2$	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
$N(CH_3)_2$	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
$N(CH_3)_2$	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-Br
$N(CH_3)_2$	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
$N(CH_3)_2$	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
$N(CH_3)_2$	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃
$N(CH_3)_2$	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	4-CF ₃

Um composto representado pela fórmula (1-K):



em que R^6 , A^{32} , $(R^4)_n$, R^{13a-3} e R^{14a-3} representam combinações mostradas no Quadro 84.

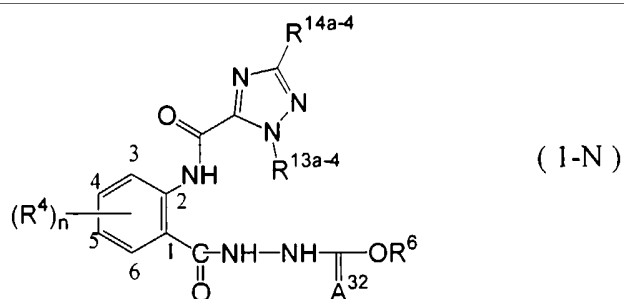
Quadro 84

R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{13a-3}	R^{14a-3}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-3}	R ^{14a-3}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

Um composto representado pela fórmula (1-N):



em que R^6 , A^{32} , $(R^4)_n$, R^{13a-4} e R^{14a-4} representam combinações mostradas no Quadro 85.

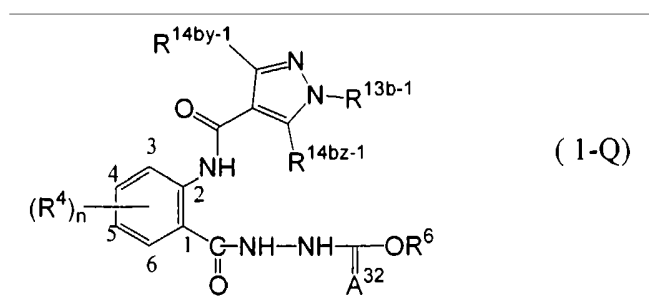
Quadro 85

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{13a-4}	R ^{14a-4}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Cl
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	Br
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF ₃

(continuação)

R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{13a-4}	R^{14a-4}
CH_2CH_3	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	CF_3
CH_2CH_3	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	CF_3
CH_2CH_3	O	3- CH_3 , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	CF_3

Um composto representado pela fórmula (1-Q):



em que R^6 , A^{32} , $(R^4)_n$, R^{13b-1} , R^{14bz-1} e R^{14by-1} representam combinações mostradas nos Quadro 86 a Quadro 89.

Quadro 86

R^6	A^{32}	$(R^4)_n$	R^{14bz-1}	R^{14by-1}	R^{13b-1}
CH_3	O	3- CH_3 , 5-Cl	2-clorofenilo	H	CH_3
CH_3	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	H	CH_3
CH_3	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	H	CH_3
CH_3	O	3- CH_3 , 5-CN	2-clorofenilo	H	CH_3
CH_3	O	3- CH_3 , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CH_3
CH_3	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CH_3
CH_3	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H	CH_3

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bz-1}	R ^{14by-1}	R ^{13b-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-clorofenilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	2-clorofenilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	2-clorofenilo	CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-clorofenilo	CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-clorofenilo	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	2-clorofenilo	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	2-clorofenilo	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-clorofenilo	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃

Quadro 87

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bz-1}	R ^{14by-1}	R ^{13b-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-clorofenilo	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	2-clorofenilo	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	2-clorofenilo	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-clorofenilo	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CF ₃
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bz-1}	R ^{14by-1}	R ^{13b-1}
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-clorofenilo	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	2-clorofenilo	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	2-clorofenilo	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-clorofenilo	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₃

Quadro 88

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bz-1}	R ^{14by-1}	R ^{13b-1}
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H	C(CH ₃) ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bz-1}	R ^{14by-1}	R ^{13b-1}
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-clorofenilo	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	2-clorofenilo	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	2-clorofenilo	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-clorofenilo	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-cloro-2-piridinilo	C(CH ₃) ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-clorofenilo	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	2-clorofenilo	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	2-clorofenilo	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-clorofenilo	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CF ₃

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bz-1}	R ^{14by-1}	R ^{13b-1}
CH ₂ CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CF ₃
CH ₂ CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-cloro-2-piridinilo	CH ₂ CF ₃

Quadro 89

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bz-1}	R ^{14by-1}	R ^{13b-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	H	CHF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	H	CHF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	H	CHF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	H	CHF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CHF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CHF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H	CHF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H	CHF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-clorofenilo	CHF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	2-clorofenilo	CHF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	2-clorofenilo	CHF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-clorofenilo	CHF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CHF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CHF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	3-cloro-2-piridinilo	CHF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-cloro-2-piridinilo	CHF ₂

(continuação)

R ⁶	A ³²	(R ⁴) _n	R ^{14bz-1}	R ^{14by-1}	R ^{13b-1}
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	2-clorofenilo	H	CBrF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	2-clorofenilo	H	CBrF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	2-clorofenilo	H	CBrF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	2-clorofenilo	H	CBrF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CBrF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	3-cloro-2-piridinilo	H	CBrF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	3-cloro-2-piridinilo	H	CBrF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	3-cloro-2-piridinilo	H	CBrF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	2-clorofenilo	CBrF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	2-clorofenilo	CBrF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	2-clorofenilo	CBrF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	2-clorofenilo	CBrF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CBrF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Cl	H	3-cloro-2-piridinilo	CBrF ₂
CH ₃	O	3-Br, 5-Br	H	3-cloro-2-piridinilo	CBrF ₂
CH ₃	O	3-CH ₃ , 5-CN	H	3-cloro-2-piridinilo	CBrF ₂

Exemplos de pragas contra as quais o presente composto tem eficácia de controlo incluem artrópodes nocivos tais como insectos nocivos e ácaros nocivos, e nematelmintos, tal como nemátodos, e os exemplos específicos são como mostrados a seguir.

Hemípteros:-

Cicadelas (Delphacidae) tais como cicadela castanha pequena (*Laodelphax striatellus*), cicadela castanha do arroz (*Nilaparvata lugens*) e cicadela de dorso branco do arroz (*Sogatella furcifera*); cigarrinhas (Deltocephalidae) tais como cigarrinha verde do arroz (*Nephotettix cincticeps*), cigarrinha verde do arroz (*Nephotettix virescens*) e cigarrinha verde do chá (*Empoasca onukii*); afídeos (Aphididae) tais como pulgão do algodoeiro (*Aphis gossypii*), pulgão verde do pessegueiro (*Myzus persicae*), pulgão da couve (*Brevicoryne brassicae*), pulgão da espireia (*Aphis spiraecola*), pulgão da batata (*Macrosiphum euphorbiae*), pulgão da dedaleira (*Aulacorthum solani*), pulgão verde-escuro da aveia (*Rhopalosiphum padi*), pulgão preto da laranjeira (*Toxoptera citricidus*) e pulgão farináceo da ameixeira (*Hyalopterus pruni*); percevejos (Pentatomidae) tais como percevejo verde (*Nezara antennata*), percevejo do feijão (*Riptortus clavatus*), percevejo do arroz (*Leptocorisa chinensis*), percevejo com espinho de manchas brancas (*Eysarcoris parvus*) e percevejo (*Halyomorpha mista*); moscas brancas (Aleyrodidae) tais como mosca branca das estufas (*Trialeurodes vaporariorum*), mosca branca da batata-doce (*Bemisia tabaci*), mosca branca da folha de prata (*Bemisia argentifolii*), mosca branca dos citrinos (*Dialeurodes citri*) e mosca branca espinhosa dos citrinos (*Aleurocanthus spiniferus*); cochonilhas (Coccidae) tais como cochonilha vermelha da Califórnia (*Aonidiella aurantii*), cochonilha de São José (*Comstockaspis perniciosa*), cochonilha dos citrinos (*Unaspis citri*), cochonilha de cera vermelha (*Ceroplastes rubens*), cochonilha Australiana (*Icerya purchasi*), cochonilha pulverulenta Japonesa (*Planococcus kraunhiae*), cochonilha pulverulenta Cosmstock (*Pseudococcus longispinis*), e cochonilha branca do pessegueiro

(*Pseudaulacaspis pentagona*); pulgões de ácer (Tingidae); psilídeos (Psyllidae); etc.

Lepidópteros:-

Traças piralídeas (Pyralidae) tais como broca do caule do arroz (*Chilo suppressalis*), broca amarela do arroz (*Tryporyza incertulas*), pírale do arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), pírale do algodoeiro (*Notarcha derogata*), pírale Indiano da farinha (*Plodia interpunctella*), broca oriental do milho (*Ostrinia furnacalis*), lagarta da couve (*Hellula undalis*) e lagarta da poa-comum (*Pediasia teterrellus*); borboletas nocturnas (Noctuidae) tais como rosca comum (*Spodoptera litura*), lagarta da beterraba (*Spodoptera exigua*), lagarta-do-cartucho (*Pseudaletia separata*), lagarta verde da couve (*Mamestra brassicae*), rosca preta (*Agrotis ipsilon*), larvas mineiras da beterraba (*Plusia nigrisigna*), *Thoricoplusia* spp., *Heliothis* spp. e *Helicoverpa* spp.; borboletas brancas e de enxofre (Pieridae) tal como borboleta branca comum (*Pieris rapae*); traças tortricídeas (Tortricidae) tais como *Adoxophyes* spp., traça oriental do pessegueiro (*Grapholita molesta*), broca da vagem da soja (*Leguminivora glycinivorella*), lagarta da vagem do feijão azuki (*Matsumuraeses azukivora*), tortricídio dos frutos de verão (*Adoxophyes orana fasciata*), *Adoxophyes* sp., tortricídio oriental do chá (*Homona magnanima*), tortricídio da maçã (*Archips fuscocupreanus*) e carpocapsa; lagartas mineiras das folhas (Gracillariidae) tais como mineiras da folha do chá (*Caloptilia theivora*) e mineiras das folhas das macieiras (*Phyllonorycter ringoneella*); Carposinidae tal como a larva da carpocapsa do pêssgo (*Carposina niponensis*); lionetídeos (Lyonetiidae) tal como *Lyonetia* spp.; limantrídeos

(Lymantriidae) tais como *Lyymantria* spp. e *Euproctis* spp.; traças de iponomeutídeos (Yponomeutidae) tal como traça de dorso de diamante (*Plutella xylostella*); traças de gelechiidae (Gelechiidae) tais como lagarta rosada do algodoeiro (*Pectinophora gossypiella*) e lagarta do tubérculo da batata (*Phthorimaea operculella*); traças-tigres e semelhantes (Arctiidae) tais como lagarta do outono (*Hyphantria cunea*); tineídeos (Tineidae) tais como traça tecedeira da roupa (*Tinea translucens*) e traça comum da roupa (*Tineola bisselliella*); etc.

Tisanópteros:-

Tripídeos (Thripidae) tais como tripídeo amarelo dos citrinos (*Frankliniella occidentalis*), Tripídeos parisi, tripídeo amarelo do chá (*Scirtothrips dorsalis*), tripídeo da cebola (*Thrips tabaci*), tripídeo das flores (*Frankliniella intonsa*), etc.

Dípteros:-

Mosca doméstica (*Musca domestica*), mosquito comum (*Culex popiens pallens*), moscardo (*Tabanus trigonus*), larva da mosca da cebola (*Hylemya antiqua*), larva da mosca da semente do milho (*Hylemya platura*), *Anopheles sinensis*, mineira da folha do arroz (*Agromyza oryzae*), mineira da folha do arroz (*Hydrellia griseola*), larva da mosca do caule do arroz (*Chlorops oryzae*), mosca do melão (*Dacus cucurbitae*), *Ceratitis capitata*, mineira da folha de leguminosas (*Liriomyza trifolii*), mineira da folha do tomateiro (*Liriomyza sativae*), mineira dos crisântemos (*Chromatomyia horticola*), etc.

Coleópteros:-

Joaninha de vinte e oito pontos (*Epilachna vigintioctopunctata*), escaravelho da folha de cucurbitáceas (*Aulacophora femoralis*), striped flea beetle (*Phyllotreta striolata*), escaravelho da folha do arroz (*Oulema oryzae*), gorgulho do arroz (*Echinocnemus squameus*), gorgulho aquático do arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus*), *Anthonomus grandis*, gorgulho do feijão azuki (*Callosobruchus chinensis*), *Sphenophorus venatus*, escaravelho Japonês (*Popillia japonica*), besouro cuproso (*Anomala cuprea*), lagarta da raiz do milho (*Diabrotica* spp.), escaravelho do Colorado (*Leptinotarsa decemlineata*), lagarta mineira dos cereais (*Agriotes* spp.), escaravelho do tabaco (*Lasioderma serricorne*), escaravelho crítico variegado (*Anthrenus verbasci*), escaravelho vermelho da farinha (*Tribolium castaneum*), bóstrico (*Lyctus brunneus*), escaravelho longicórneo com manchas brancas (*Anoplophora malasiaca*), hilesino destruidor do pinheiro (*Tomicus piniperda*), etc.

Ortópteros:-

Gafanhoto asiático (*Locusta migratoria*), Grilo toupeira africano (*Gryllotalpa africana*), gafanhoto do arroz (*Oxya yezoensis*), gafanhoto do arroz (*Oxya japonica*), etc.

Himenópteros:-

Vespão da couve (*Athalia rosae*), *Acromyrmex* spp., formiga vermelha (*Solenopsis* spp.), etc.

Nemátodos:-

Nemátodo de ponta branca do arroz (*Aphelenchoides besseyi*), nemátodo do rebento de morangueiro (*Nothotylenchus acris*), nemátodo do nó da raiz do sul (*Meloidogyne incognita*), nemátodo do nó da raiz do norte (*Meloidogyne hapla*), nemátodo do nó da raiz Javanesa (*Meloidogyne javanica*), nemátodo do quisto da soja (*Heterodera glycines*), nemátodo do quisto da batata (*Globodera rostochiensis*), nemátodo de lesão da raiz do café (*Pratylenchus coffeae*), nemátodo de lesão da raiz da Califórnia (*Pratylenchus neglectus*), etc.

Dictiópteros:-

Barata Alemã (*Blattella germanica*), barata castanha da fuligem (*Periplaneta fuliginosa*), barata Americana (*Periplaneta americana*), *Periplaneta brunnea*, barata oriental (*Blatta orientalis*), etc.

Acarídeos:-

Ácaros (Tetranychidae) tais como ácaro comum (*Tetranychus urticae*), ácaro Kanzawa (*Tetranychus kanzawai*), ácaro-purpúreo (*Panonychus citri*), ácaro vermelho Europeu (*Panonychus ulmi*) and *Oligonychus* spp.; ácaros eriofídeos (Eriophyidae) tais como ácaro rosado da ferrugem dos citrinos (*Aculops pelekassi*), ácaro rosado da ferrugem dos citrinos (*Phyllocoptruta citri*), ácaro da ferrugem do tomate (*Aculops lycopersici*), ácaro púrpura do chá (*Calacarus carinatus*), ácaro rosado da ferrugem do chá (*Acaphylla theavagran*) and *Eriophyes chibaensis*; ácaros

tarsonemídeos (Tarsonemidae) tais como ácaro-branco (*Polyphagotarsonemus latus*); falsos ácaros (*Tenuipalpidae*) tal como *Brevipalpus phoenicis*; Tuckerellidae; carraças (*Ixodidae*) tais como *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Dermacentor taiwanicus*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Boophilus microplus* e *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros acarídeos (*Acaridae*) tais como ácaro do bolor (*Tyrophagus putrescentiae*) e *Tyrophagus similis*; ácaros do pó doméstico (*Pyroglyphidae*) tais como *Dermatophagoides farinae* e *Dermatophagoides ptrenyssnus*; ácaros queiletídeos (*Cheyletidae*) tais como *Cheyletus eruditus*, *Cheyletus malaccensis* e *Cheyletus moorei*; ácaros parasitários (*Dermanyssidae*); etc.

O pesticida da presente invenção pode ser o presente composto mas, habitualmente, o presente composto é misturado com um veículo inerte, tais como um veículo sólido, um veículo líquido, um veículo gasoso e semelhantes e, se necessário, são adicionados um tensioactivo e outros aditivos de preparação para formular numa composição ou preparação tal como uma emulsão, óleo, pó, granulados, uma preparação molhável, uma preparação fluida, microcápsulas, um aerossol, um fumigante, isco envenenado, uma preparação de resina ou semelhantes. Estas composições ou preparações contêm habitualmente 0,01 a 95% em peso do presente composto.

Exemplos do veículo sólido a ser utilizado incluem pós finos e granulados tais como argilas (argila de caulino, terra de diatomáceas, bentonite, argila fubasami, argila ácida, etc.), óxido de silício hidratado sintético, talco, cerâmicos, outros minerais inorgânicos (sericite, quartzo, enxofre, carvão activo, carbonato de cálcio, sílica hidratada, etc.), fertilizantes

químicos (sulfato de amónio, fosfato de amónio, nitrato de amónio, ureia, cloreto de amónio, etc.) e semelhantes.

Exemplos do veículo líquido incluem água, álcoois (metanol, etanol, álcool isopropílico, butanol, hexanol, álcool benzílico, etilenoglicol, propilenoglicol, fenoxietanol, etc.), cetonas (acetona, metiletilcetona, ciclo-hexanona, etc.), hidrocarbonetos aromáticos (tolueno, xileno, etilbenzeno, dodecilbenzeno, fenilxililetano, metilnaftaleno, etc.), hidrocarbonetos alifáticos (hexano, ciclo-hexano, queroseno, óleo gasoso, etc.), ésteres (acetato de etilo, acetato de butilo, miristato de isopropilo, oleato de etilo, adipato de diisopropilo, adipato de diisobutilo, acetato do éter monometílico de propilenoglicol, etc.), nitrilos (acetonitrilo, isobutironitrilo, etc.), éteres (éter diisopropílico, 1,4-dioxano, éter dimetílico de etilenoglicol, éter dimetílico de dietilenoglicol, éter monometílico de dietilenoglicol, éter monometílico de propilenoglicol, éter monometílico de dipropilenoglicol, 3-metoxil-3-metil-1-butanol, etc.), amidas de ácido (N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, etc.), hidrocarbonetos halogenados (diclorometano, tricloroetano, tetracloroeto de carbono, etc.), sulfóxidos (dimetilsulfóxido, etc.), propileno carbónico e óleos vegetais (óleo de soja, óleo de semente de algodão, etc.).

Exemplos do veículo gasoso incluem fluorocarboneto, butano gasoso, LPG (gás de petróleo liquefeito), éter dimetílico e ácido carbónico gasoso.

Exemplos do tensioactivo incluem tensioactivos não iónicos tais como éter de alquilo e polioxietileno, éter de arilo alquilo e polioxietileno, éster de ácido gordo de

polietilenoglicol e semelhantes, e tensioactivos aniónicos tais como sais de sulfonato de alquilo, sais de sulfonato de alquilbenzeno e sais de sulfato de alquilo.

Exemplos de outros aditivos de preparação incluem aglutinantes, dispersantes, corantes e estabilizantes, especificamente, caseína, gelatina, açúcares (amido, goma-arábica, derivados de celulose, ácido algínico, etc.), derivados de lenhina, bentonite, polímeros sintéticos solúveis em água (poli(álcool vinílico), polivinilpirrolidona, poli(ácidos acrílicos), etc.), PAP (fosfato de isopropilo ácido), BHT (2,6-di-terc-butil-4-metilfenol) e BHA (uma mistura de 2-terc-butil-4-metoxifenol e 3-terc-butil-4-metoxifenol).

O método de controlo de uma praga da presente invenção compreende a aplicação do pesticida da presente invenção a uma planta, solo ou em casa.

Quando o pesticida da presente invenção é utilizado para controlar uma praga no campo agrícola, uma quantidade a ser aplicada é habitualmente 1 a 10000 g por 10000 m² em termos de quantidade do presente composto. Quando o pesticida da presente invenção está formulado numa emulsão, preparação molhável, preparação fluida ou semelhantes, o agente é habitualmente aplicado diluindo com água para que a concentração de ingrediente activo se torne 0,01 a 10000 ppm, e os granulados, pós ou semelhantes são habitualmente aplicados tal e qual.

Estas preparações ou preparações diluídas com água podem ser aplicadas directamente a uma praga ou a uma planta tal como uma colheita a ser protegida contra uma praga, ou podem ser

aplicadas no solo de uma terra cultivada para controlar uma praga que habita no solo.

Alternativamente, o tratamento pode ser realizado, por exemplo, enrolando uma preparação de resina processada como uma folha ou cordão numa colheita, cercando uma colheita com uma preparação de resina ou aplicando a preparação de resina no solo em torno das raízes de uma colheita.

Quando o pesticida da presente invenção é utilizado para controlar uma praga que habita numa casa (e. g. mosca, mosquito, barata, etc.), a quantidade a ser aplicada é habitualmente 0,01 a 1000 mg por 1 m² de área de tratamento em termos de quantidade do presente composto no caso do tratamento de superfícies e é habitualmente 0,01 a 500 mg por 1 m³ de espaço de tratamento em termos de quantidade do presente composto no caso de tratamento espacial. Quando o pesticida da presente invenção é formulado numa emulsão, preparação molhável, preparação fluida ou semelhantes, o agente é habitualmente aplicado diluindo com água para que a concentração de ingrediente activo se torne 0,1 a 1000 ppm, e um óleo, um aerossol, um fumigante, isco envenenado ou semelhantes é aplicado tal e qual.

O pesticida da presente invenção pode conter outros agentes de controlo de artrópodes nocivos, acaricidas, nematicidas, fungicidas, herbicidas, reguladores do crescimento vegetal, agentes sinérgicos, fertilizantes, condicionadores de solo, alimentos compostos para animais e semelhantes.

Como os ingredientes activos dos agentes de controlo de artrópodes nocivos, acaricidas e/ou nematicidas

supramencionados, pode mencionar-se, por exemplo, os seguintes compostos.

(1) Compostos orgânicos de fósforo

Acefato, fosfeto de alumínio, butatiofos, cadusafos, cloretoxifos, clorfeninfos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cianofos: CYAP, diazinão, DCIP (éter diclorodiisopropílico), diclofentião: ECP, diclorvos: DDVP, dimetoato, dimetilvinfos, dissulfutão, EPN, etião, etoprofos, etrimfos, fentião: MPP, fenitrotião: MEP, fostiazato, formotião, fosfeto de hidrogénio, isofenfos, isoxatião, malatião, mesulfenfos, metidatião: DMTP, monocrotofos, nalede: BRP, oxidoprofos: ESP, paratião, fosadona, fosmete: PMP, pirimifos-metilo, piridafentião, quinalfos, fentoato: PAP, profenofos, propafos, protiofos, piraclorfos, salitião, sulprofos, tebupirimfos, temefos, tetraclorvinfos, terbufos, tiometão, triclorfão: DEP, vamidotião e semelhantes.

(2) Compostos de carbamato

Alanicarbe, bendiocarbe, benfuracarbe, BPMC, carbarilo, carbofurano, carbossulfano, cloetocarbe, etiofencarbe, fenobucarbe, fenotiocarbe, fenoxicarbe, furatiocarbe, isoprocarbe: MIPC, metolcarbe, metomilo, metiocarbe, NAC, oxamilo, pirimicarbe, propoxur: PHC, XMC, tiodicarbe, xililcarbe e semelhantes.

(3) Compostos piretróides sintéticos

Acrinatrina, aletrina, benflutrina, beta-ciflutrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cialotrina, cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenoprox, flumetrina, fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, permetrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigma-cipermetrina, (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanocarboxilato de silafluofeno, teflutrina, tralometrina, transflutrina, 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)benzilo, (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metilbenzilo, (1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)ciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)benzilo e semelhantes.

(4) Compostos de nereistoxina

Cartape, bensultape, tiociclam, monossultape, bissultape e semelhantes.

(5) Compostos neonicotinóides

Imidacloprida, nitenpiram, acetamiprida, tiametoxam, tiacloprida, dinotefurano, clotianidina e semelhantes.

(6) Compostos de benzoilureia

Clorfluazurão, bistrifluorão, diafentiurão, diflubenzurão, fluazurão, fluciclofurão, flufenoxurão, hexaflumurão, lufenurão, novalurão, noviflumurão, teflubenzurão, triflumurão e semelhantes.

(7) Compostos de fenilpirazole

Acetoprole, etiprole, fipronil, vaniliprole, piriprole, pirafluprole e semelhantes.

(8) Inseticidas de toxina Bt

Endósporo viável proveniente de *Bacillus thuringiensis* e toxinas cristalinas produzidas por este, bem como uma sua mistura.

(9) Compostos de hidrazina

Cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida e semelhantes.

(10) Compostos orgânicos clorados

Aldrina, dieldrina, dienocloro, endossulfano, metoxicloro e semelhantes.

(11) Insecticidas naturais

Óleo de máquina, sulfato de nicotina e semelhantes.

(12) Outros Insecticidas

Avermectina-B, bromopropilato, buprofezina, clorfenapir, ciromazina, 1,3-dicloropropeno, benzoato de emamectina, fenazaquina, flupirazofos, hidropreno, indoxacarbe, metoxadiazona, milbemicina-A, pimetrozina, piridalilo, piriproxifeno, espinosade, sulfluramida, tolfenpirade, triazamato, flubendiamida, SI-0009, ciflumetofena, ácido arsénico, benclotiaz, cianamida cálcica, polissulfureto de cálcio, clordano, DDT, DSP, flufenerim, flonicamida, flurimfeno, formetanato, metame de amónio, metame de sódio, brometo de metilo, nidinotefurano, oleato de potássio, protrifenbute, espiromesifena, enxofre, metaflumizona, espirotetramate e semelhantes.

Acaricidas

Acequinocilo, amitraz, benzoximato, bromopropilato, quinometionato, clorobenzilato, CPCBS (clorfensão), clofentezina, Kelthane (dicofol), etoxazole, óxido de fenbutatina, fenotiocarbe, fenpiroximato, fluacripirim, fluproxifeno, hexitiazoxe, propargite: BPPS, polinactinas, piridabeno, pirimidifeno, tebufenpirade, tetradifão, espiroclorfen, amidoflumete, bifenazato, ciflumetofeno e semelhantes.

Nematicidas (ingredientes activos nematicidas)

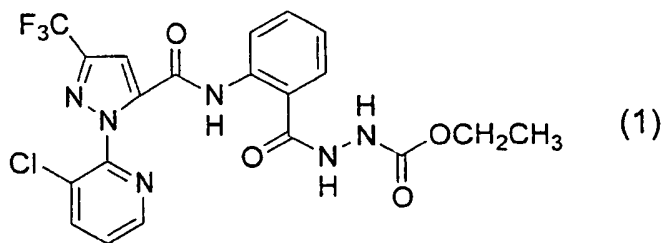
DCIP, fostiazato, levamisol, isotiocianato de metilo, tartarato de morantel e semelhantes.

A presente invenção será explicada em mais pormenor a seguir pode meio de Exemplos de Preparação, Exemplos de Formulação, Exemplos de Ensaio, mas a presente invenção não se limita a estes Exemplos.

Em primeiro lugar serão explicados os Exemplos de Preparação do presente composto.

Exemplo de Preparação 1

Uma mistura de 0,22 g de N-(2-aminobenzoil)-N'-etoxicarbonil-hidrazina, 0,31 g de cloreto de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,13 g do presente composto (1) da fórmula:

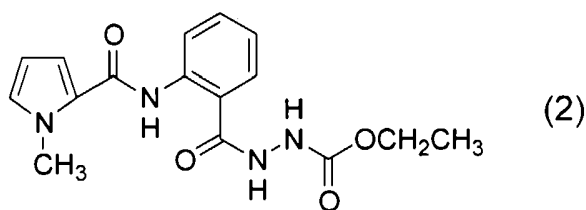


O presente composto (1)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,35 (3H, t, $J=8$ Hz), 4,29 (2H, q, $J=8$ Hz), 6,85 (1H, sl), 7,10 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,24 (1H, s), 7,44 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,62 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,93 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,42 (1H, sl), 8,46 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,52 (1H, d, $J=8$ Hz), 11,86 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 2

Uma mistura de 0,13 g de ácido 1-metil-1H-pirrole-2-carboxílico, 0,15 g de cloreto de tionilo e 5 mL de hexano foi aquecida sob refluxo durante 2 horas. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida para obter 0,14 g de cloreto de 1-metil-1H-pirrole-2-carbonilo. A uma mistura de 0,22 g de N-(2-aminobenzoil)-N'-etoxicarbonil-hidrazina e 10 mL de piridina foi adicionado 0,14 g do cloreto de 1-metil-1H-pirrole-2-carbonilo resultante e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,11 g do presente composto (2) da fórmula:

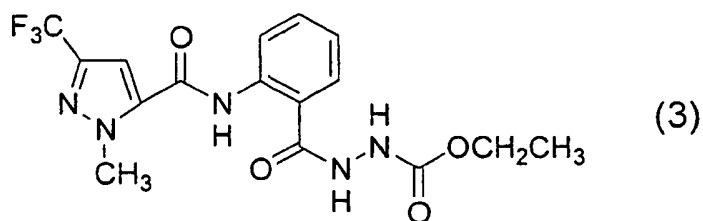


O presente composto (2)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,02-1,28 (3H, m), 3,91 (3H, s), 4,00-4,16 (2H, m), 6,13 (1H, d, $J=4$ Hz), 6,78 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,06 (1H, m), 7,15 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,56 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,79 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,57 (1H, d, $J=8$ Hz), 9,30 (1H, sl), 10,57 (1H, sl), 11,63 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 3

Uma mistura de 0,19 g de ácido 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico, 0,15 g de cloreto de tionilo e 5 mL de hexano foi aquecida sob refluxo durante 2 horas. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida para obter 0,14 g de cloreto de 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo. A uma mistura de 0,22 g de N-(2-aminobenzoil)-N'-etoxicarbonil-hidrazina e 10 mL de piridina foi adicionado 0,14 g do cloreto de 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo resultante e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e os precipitados depositados foram recolhidos por filtração para obter 0,23 g do presente composto (3) da fórmula:

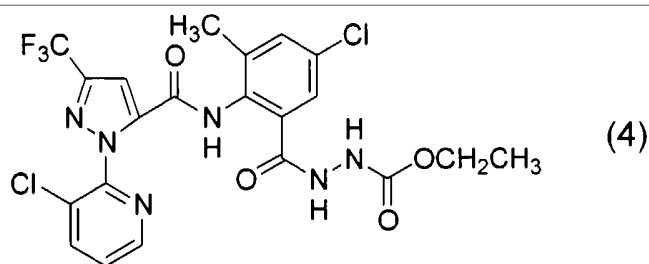


O presente composto (3)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,20 (3H, t, $J=8$ Hz), 4,10 (2H, q, $J=8$ Hz), 4,19 (3H, s), 7,17 (1H, s), 7,28 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,60 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,79 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,37 (1H, d, $J=8$ Hz), 9,02 (1H, sl), 10,41 (1H, sl), 11,50 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 4

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,06 g de cloroformato de etilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,08 g do presente composto (4) da fórmula:

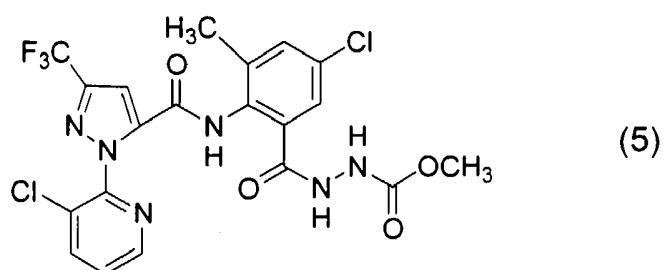


O presente composto (4)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 0,96-1,26 (3H, m), 2,16 (3H, s), 3,90-4,12 (2H, m), 7,38 (1H, s), 7,55 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,71 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,25 (1H, sl), 10,14 (1H, sl), 10,37 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 5

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de cloroformato de metilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,16 g do presente composto (5) da fórmula:



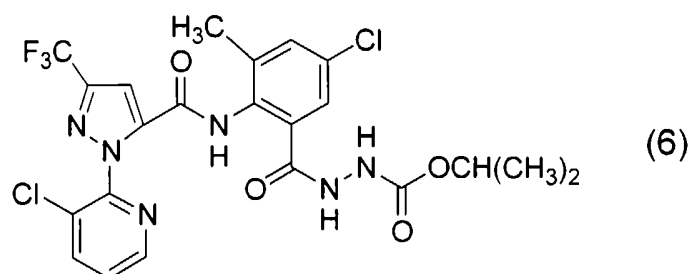
O presente composto (5)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 3,62 (3H, s), 7,39 (1H, s), 7,56 (1H, s), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,70 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,31 (1H, sl), 10,17 (1H, sl), 10,38 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 6

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de cloroformato de isopropilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um

precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,21 g do presente composto (6) da fórmula:

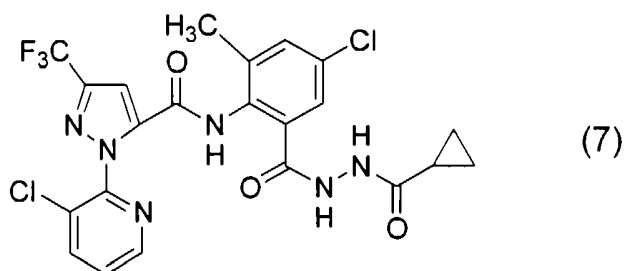


O presente composto (6)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 0,97-1,31 (6H, m), 2,16 (3H, s), 4,68-4,89 (1H, m), 7,38 (1H, s), 7,55 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,71 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,18 (1H, sl), 10,12 (1H, sl), 10,37 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 7

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de cloreto de ciclopropanocarbonilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,20 g do presente composto (7) da fórmula:

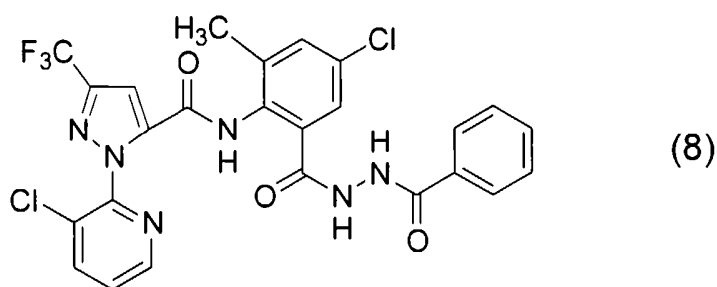


O presente composto (7)

RMN de ^1H (DMSO-d_6 , TMS) δ (ppm): 0,57-0,82 (4H, m), 1,63-1,73 (1H, m), 2,16 (3H, s), 7,43 (1H, s), 7,54 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,74 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 10,19 (2H, sl), 10,40 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 8

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,07 g de cloreto de benzoílo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,15 g do presente composto (8) da fórmula:

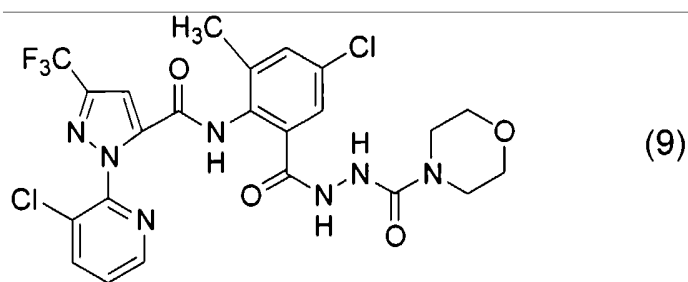


O presente composto (8)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 7,48-7,69 (5H, m), 7,77 (1H, s), 7,90-7,96 (3H, m), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,55 (1H, d, $J=4$ Hz), 10,36 (1H, sl), 10,42 (1H, sl), 10,60 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 9

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,07 g de cloreto de 4-morfolinacarbonilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,12 g do presente composto (9) da fórmula:

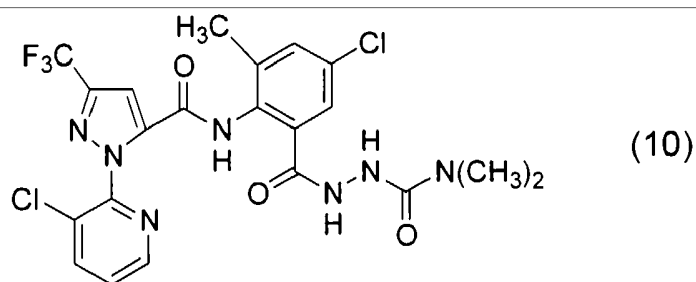


O presente composto (9)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,22-3,42 (4H, m), 3,53-3,63 (4H, m), 7,44 (1H, s), 7,53 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,77 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,78 (1H, sl), 9,88 (1H, sl), 10,33 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 10

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,06 g de cloreto de N,N-dimetilcarbamoílo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,13 g do presente composto (10) da fórmula:



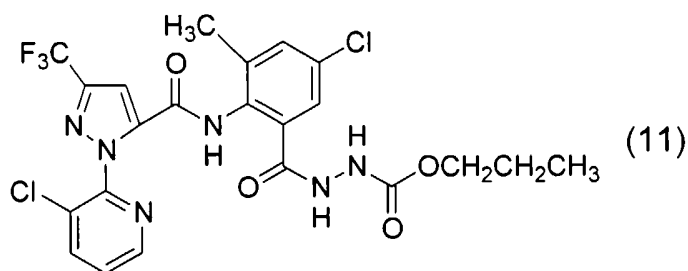
O presente composto (10)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,14 (3H, s), 2,86 (6H, s), 7,42 (1H, s), 7,52 (1H, s), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,82 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,48-8,58 (2H, m), 9,83 (1H, sl), 10,31 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 11

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,06 g de cloroformato de N-propilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2

horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,24 g do presente composto (11) da fórmula:

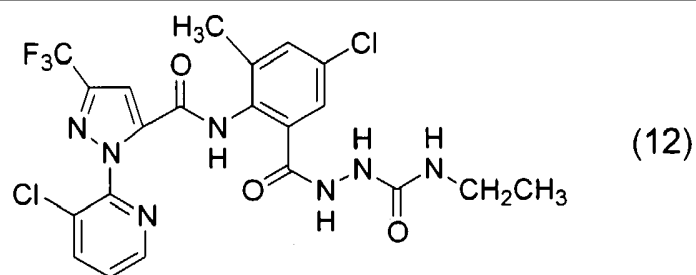


O presente composto (11)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 0,66-0,98 (3H, m), 1,37-1,66 (2H, m), 2,16 (3H, s), 3,83-4,08 (2H, m), 7,38 (1H, s), 7,55 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,71 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,26 (1H, sl), 10,14 (1H, sl), 10,37 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 12

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de isocianato de etilo e 10 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,16 g do presente composto (12) da fórmula:

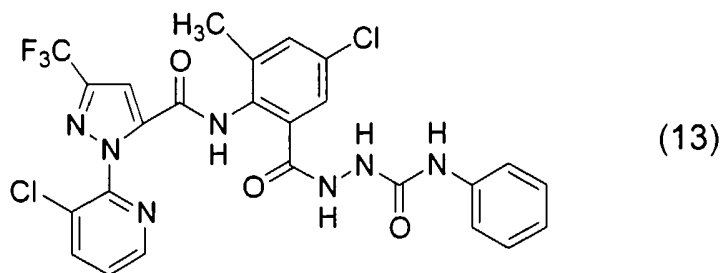


O presente composto (12)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,12 (3H, t, $J=6$ Hz), 2,18 (3H, s), 3,78 (2H, q, $J=6$ Hz), 6,34 (1H, m), 7,48 (1H, s), 7,54 (1H, s), 7,65-7,69 (2H, m), 7,74 (1H, sl), 8,23 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,99 (1H, sl), 10,34 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 13

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,07 g de isocianato de fenilo e 10 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e os precipitados depositados foram recolhidos por filtração para obter 0,12 g do presente composto (13) da fórmula:

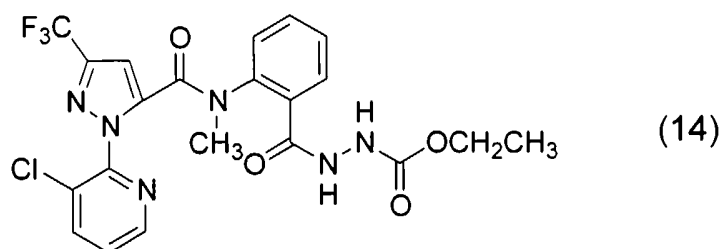


O presente composto (13)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 6,93-7,00 (2H, m), 7,21-7,31 (2H, m), 7,40-7,47 (2H, m), 7,51 (1H, s), 7,54-7,58 (1H, m), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,71 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,73 (1H, sl), 10,18 (1H, sl), 10,40 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 14

Uma mistura de 0,24 g de N-(2-metilaminobenzoil)-N'-etoxicarbonil-hidrazina, 0,31 g de cloreto de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,20 g do presente composto (14) da fórmula:

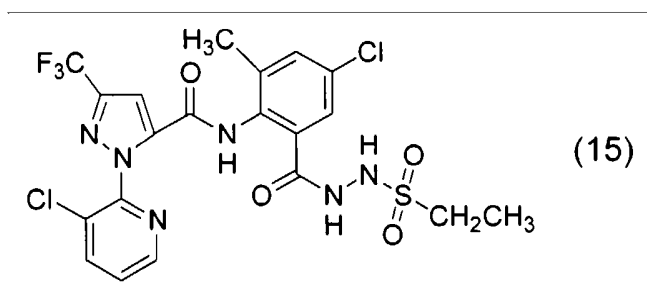


O presente composto (14)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,06-1,27 (3H, m), 3,18 (3H, s), 4,01-4,16 (2H, m), 6,34 (1H, s), 7,31-7,37 (1H, m), 7,53-7,61 (3H, m), 7,71 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,31 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,62 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,33 (1H, sl), 10,44 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 15

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de cloreto de etanossulfonilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,14 g do presente composto (15) da fórmula:



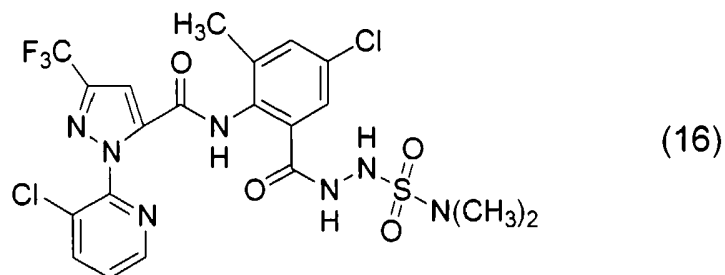
O presente composto (15)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,20 (3H, t, $J=8$ Hz), 2,18 (3H, s), 3,02 (2H, q, $J=8$ Hz), 7,39 (1H, s), 7,57 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,68 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,95 (1H, sl), 10,41 (1H, sl), 10,57 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 16

[0919] Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de cloreto de N,N-dimetilsulfamoílo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a

mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,14 g do presente composto (16) da fórmula:

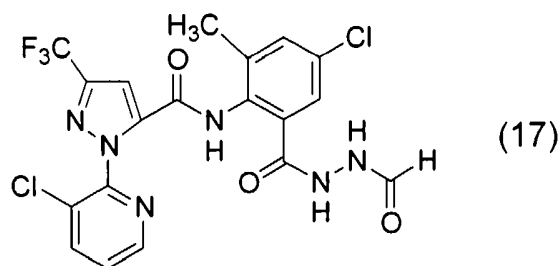


O presente composto (16)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 2,71 (6H, s), 7,28 (1H, s), 7,57 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,75 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,31 (1H, sl), 10,42 (1H, sl), 10,51 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 17

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 10 mL de ácido fórmico e 5 mL de anidrido acético preparada sob arrefecimento com gelo foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,02 g do presente composto (17) da fórmula:

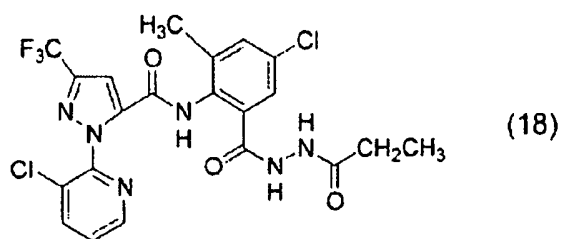


O presente composto (17)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 7,43 (1H, s), 7,56 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,73 (1H, s), 8,05 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 10,13 (1H, sl), 10,39 (1H, sl), 10,46 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 18

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de cloreto de propionilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,15 g do presente composto (18) da fórmula:

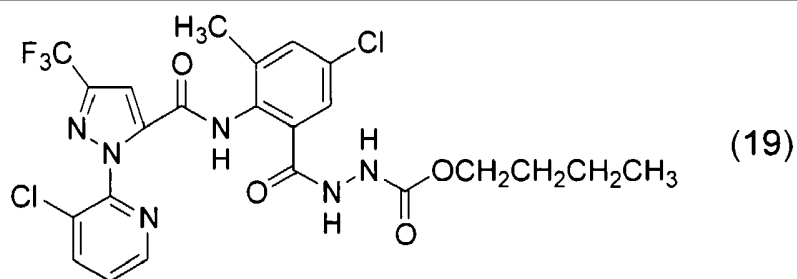


O presente composto (18)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,04 (3H, t, $J=8$ Hz), 2,13 (5H, m), 7,44 (1H, s), 7,55 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,74 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,91 (1H, sl), 10,16 (1H, sl), 10,36 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 19

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de cloroformato de n-butilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,19 g do presente composto (19) da fórmula:

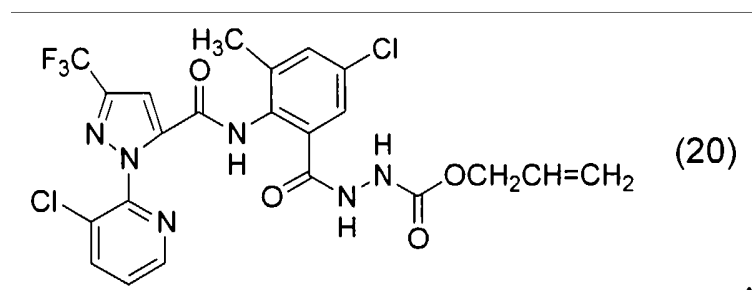


O presente composto (19)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 0,79-0,94 (3H, m), 1,22-1,40 (2H, m), 1,46-1,62 (2H, m), 2,17 (3H, s), 3,92-4,13 (2H, m), 7,37 (1H, s), 7,56 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,70 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,25 (1H, sl), 10,14 (1H, sl), 10,37 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 20

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de cloroformato de alilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,23 g do presente composto (20) da fórmula:



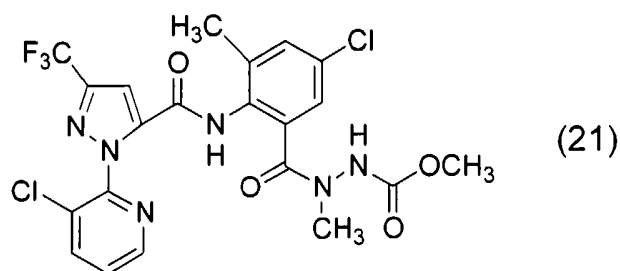
O presente composto (20)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 4,43-4,60 (2H, m), 5,21 (1H, d, $J=6$ Hz), 5,33 (1H, d, $J=8$ Hz), 5,86-6,00 (1H, m), 7,39 (1H, s), 7,56 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,70 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,39 (1H, sl), 10,18 (1H, sl), 10,38 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 21

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de cloroformato de metilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente

durante 2 horas. Foi vertida água para a solução reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,09 g do presente composto (21) da fórmula:

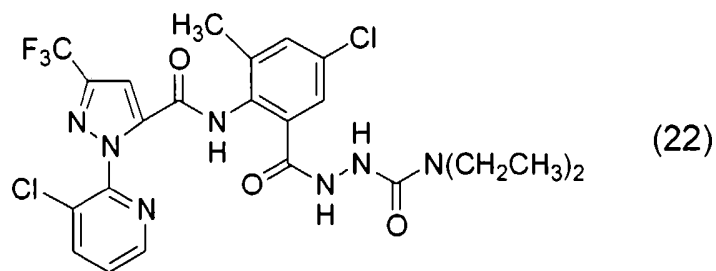


O presente composto (21)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,11 (3H, s), 3,06 (3H, s), 3,33 (3H, s), 7,07 (1H, s), 7,45 (1H, s), 7,68 (1H, s), 7,69 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,24 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,55 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,11 (0,6H, sl), 10,20 (1H, sl), 10,54 (0,4H, sl)

Exemplo de Preparação 22

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de cloreto de N,N-dietilcarbamoílo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,19 g do presente composto (22) da fórmula:

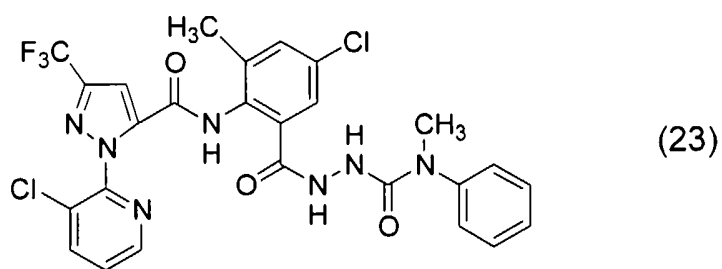


O presente composto (22)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,06 (6H, t, $J=6$ Hz), 2,14 (3H, s), 3,26 (4H, q, $J=6$ Hz), 7,42 (1H, s), 7,52 (1H, s), 7,68 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,82 (1H, s), 8,23 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,48 (1H, sl), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,84 (1H, sl), 10,35 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 23

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,10 g de cloreto de N-metil-N-fenilcarbamoílo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,19 g do presente composto (23) da fórmula:

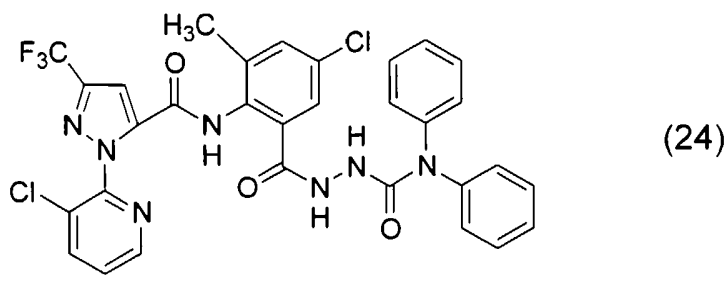


O presente composto (23)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,08 (3H, s), 7,10-7,45 (6H, m), 7,53 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,76 (1H, s), 8,14 (1H, sl), 8,20 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,97 (1H, sl), 10,32 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 24

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,15 g de cloreto de N,N-difenilcarbamoílo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,24 g do presente composto (24) da fórmula:



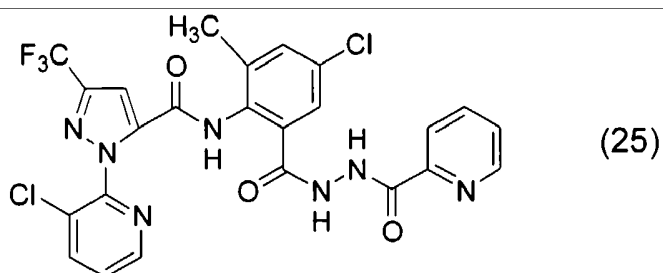
O presente composto (24)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 6,77 (1H, t, $J=8$ Hz), 6,81 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,05-7,39 (9H, m), 7,52 (1H, s), 7,64 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,72 (1H, s), 8,13 (1H, sl), 8,19

(1H, d, J=8 Hz) 8,47 (1H, d, J=4 Hz), 10,08 (1H, sl), 10,34 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 25

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,07 g de cloridrato de cloreto de picolinoílo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para uma mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,16 g do presente composto (25) da fórmula:

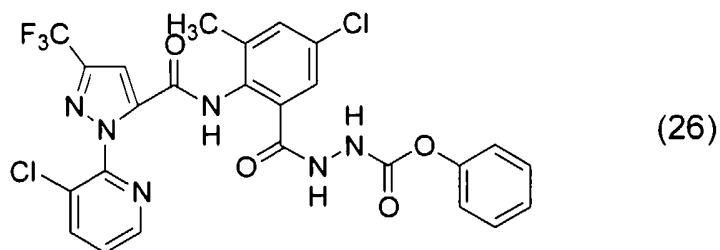


O presente composto (25)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 7,50-7,59 (2H, m), 7,63-7,71 (3H, m), 7,77-7,88 (1H, m), 8,05 (1H, s), 8,06 (1H, s), 8,23 (1H, d, J=8 Hz), 8,54 (1H, d, J=4 Hz), 8,70 (1H, d, J=4 Hz), 10,35-10,70 (2H, m)

Exemplo de Preparação 26

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,07 g de cloroformato de fenilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,16 g do presente composto (26) da fórmula:



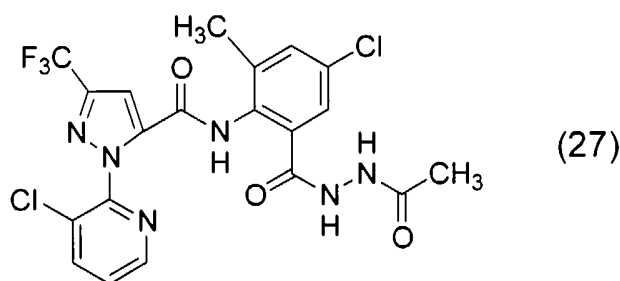
O presente composto (26)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,17 (3H, s), 7,13-7,69 (9H, m), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz) 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,95 (1H, sl), 10,43 (1H, sl), 10,45 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 27

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,04 g de cloreto de acetilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado

depositado foi recolhido por filtração para obter 0,22 g do presente composto (27) da fórmula:

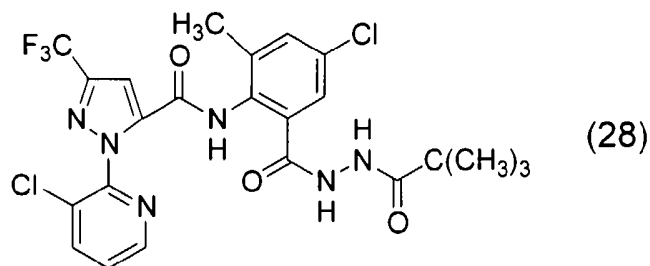


O presente composto (27)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,89 (3H, s), 2,16 (3H, s), 7,44 (1H, s), 7,55 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,73 (1H, s), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,94 (1H, sl), 10,17 (1H, sl), 10,38 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 28

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,06 g de cloreto de trimetilacetilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,25 g do presente composto (28) da fórmula:

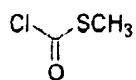


O presente composto (28)

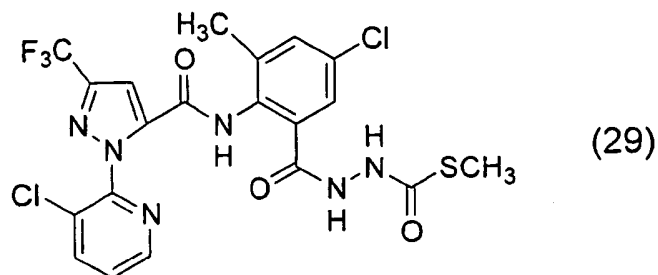
RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,17 (9H, s), 2,15 (3H, s), 7,46 (1H, s), 7,54 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,76 (1H, s), 8,23 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,66 (1H, sl), 10,01 (1H, sl), 10,32 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 29

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de formato de metilclorotiol da fórmula:



e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,10 g do presente composto (29) da fórmula:

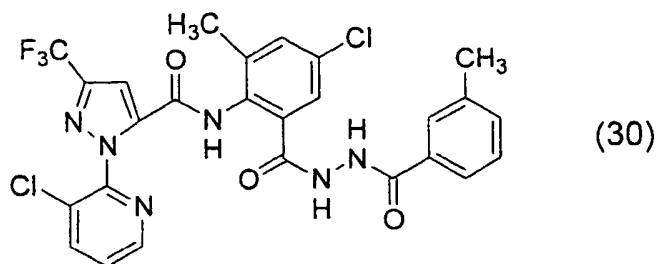


O presente composto (29)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,03-2,34 (6H, m), 7,40 (1H, s), 7,58 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,71 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,84 (1H, sl), 10,41 (1H, sl), 10,56 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 30

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,09 g de cloreto de 3-metilbenzoílo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,19 g do presente composto (30) da fórmula:

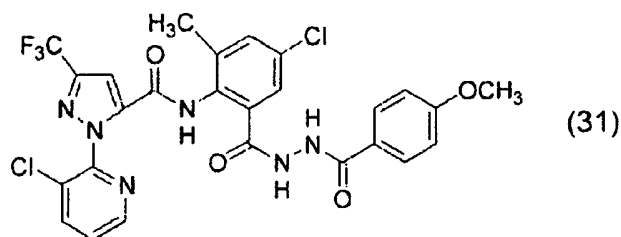


O presente composto (30)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 2,30 (3H, s), 7,40 (1H, s), 7,55 (1H, s), 7,58 (1H, s), 7,65-7,73 (4H, m), 7,77 (1H, s), 8,23 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 10,35 (1H, sl), 10,41 (1H, sl), 10,54 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 31

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,09 g de cloreto de 4-metoxibenzoílo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,09 g do presente composto (31) da fórmula:

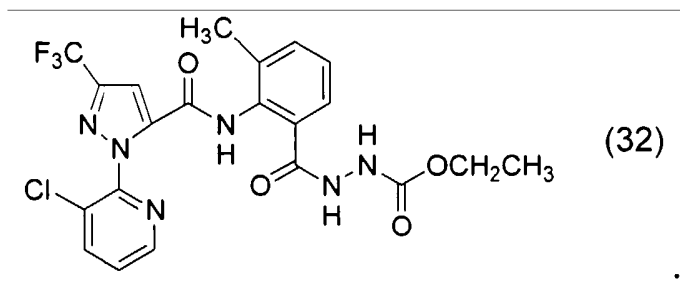


O presente composto (31)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 3,83 (3H, s), 7,04 (2H, d, $J=8$ Hz), 7,55 (1H, s), 7,58 (1H, s), 7,69 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,77 (1H, s), 7,90 (2H, d, 8 Hz), 8,23 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 10,28 (1H, sl), 10,41 (1H, sl), 10,45 (1H, sl)

Exemplos de Preparação 32

Uma mistura de 0,18 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,06 mL de cloroformato de etilo e 1 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foram adicionados sucessivamente água e tolueno à mistura reaccional e a mistura foi concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi misturado com éter terc-butil-metílico e água, a mistura foi separada em camadas, a camada orgânica resultante foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,14 g do presente composto (32) da fórmula:

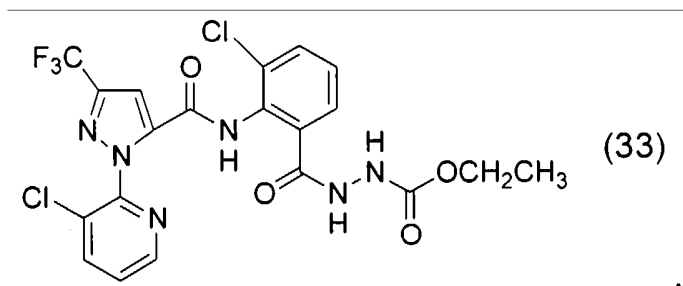


O presente composto (32)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,26 (3H, ml), 2,21 (3H, s), 4,18 (2H, ql, $J=7$ Hz), 6,88 (1H, sl), 7,17 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,28-7,39 (4H, m), 7,86 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,05 (1H, sl), 8,43 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,73 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 33

Uma mistura de 0,21 g de N-[2-cloro-6-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,06 mL de cloroformato de etilo e 5 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com ácido clorídrico 2 mol/L, uma solução aquosa saturada de bicarbonato de sódio e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,16 g do presente composto (33) da fórmula:

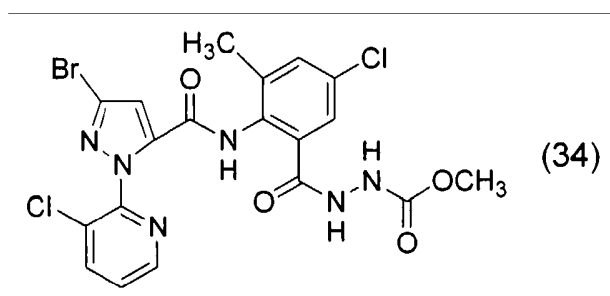


O presente composto (33)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,28 (3H, t, $J=7$ Hz), 4,21 (2H, q, $J=7$ Hz), 6,76 (1H, sl), 7,23-7,30 (2H, m), 7,42 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,50 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,55 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,85 (1H, sl), 7,90 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,47 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,16 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 34

Uma mistura de 0,30 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,20 mL de cloroformato de metilo, 0,09 mL de trietilamina, 20 mL de acetonitrilo e 10 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas com sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,13 g do presente composto (34) da fórmula:

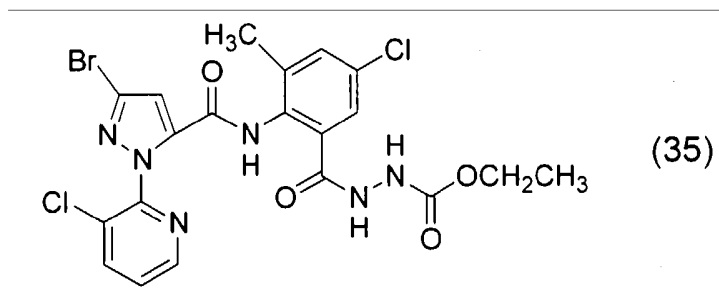


O presente composto (34)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,14 (3H, s), 3,61 (3H, sl), 7,33 (1H, s), 7,37 (1H, sl), 7,53 (1H, sl), 7,60 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,16 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,49 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,29 (1H, sl), 10,15 (1H, sl), 10,22 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 35

Uma mistura de 0,30 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,09 mL de cloroformato de etilo e 3 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas e concentrada sob pressão reduzida. Foram adicionados água e tolueno ao resíduo resultante, a mistura foi filtrada, o bolo de filtração resultante foi misturado com éter terc-butil-metílico e água e a mistura foi separada em camadas. A camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,23 g do presente composto (35) da fórmula:

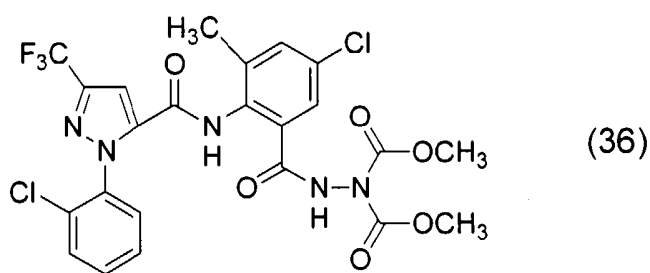


O presente composto (35)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 1,18 (3H, ml), 2,14 (3H, s), 4,06 (2H, ml), 7,34 (1H, s), 7,37 (1H, sl), 7,53 (1H, s), 7,60 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,16 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,49 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,24 (1H, sl), 10,12 (1H, sl), 10,21 (1H, sl)

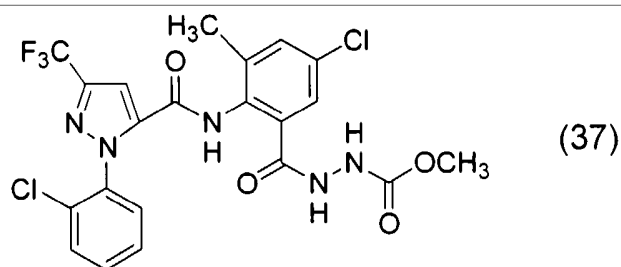
Exemplos de Preparação 36 e 37

A uma solução de 0,30 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em 10 mL de acetonitrilo foram adicionados 0,10 mL de cloroformato de metilo e 0,09 mL de trietilamina, a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora e foram adicionados 0,10 mL de cloroformato de metilo à mistura, seguido de mais agitação durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,16 g do presente composto (36) e 0,16 g do presente composto (37) de fórmulas:



O presente composto (36)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,76 (6H, s), 7,23-7,27 (3H, m), 7,30-7,40 (2H, m), 7,43-7,47 (2H, m), 8,84 (1H, sl), 9,29 (1H, sl)

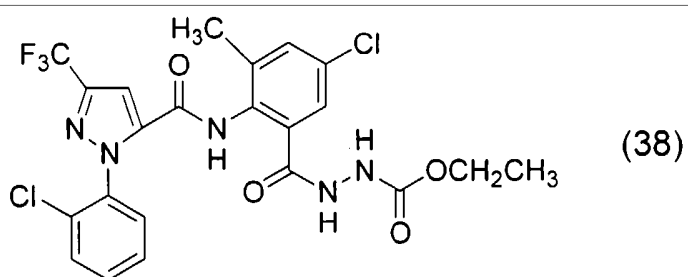


O presente composto (37)

RMN de ¹H (DMSO-d₆) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 3,68 (3H, sl), 7,44 (1H, sl), 7,53-7,72 (6H, m), 9,35 (1H, sl), 10,23 (1H, sl), 10,32 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 38

Uma mistura de 0,30 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 2 mL de piridina e 0,09 mL de cloroformato de etilo foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora e concentrada sob pressão reduzida. Foram adicionados água e tolueno ao resíduo resultante e a mistura foi filtrada. O bolo de filtração foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,22 g do presente composto (38) da fórmula:

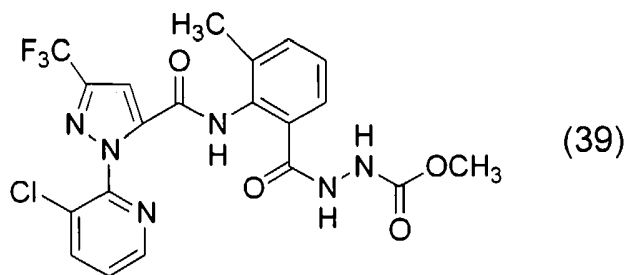


O presente composto (38)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 1,19 (3H, ml), 2,15 (3H, s), 4,05 (2H, ml), 7,37 (1H, s), 7,49-7,66 (6H, m), 9,22 (1H, sl), 10,14 (1H, sl), 10,25 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 39

Uma mistura de 0,18 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 mL de cloroformato de metilo e 1 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e foi adicionado tolueno, seguido de concentração sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi misturado com éter terc-butil-metílico e água, a mistura foi separada em camadas e a camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca com sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,13 g do presente composto (39) da fórmula:

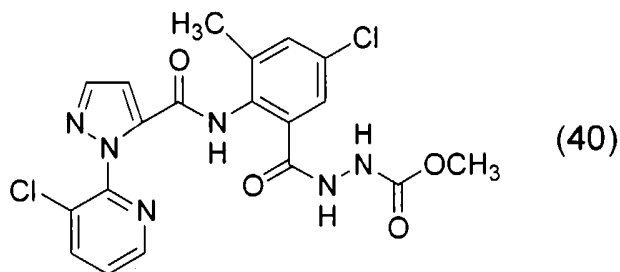


O presente composto (39)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 3,75 (3H, sl), 6,86 (1H, sl), 7,19 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,27 (1H, s), 7,34-7,40 (3H, m), 7,87 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1,5 Hz), 7,97 (1H, sl), 8,44 (1H, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,68 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 40

Uma mistura de 0,30 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,09 mL de cloroformato de metilo e 3 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 1,5 horas. Foram sucessivamente adicionados água e tolueno à mistura reaccional, seguidos de concentração sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi misturado com acetato de etilo e água, a mistura foi separada em camadas e a camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,20 g do presente composto (40) da fórmula:

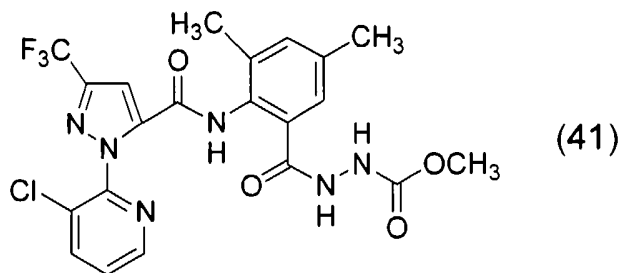


O presente composto (40)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,17 (3H, s), 3,62 (3H, sl), 7,25 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,40 (1H, sl), 7,52 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,56 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,86 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,11 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,48 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,31 (1H, sl), 10,11 (1H, sl), 10,13 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 41

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, foi utilizada N-[4,6-dimetil-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (41) da fórmula:

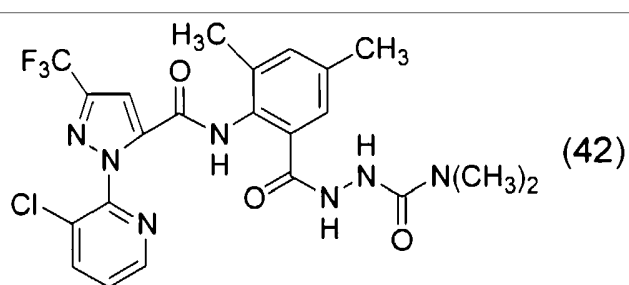


O presente composto (41)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 2,11 (3H, s), 2,29 (3H, s), 3,55-3,68 (3H, m), 7,19-7,25 (2H, m), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,71 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,23 (1H, sl), 9,98 (1H, sl), 10,22 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 42

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, foi utilizada N-[4,6-dimetil-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluormetil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (42) da fórmula:



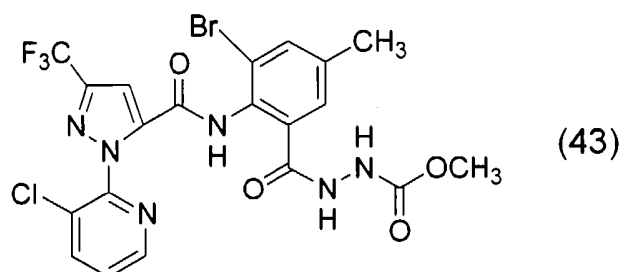
O presente composto (42)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 2,31 (3H, s), 2,86 (6H, s), 7,14-7,27 (2H, m), 7,65-7,70 (1H, m), 7,82 (1H, s), 8,23 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,48 (1H, sl), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,65 (1H, sl), 10,16 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 43

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, foi utilizada N-[6-bromo-2-(hidrazinocarbonil)-4-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-

pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (43) da fórmula:

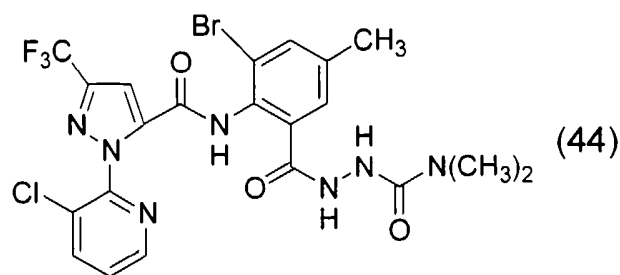


O presente composto (43)

RMN de ¹H (DMSO-d₆, TMS) δ (ppm): 2,35 (3H, s), 3,53-3,65 (3H, m), 7,35 (1H, s), 7,65 (1H, dd, J=8 Hz, 4 Hz), 7,68-7,70 (1H, m), 7,76 (1H, s), 8,20 (1H, d, J=8 Hz), 8,53 (1H, d, J=4 Hz), 9,27 (1H, sl), 10,04 (1H, sl), 10,47 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 44

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, foi utilizada N-[6-bromo-2-(hidrazinocarbonil)-4-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (44) da fórmula:

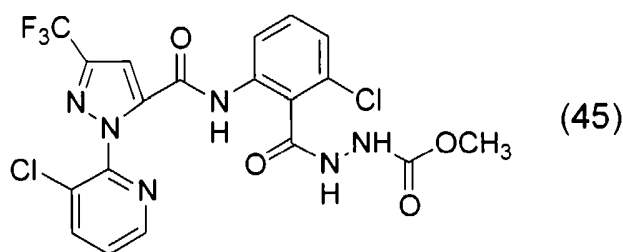


O presente composto (44)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,34 (3H, s), 2,84 (6H, s), 7,40 (1H, s), 7,62-7,70 (2H, m), 7,83 (1H, s), 8,20 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,48 (1H, sl), 8,51-8,56 (1H, m), 9,69 (1H, sl), 10,42 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 45

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, foi utilizada N-[3-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (45) da fórmula:

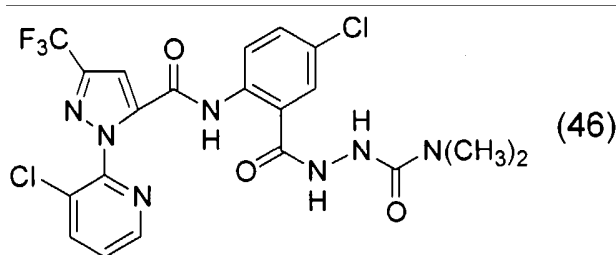


O presente composto (45)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,67-3,74 (3H, m), 7,37-7,47 (2H, m), 7,69-7,74 (1H, m), 7,82-7,88 (2H, m), 8,25-8,33 (1H, m), 8,57 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,71 (1H, sl), 9,83 (1H, sl), 10,56 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 46

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (46) da fórmula:

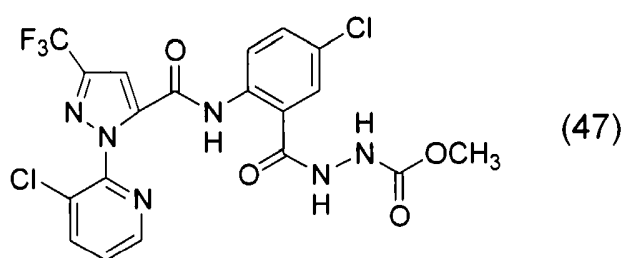


O presente composto (46)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,90 (6H, s), 7,57 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,68-7,70 (1H, m), 7,73 (1H, dd, 8 Hz, 4 Hz), 7,81 (1H, s), 8,18 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,29 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,57 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,83 (1H, sl), 10,36 (1H, sl), 11,27 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 47

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (47) da fórmula:



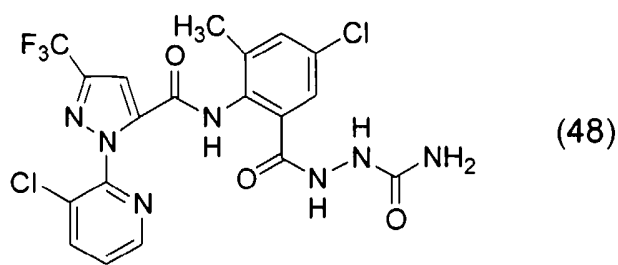
O presente composto (47)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,64-3,71 (3H, m), 7,59 (1H, s), 7,63 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,72 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,86 (1H, s), 8,12 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,29 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,58 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,51 (1H, sl), 10,75 (1H, sl), 11,68 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 48

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,04 g de cianato de sódio, 0,5 mL de ácido acético e 5 mL de clorofórmio foi agitada sob arrefecimento com gelo durante 4 horas. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo resultante foi

lavado sucessivamente com água e clorofórmio para obter 0,080 g do presente composto (48) da fórmula:

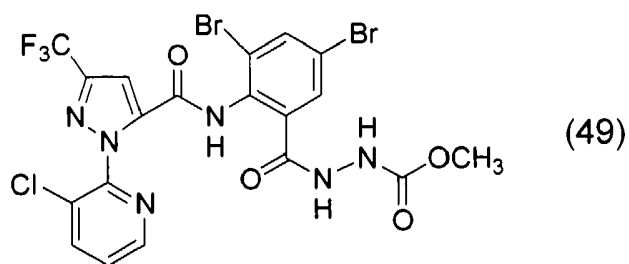


O presente composto (48)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 5,97 (2H, sl), 7,52-7,54 (2H, m), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,70 (1H, s), 7,76 (1H, sl), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 10,01 (1H, sl), 10,39 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 49

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (49) da fórmula:

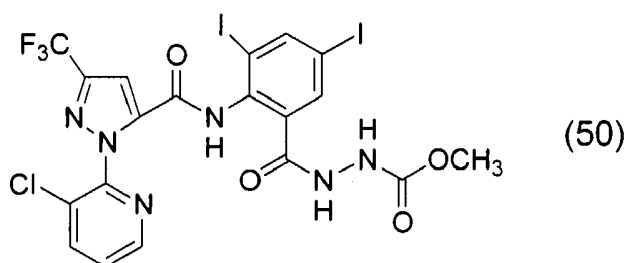


O presente composto (49)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,40-3,70 (3H, m), 7,63-7,69 (2H, m), 7,76 (1H, s), 8,16 (1H, s), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,35 (1H, sl), 10,23 (1H, sl), 10,63 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 50

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[4,6-diiodo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (50) da fórmula:

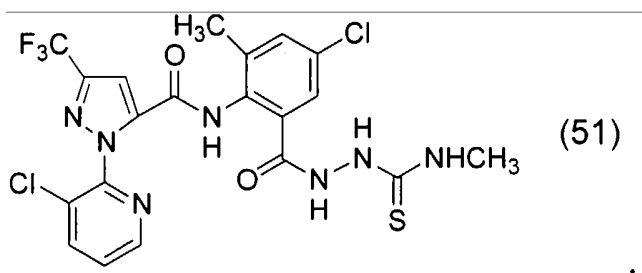


O presente composto (50)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,55-3,65 (3H, m), 7,65 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,75-7,82 (2H, m), 8,20 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,39 (1H, s), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,31 (1H, sl), 10,14 (1H, sl), 10,59 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 51

Uma mistura de 0,22 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,05 g de isotiocianato de metilo e 10 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,20 g do presente composto (51) da fórmula:

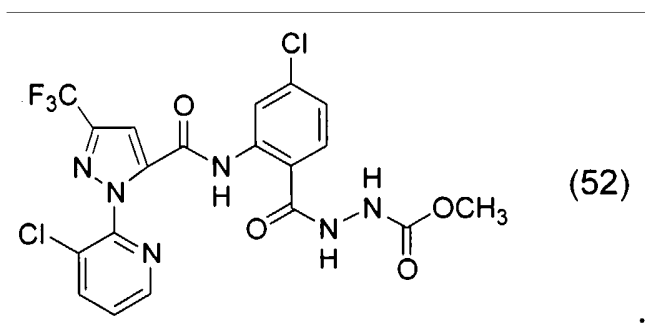


O presente composto (51)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,20 (3H, s), 2,85 (3H, d, $J=4$ Hz), 7,57 (1H, s), 7,60-7,63 (2H, m), 7,68 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,72 (1H, sl), 8,24 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,57 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,13 (1H, sl), 10,31 (1H, sl), 10,42 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 52

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[5-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (52) da fórmula:



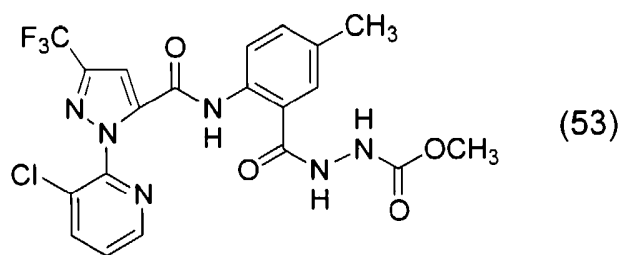
O presente composto (52)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,60-3,77 (3H, m), 7,40 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,57 (1H, s), 7,74 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,85 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,22 (1H, s), 8,31 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,59 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,49 (1H, sl), 10,77 (1H, sl), 12,04 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 53

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[2-(hidrazinocarbonil)-4-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-

(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (53) da fórmula:

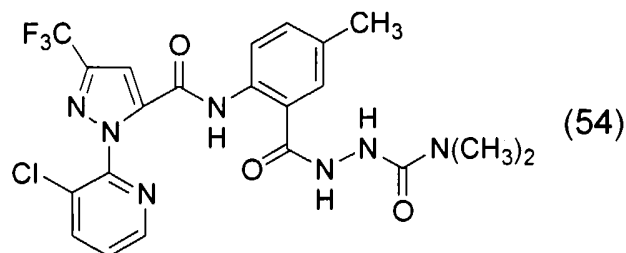


O presente composto (53)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,32 (3H, s), 3,60-3,72 (3H, m), 7,37 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,55 (1H, s), 7,65 (1H, s), 7,73 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,02 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,29 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,57 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,43 (1H, sl), 10,64 (1H, sl), 11,72 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 54

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, excepto que foi utilizada N-[2-(hidrazinocarbonil)-4-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (54) da fórmula:

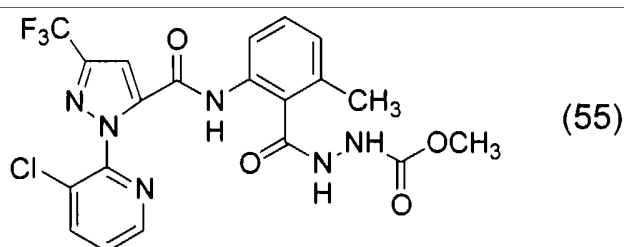


O presente composto (54)

RMN de ¹H (DMSO-d₆, TMS) δ (ppm): 2,31 (3H, s), 2,91 (6H, s), 7,29-7,34 (1H, m), 7,48-7,51 (1H, m), 7,70-7,79 (2H, m), 8,04-8,09 (1H, m), 8,26-8,33 (1H, m), 8,55-8,60 (1H, m), 8,75 (1H, sl), 10,24 (1H, sl), 11,30 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 55

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[2-(hidrazinocarbonil)-3-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (55) da fórmula:

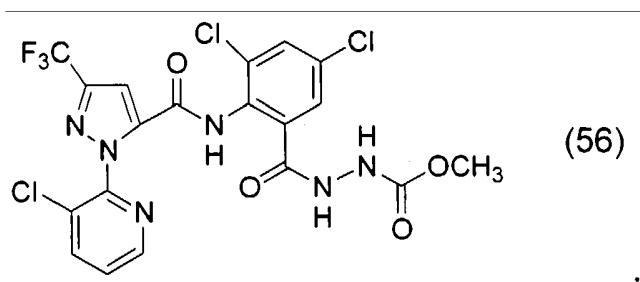


O presente composto (55)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,32 (3H, s), 3,62-3,75 (3H, m), 7,12 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,31 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,61 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,68-7,73 (1H, m), 7,80 (1H, s), 8,27 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,56 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,59 (1H, sl), 9,66 (1H, sl), 10,30 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 56

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[4,6-dicloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (56) da fórmula:

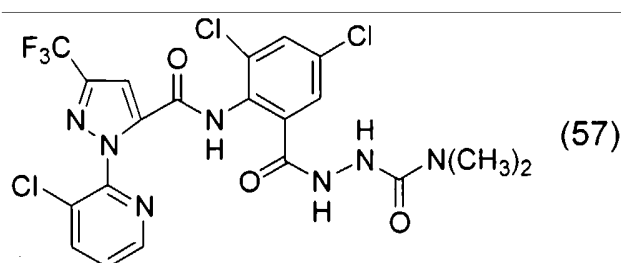


O presente composto (56)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,45-3,66 (3H, m), 7,51 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,76 (1H, s), 7,94 (1H, s), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,37 (1H, sl), 10,27 (1H, sl), 10,64 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 57

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, excepto que foi utilizada N-[4,6-dicloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (57) da fórmula:



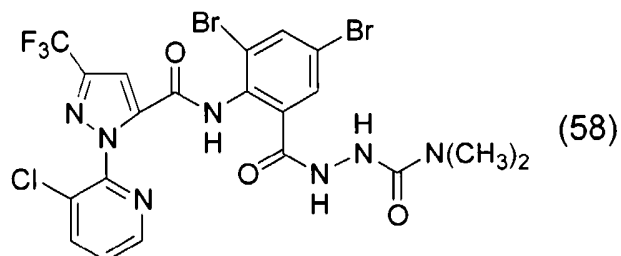
O presente composto (57)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,85 (6H, s), 7,58 (1H, s), 7,64-7,70 (1H, m), 7,85 (1H, s), 7,90 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,58 (1H, sl), 9,91 (1H, sl), 10,59 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 58

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10,, excepto que foi utilizada N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-

trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (58) da fórmula:

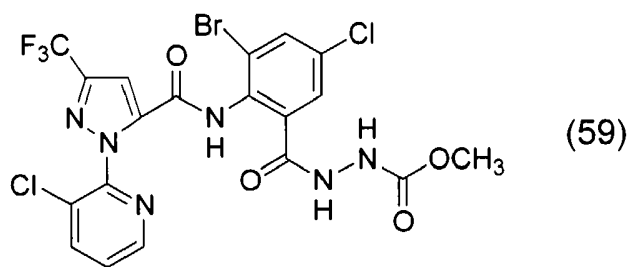


O presente composto (58)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,84 (6H, s), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,74 (1H, s), 7,83 (1H, s), 8,13 (1H, s), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,52-8,57 (2H, m), 9,88 (1H, sl), 10,60 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 59

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[6-bromo-4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (59) da fórmula:

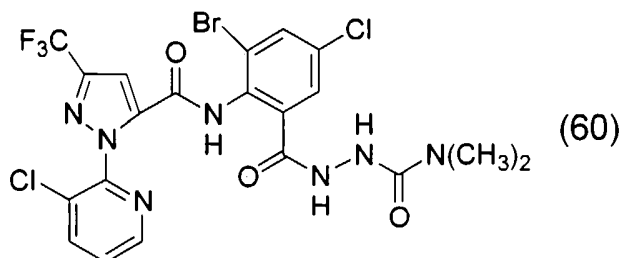


O presente composto (59)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,55-3,65 (3H, m), 7,54 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,76 (1H, s), 8,06 (1H, s), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,36 (1H, sl), 10,23 (1H, sl), 10,64 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 60

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, excepto que foi utilizada N-[6-bromo-4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (60) da fórmula:

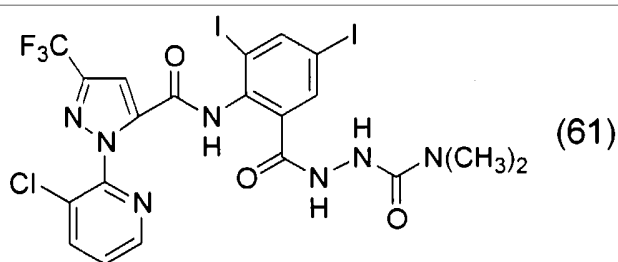


O presente composto (60)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,84 (6H, s), 7,62 (1H, s), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,83 (1H, s), 8,02 (1H, s), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,52-8,57 (2H, m), 9,87 (1H, sl), 10,60 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 61

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, excepto que foi utilizada N-[4,6-diiodo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (61) da fórmula:

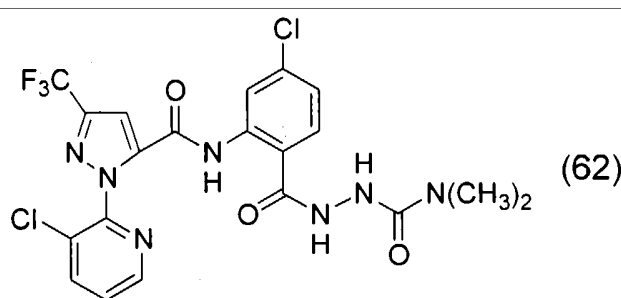


O presente composto (61)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,83 (6H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,82 (1H, s), 7,88 (1H, s), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,37 (1H, s), 8,48 (1H, sl), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,78 (1H, sl), 10,55 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 62

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, excepto que foi utilizada N-[5-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (62) da fórmula:



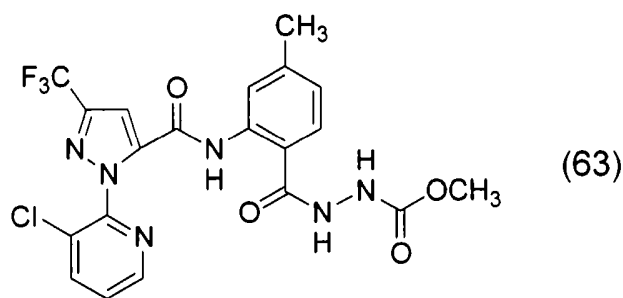
O presente composto (62)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,91 (6H, s), 7,33-7,48 (1H, m), 7,67-7,81 (3H, m), 8,24-8,35 (2H, m), 8,56-8,63 (1H, m), 8,80 (1H, sl), 10,38 (1H, sl), 11,57 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 63

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[2-(hidrazinocarbonil)-5-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-

trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (63) da fórmula:

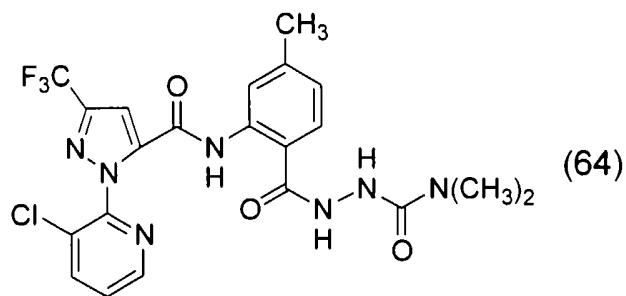


O presente composto (63)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,32 (3H, s), 3,60-3,69 (3H, m), 7,09 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,54 (1H, s), 7,71-7,79 (2H, m), 8,06 (1H, s), 8,30 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,58 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,41 (1H, sl), 10,64 (1H, sl), 12,19 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 64

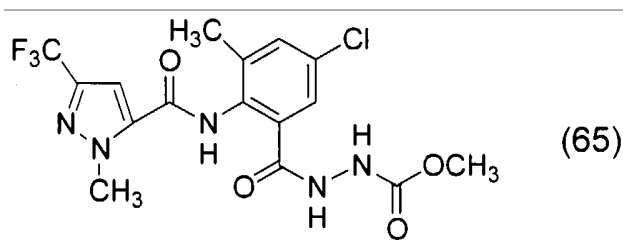
De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, excepto que foi utilizada N-[2-(hidrazinocarbonil)-5-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (64) da fórmula:



RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,31 (3H, s), 2,90 (6H, s), 7,07 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,64-7,68 (2H, m), 7,74 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,07 (1H, s), 8,31 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,58 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,67 (1H, sl), 10,28 (1H, sl), 11,82 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 65

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 3, excepto que foi utilizada N-(2-amino-5-cloro-3-metilbenzoil)-N'-metoxycarbonil-hidrazina em vez de N-(2-aminobenzoil)-N'-etoxycarbonil-hidrazina para obter o presente composto (65) da fórmula:

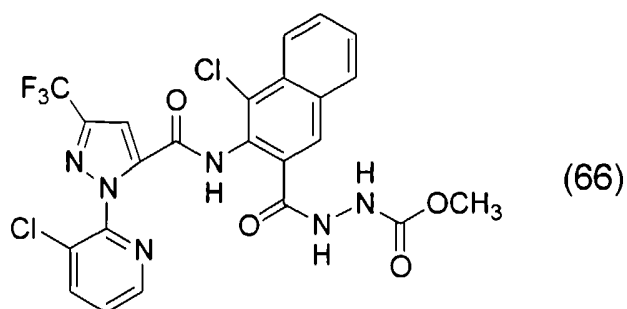


O presente composto (65)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,25 (3H, s), 3,59 (3H, s), 4,13 (3H, s), 7,40 (1H, s), 7,44 (1H, s), 7,59 (1H, s), 9,26 (1H, sl), 10,11 (1H, sl), 10,17 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 66

Uma mistura de 0,28 g de N-[1-cloro-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,06 g de cloroformato de metilo e 10 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,08 g do presente composto (66) da fórmula:



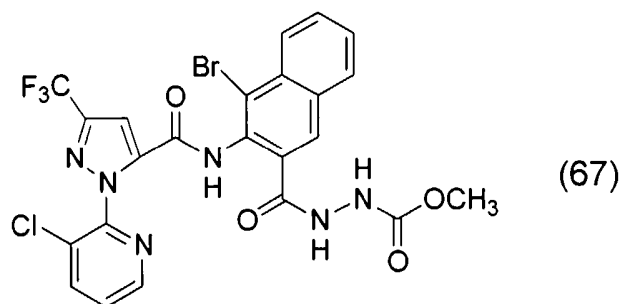
O presente composto (66)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,60-3,68 (3H, m), 7,35-7,43 (1H, m), 7,60-7,85 (3H, m), 8,12-8,28 (3H, m), 8,52-8,60 (2H, m), 9,35 (1H, sl), 10,32 (1H, sl), 10,76 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 67

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 66, excepto que foi utilizada N-[1-bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[1-cloro-3-(hidrazinocarbonil)-2-

naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (67) da fórmula:

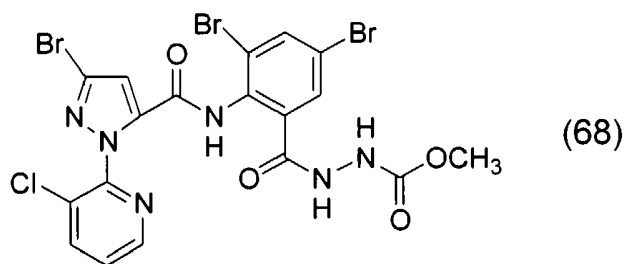


O presente composto (67)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,58-3,69 (3H, m), 7,34-7,44 (1H, m), 7,60-7,85 (3H, m), 8,10-8,28 (3H, m), 8,50-8,62 (2H, m), 9,33 (1H, sl), 10,28 (1H, sl), 10,78 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 68

Uma mistura de 0,30 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,45 g de carbazato de metilo e 10 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Na mistura reaccional, foram vertidos 30 mL de água e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,14 g do presente composto (68) da fórmula:

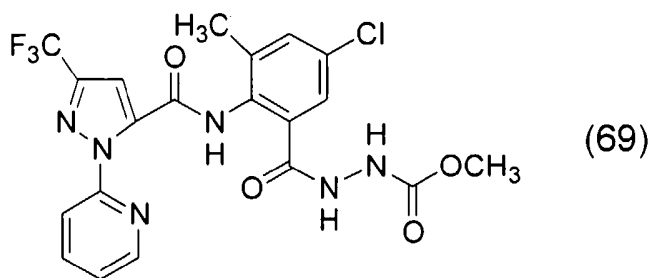


O presente composto (68)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,44-3,66 (3H, m), 7,45 (1H, s), 7,60 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,65 (1H, s), 8,14-8,18 (2H, m), 8,50 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,36 (1H, sl), 10,26 (1H, sl), 10,55 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 69

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (69) da fórmula:

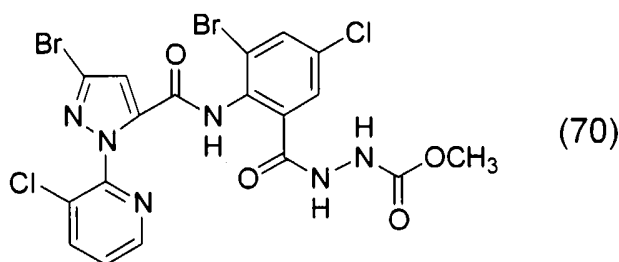


O presente composto (69)

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,33 (3H, s), 3,63 (3H, s), 7,36 (2H, s), 7,52 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,58 (1H, s), 7,81 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,06 (1H, t, $J=8$ Hz), 8,46 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,33 (1H, sl), 10,19 (1H, sl), 10,34 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 70

Uma mistura de 0,30 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-bromo-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,45 g de carbazato de metilo e 10 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Na mistura reaccional, foram vertidos 30 mL de água e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,13 g do presente composto (70) da fórmula:

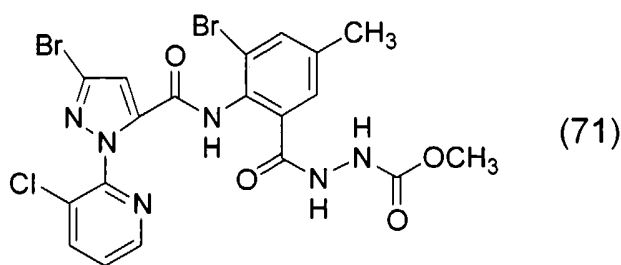


O presente composto (70)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,48-3,62 (3H, m), 7,41 (1H, s), 7,53-7,62 (2H, m), 8,05 (1H, s), 8,16 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,36 (1H, sl), 10,21 (1H, sl), 10,48 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 71

Uma mistura de 0,30 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-bromo-6-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,45 g de carbazato de metilo e 10 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Na mistura reaccional, foram vertidos 30 mL de água e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,17 g do presente composto (71) da fórmula:

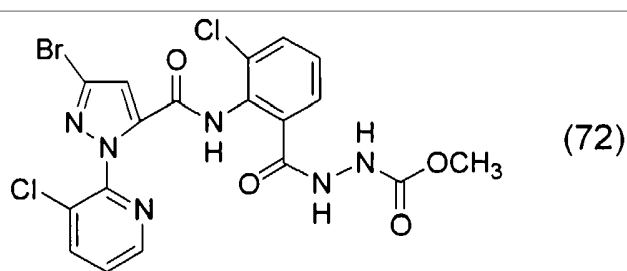


O presente composto (71)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,34 (3H, s), 3,56-3,64 (3H, m), 7,32-7,44 (2H, m), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,66-7,71 (1H, m), 8,15 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,27 (1H, sl), 10,01 (1H, sl), 10,31 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 72

Uma mistura de 0,21 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,9 g de carbazato de metilo e 10 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e esta foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,10 g do presente composto (72) da fórmula:



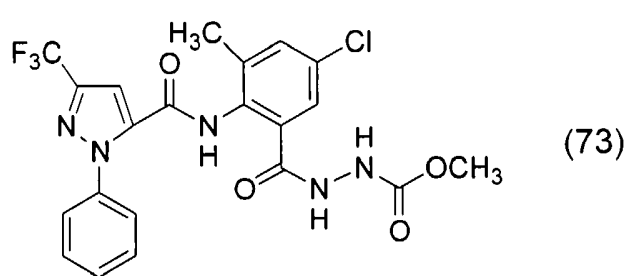
O presente composto (72)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,44-3,65 (3H, m), 7,40-7,54 (3H, m), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,68 (1H, d, $J=8$ Hz),

8,15 (1H, d, J=8 Hz), 8,49 (1H, d, J=4 Hz), 9,29 (1H, sl), 10,11 (1H, sl), 10,39 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 73

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (73) da fórmula:



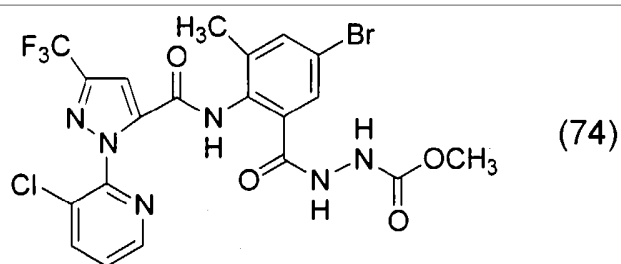
O presente composto (73)

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 3,61 (3H, s), 7,37 (1H, s), 7,49-7,55 (7H, m), 9,31 (1H, sl), 10,22 (1H, sl), 10,30 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 74

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 6-bromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-

benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (74) da fórmula:

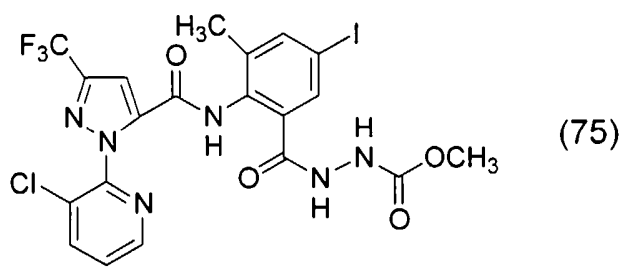


O presente composto (74)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,56-3,65 (3H, m), 7,47-7,55 (1H, m), 7,62-7,75 (3H, m), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,31 (1H, sl), 10,17 (1H, sl), 10,38 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 75

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6-iodo-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (75) da fórmula:

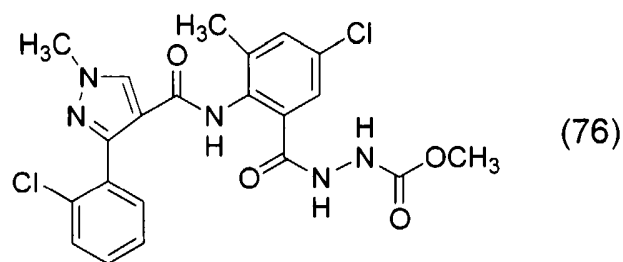


O presente composto (75)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,12 (3H, s), 3,55-3,66 (3H, m), 7,63-7,72 (3H, m), 7,83 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,28 (1H, sl), 10,14 (1H, sl), 10,35 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 76

Uma mistura de 0,18 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxamida, 45 mg de cloroformato de metilo, 68 mg de piridina e 5 mL de acetonitrilo foi preparada sob arrefecimento com gelo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 0,5 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,12 g do presente composto (76) da fórmula:

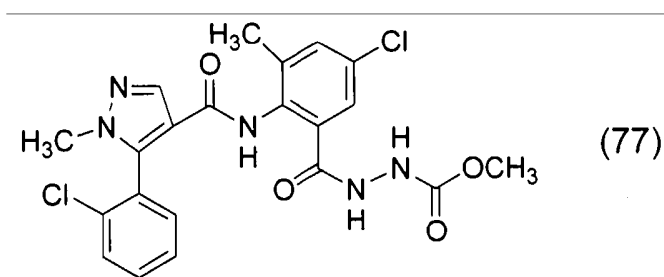


O presente composto (76)

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 3,37-3,67 (6H, m), 7,37 (1H, sl), 7,42-7,52 (4H, m), 7,60 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,13 (1H, s), 9,28-9,37 (2H, m), 10,13 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 77

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação (76), excepto que foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-5-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxamida para obter o presente composto (77) da fórmula:

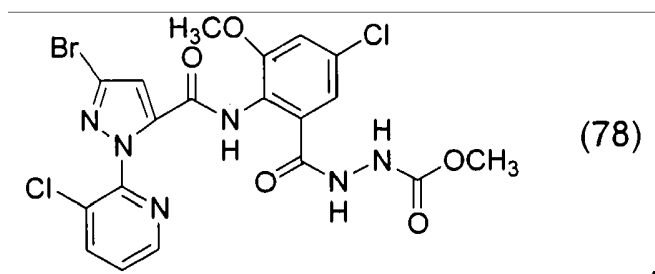


O presente composto (77)

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 2,17 (3H, s), 3,46-3,62 (3H, m), 3,94 (3H, s), 7,32-7,41 (4H, m), 7,44-7,46 (1H, m), 7,50 (1H, s), 8,36 (1H, s), 9,30-9,34 (2H, m), 10,17 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 78

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metoxi-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (78) da fórmula:

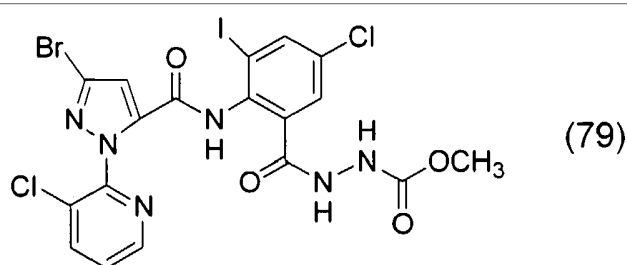


O presente composto (78)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,56-3,64 (3H, m), 3,77-3,80 (3H, m), 7,12 (1H, sl), 7,32 (1H, sl), 7,38 (1H, sl), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,15 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,28 (1H, sl), 9,95 (1H, sl), 10,07 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 79

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-iodo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (79) da fórmula:

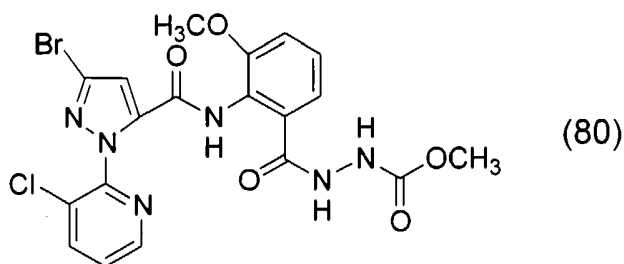


O presente composto (79)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,56-3,64 (3H, m), 7,43 (1H, s), 7,53 (1H, s), 7,60 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,12-8,19 (2H, m), 8,50 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,34 (1H, sl), 10,16 (1H, sl), 10,47 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 80

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metoxi-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (80) da fórmula:

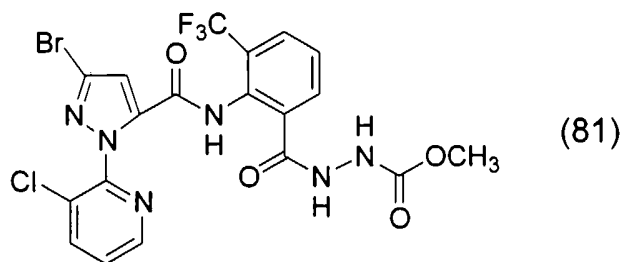


O presente composto (80)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,52-3,64 (3H, m), 3,74 (3H, s), 7,07-7,14 (1H, m), 7,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,31-7,42 (2H, m), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,15 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,21 (1H, sl), 9,87 (1H, sl), 9,92 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 81

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-trifluorometil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (81) da fórmula:



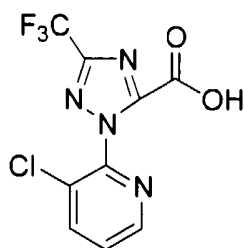
O presente composto (81)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,46-3,69 (3H, m), 7,41 (1H, s), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,68 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,77-7,87 (1H, m), 7,90-7,97 (1H, m), 8,14 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,48 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,32 (1H, sl), 10,14 (1H, sl), 10,48 (1H, sl)

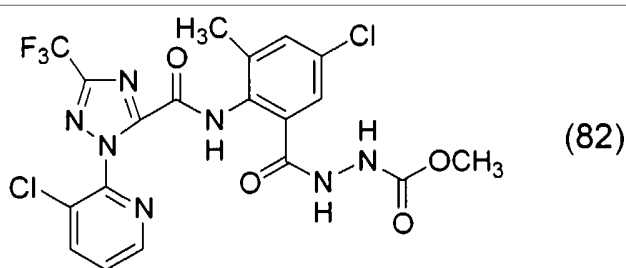
Exemplo de Preparação 82

A uma mistura de 0,25 g de 3-cloro-2-(3-trifluorometil-1H-1,2,4-triazol-1-il)piridina e 5 mL de tetra-hidrofurano foram adicionados, gota a gota, 0,50 mL de um solução de diisopropilamida de lítio 2,0 M em heptano/tetra-hidrofurano/etilbenzeno a -78 °C e a mistura foi agitada a -78 °C durante 15 minutos. Foi introduzido dióxido de carbono na mistura a uma velocidade tal que a temperatura interna foi mantida a -60 °C ou menos e, depois da mistura ficar amarela, a mistura foi ainda agitada a -78 °C durante 10 minutos. A temperatura da mistura reaccional foi aumentada até à temperatura ambiente, seguida de concentração. Foi adicionado uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N para ajustar o pH da camada aquosa a 10 a 12, as camadas foram separadas e a camada orgânica foi extraída com uma solução aquosa de hidróxido de sódio 0,5 N. As camadas aquosas foram combinadas e lavadas com clorofórmio, e foi adicionado ácido clorídrico 2 N para que o pH da camada aquosa ficasse a cerca de 3, seguido de extracção três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,13 g de ácido 1-(3-cloro-2-

piridinil)-3-trifluorometil-1H-1,2,4-triazole-5-carboxílico em bruto da fórmula:



Uma mistura de 0,13 g do ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-1,2,4-triazole-5-carboxílico em bruto resultante e 0,10 mL de cloreto de tionilo foi aquecida sob refluxo em 10 mL de acetonitrilo durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e concentrada sob pressão reduzida, o resíduo resultante foi dissolvido em 10 mL de acetonitrilo, foram adicionados 0,11 g de N-(2-amino-5-cloro-3-metilbenzoil)-N'-metoxycarbonil-hidrazina e 0,10 mL de diisopropiletilamina, e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 16 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 12 mg do presente composto (82) da fórmula:

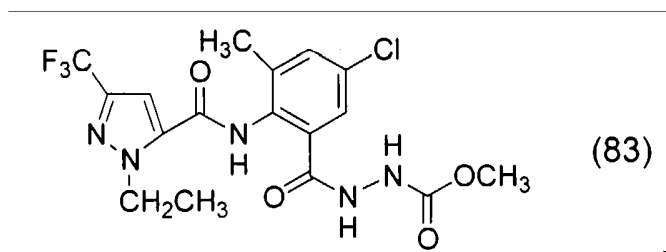


O presente composto (82)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,31 (3H, s), 3,64 (3H, s), 7,40 (1H, s), 7,60 (1H, s), 7,90 (1H, sl), 8,77 (1H, d, $J=7$ Hz), 9,33 (1H, sl), 9,50 (1H, sl), 10,27 (1H, sl), 10,44 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 83

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-etil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (83) da fórmula:

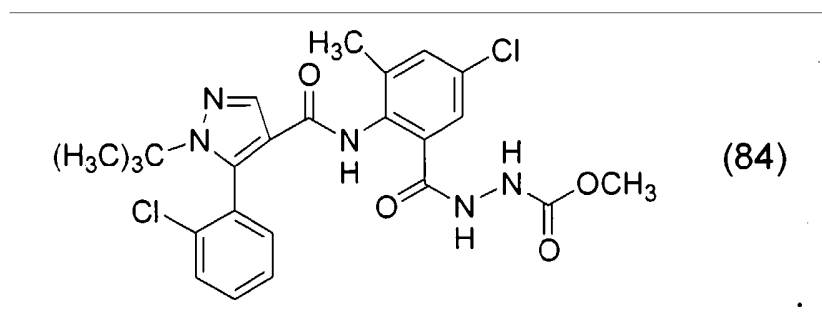


O presente composto (83)

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 1,37 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,26 (3H, s), 3,60 (3H, s), 4,55 (2H, q, $J=7$ Hz), 7,41 (2H, s), 7,58 (1H, s), 9,26 (1H, sl), 10,12 (1H, sl), 10,18 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 84

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 76, excepto que foi utilizada 1-terc-butil-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-5-(2-clorofenil)-1H-pirazole-4-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxamida para obter o presente composto (84) da fórmula:

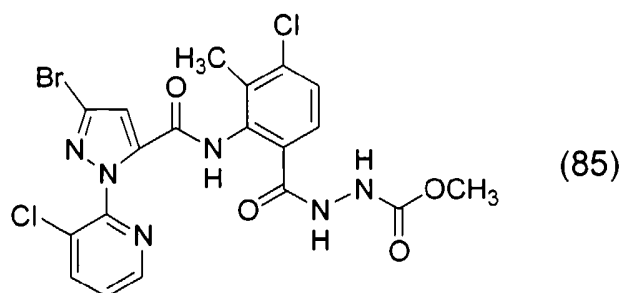


O presente composto (84)

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 1,39 (9H, s), 2,05 (3H, s), 3,47-3,62 (3H, m), 7,36-7,53 (6H, m), 8,10 (1H, s), 9,19-9,26 (2H, m), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 85

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-7-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (85) da fórmula:

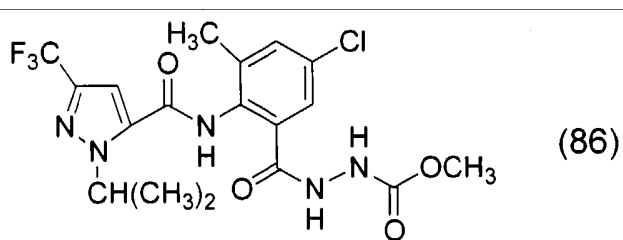


O presente composto (85)

RMN de ¹H (DMSO-d₆, TMS) δ (ppm): 2,17 (3H, s), 3,60-3,65 (3H, m), 7,35-7,43 (2H, m), 7,54 (1H, d, J=8 Hz), 7,61 (1H, dd, J=8 Hz, 4 Hz), 8,17 (1H, d, J=8 Hz), 8,50 (1H, d, J=4 Hz), 9,28 (1H, sl), 10,14 (1H, sl), 10,41 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 86

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-isopropil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (86) da fórmula:

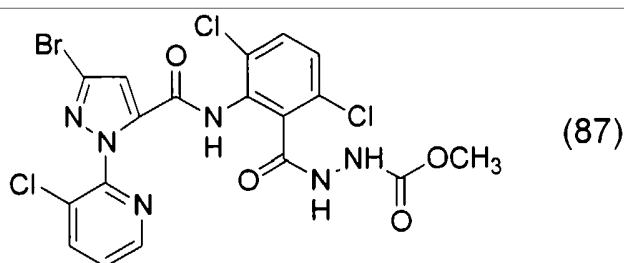


O presente composto (86)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 1,43 (6H, d, $J=6$ Hz), 2,26 (3H, s), 3,60 (3H, s), 5,41-5,45 (1H, m), 7,35 (1H, s), 7,40 (1H, s), 7,59 (1H, s), 9,26 (1H, sl), 10,10 (1H, sl), 10,17 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 87

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-5,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (87) da fórmula:

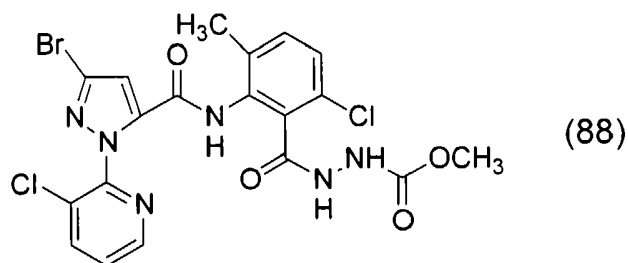


O presente composto (87)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 3,50-3,68 (3H, m), 7,47 (1H, s), 7,52-7,65 (3H, m), 8,17 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,43 (1H, sl), 10,17 (1H, sl), 10,47 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 88

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-5-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (88) da fórmula:



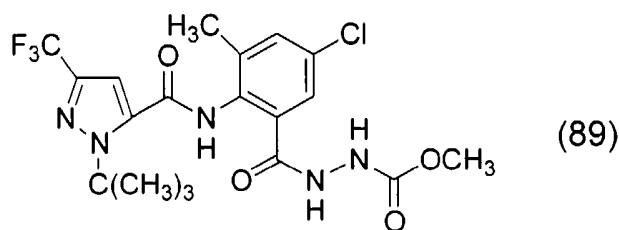
O presente composto (88)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,09 (3H, s), 3,51-3,68 (3H, m), 7,31-7,45 (3H, m), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,19 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,43 (1H, sl), 10,04 (1H, sl), 10,13 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 89

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-terc-butil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-

pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (89) da fórmula:

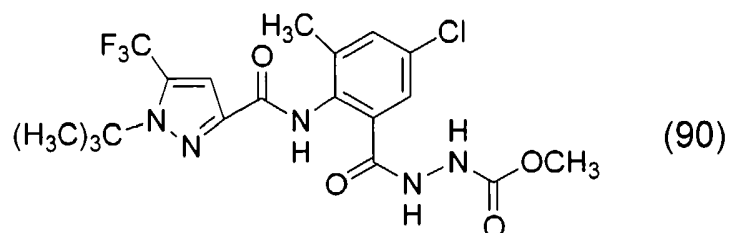


O presente composto (89)

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 1,67 (9H, s), 2,28 (3H, s), 3,64 (3H, s), 7,11 (1H, s), 7,42 (1H, s), 7,55 (1H, s), 9,29 (1H, sl), 10,18 (1H, sl), 10,23 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 90

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, excepto que foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-terc-butil-5-trifluorometil-1H-pirazole-3-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (90) da fórmula:

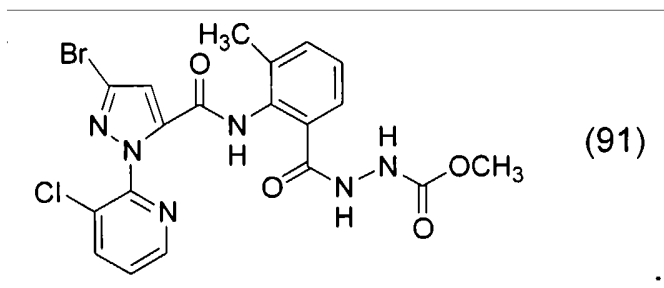


O presente composto (90)

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 1,69 (9H, s), 2,26 (3H, s), 3,57 (3H, s), 7,43 (1H, s), 7,62 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,82 (1H, d, $J=2$ Hz), 9,30 (1H, sl), 10,23 (1H, sl), 10,56 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 91

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (91) da fórmula:

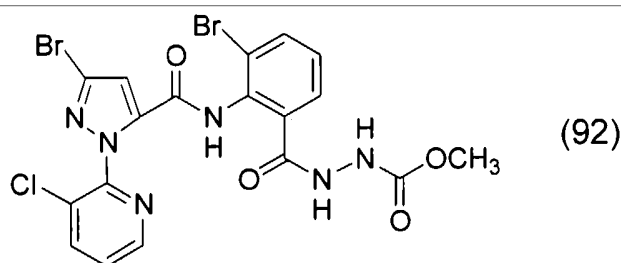


O presente composto (91)

RMN de ^1H (DMSO-d_6 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,55-3,67 (3H, m), 7,25-7,45 (3H, m), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,94-7,97 (1H, m), 8,17 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,48-8,53 (1H, m), 9,25 (1H, sl), 10,04 (1H, sl), 10,20 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 92

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 8-bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (92) da fórmula:



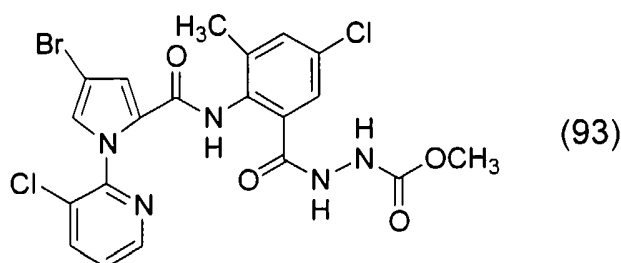
O presente composto (92)

RMN de ^1H (DMSO-d_6 , TMS) δ (ppm): 3,45-3,67 (3H, m), 7,34-7,44 (2H, m), 7,53 (1H, s), 7,60 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,84 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,15 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,29 (1H, sl), 10,08 (1H, sl), 10,42 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 93

Uma mistura de 0,20 g de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida, 0,05 g de cloroformato de metilo e 0,07 mL de piridina em N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 8 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por

filtração para obter 0,16 g do presente composto (93) da fórmula:



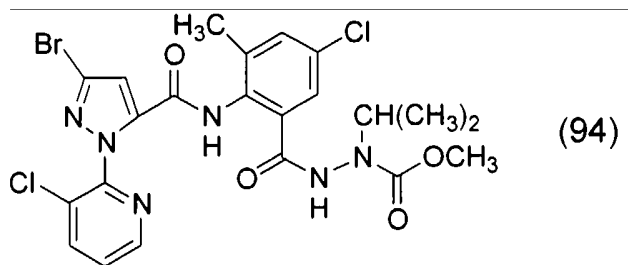
O presente composto (93)

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 3,63 (3H, s), 7,23 (1H, s), 7,41 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,48-7,51 (3H, m), 8,05 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,43 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz) 9,31 (1H, sl), 9,75 (1H, sl), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 94

Uma mistura de 0,26 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N'-isopropil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,06 mL de cloroformato de metilo e 2 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 1,5 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter t-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com ácido clorídrico 1 N, uma solução aquosa saturada de bicarbonato de sódio e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em

coluna sobre sílica gel para obter 0,18 g do presente composto (94) da fórmula:



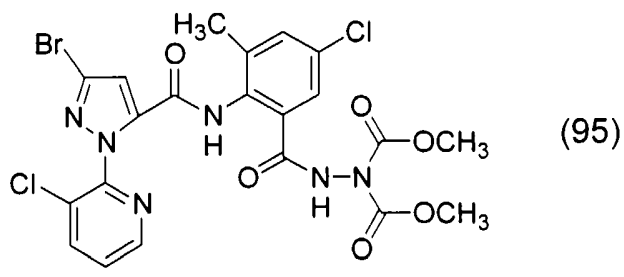
O presente composto (94)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , 80 °C) δ (ppm): 1,03 (6H, d, $J=7$ Hz), 2,18 (3H, s), 3,53 (3H, s), 4,24 (1H, hept., $J=7$ Hz), 7,29 (1H, s), 7,37 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,49 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,57 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,10 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,45 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,92 (1H, s), 9,98 (1H, s)

Exemplo de Preparação 95

A uma mistura de 4,11 g do presente composto (34), 1,45 mL de trietilamina e 80 mL de tetra-hidrofurano foram adicionados, gota a gota, 0,69 mL de cloroformato de metilo sob arrefecimento com gelo. Depois da mistura resultante ter sido agitada à temperatura ambiente durante 1 hora, foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna

sobre sílica gel para obter 2,66 g do presente composto (95) da fórmula:

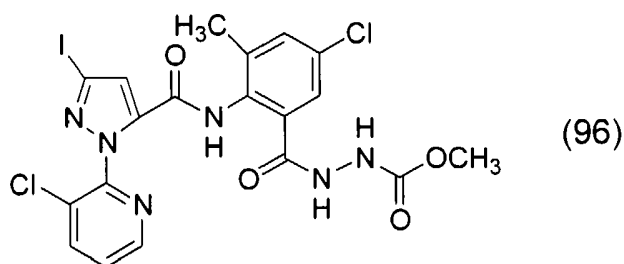


O presente composto (95)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 3,82 (6H, s), 6,99 (1H, s), 7,34-7,37 (2H, m), 7,41 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,88 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,37 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 8,43 (1H, s), 9,21 (1H, s)

Exemplo de Preparação 96

Uma mistura de 0,11 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-iodo-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,095 mL de cloroformato de metilo e 2 mL de piridina foram misturados e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 2,75 horas. Foram vertidos água e tolueno para a mistura reaccional, seguidos de concentração sob pressão reduzida. O resíduo foi distribuído entre água e acetato de etilo e a camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,11 g do presente composto (96) da fórmula:

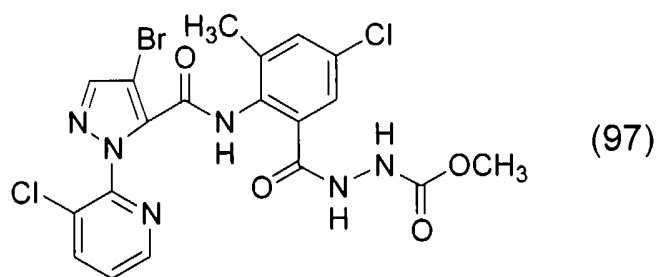


O presente composto (96)

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,63 (3H, sl), 7,40 (2H, sl), 7,54 (1H, s), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,15 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,31 (1H, sl), 10,16 (2H, sl)

Exemplo de Preparação 97

Uma mistura de 0,27 g de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,13 mL de cloroformato de metilo e 3 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 1,75 horas. Foram vertidos água e tolueno para a mistura reaccional, seguidos de concentração sob pressão reduzida. O resíduo foi distribuído entre água e acetato de etilo e a camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,24 g do presente composto (97) da fórmula:



O presente composto (97)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, $80\text{ }^\circ\text{C}$) δ (ppm): 2,14 (3H, s), 3,59 (3H, sl), 7,43 (1H, s), 7,48 (1H, s), 7,57 (1H, dd, $J=8\text{ Hz}$, 4 Hz), 8,03 (1H, s), 8,12 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$), 8,47 (1H, d, $J=4\text{ Hz}$), 8,94 (1H, sl), 9,81 (1H, sl), 10,11 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 98

Uma mistura de 0,30 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-fenil-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,15 mL de cloroformato de metilo e 3 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 1,75 horas. Foram vertidos água e tolueno para a mistura reaccional, seguidos de concentração sob pressão reduzida. O resíduo foi distribuído entre água e acetato de etilo e a camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,30 g do presente composto (98) da fórmula:

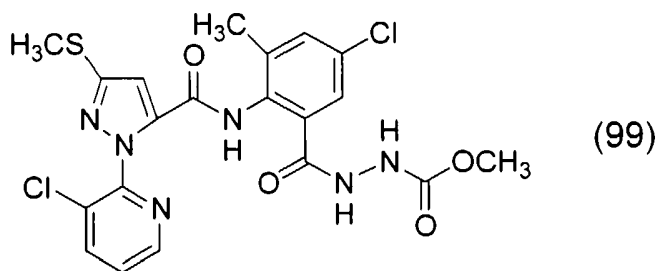


•

•

•

Uma mistura de 0,27 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metiltio-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,14 mL de cloroformato de metilo e 3 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foram vertidos água e tolueno para a mistura reaccional, seguida de concentração sob pressão reduzida. O resíduo foi distribuído entre água e acetato de etilo, e a camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,14 g do presente composto (99) da fórmula:

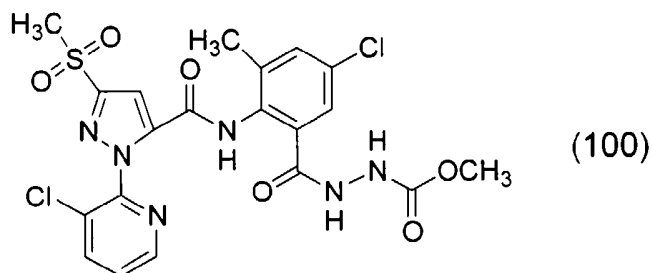


O presente composto (99)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 2,54 (3H, s) 3,62 (3H, sl), 7,20 (1H, s), 7,38 (1H, sl), 7,54-7,58 (2H, m), 8,13 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,48 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1,5 Hz), 9,32 (1H, sl), 10,11 (1H, s), 10,14 (1H, s)

Exemplo de Preparação 100

Uma mistura de 0,20 g de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metilsulfonil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,40 g de carbazato de metilo e 8 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 22 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional, a mistura foi extraída três vezes com éter t-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,13 g do presente composto (100) da fórmula:

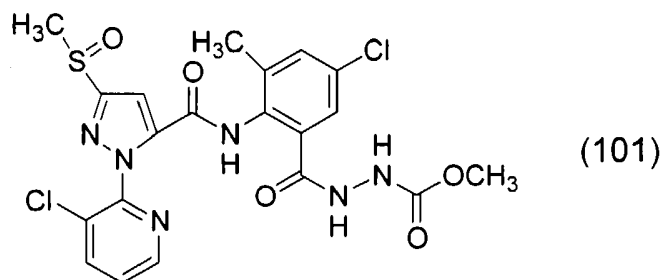


O presente composto (100)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 3,39 (3H, s) 3,62 (3H, sl), 7,39 (1H, sl), 7,56 (1H, s), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,78 (1H, s), 8,23 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,54 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,31 (1H, sl), 10,16 (1H, sl), 10,41 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 101

Uma mistura de 0,10 g de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metilsulfinil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,21 g de carbazato de metilo e 4 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 20 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter t-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,092 g do presente composto (101) da fórmula:

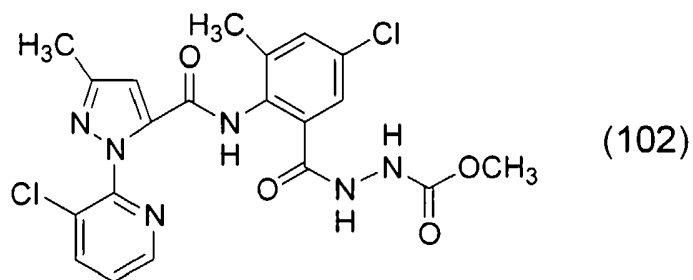


O presente composto (101)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 2,99 (3H, s) 3,62 (3H, sl), 7,39 (1H, sl), 7,55 (1H, s), 7,64 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,74 (1H, s), 8,20 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1,5 Hz), 8,52 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,32 (1H, sl), 10,15 (1H, sl), 10,35 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 102

Uma mistura de 0,12 g de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,27 g de carbazato de metilo e 4 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 24 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter t-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,10 g do presente composto (102) da fórmula:

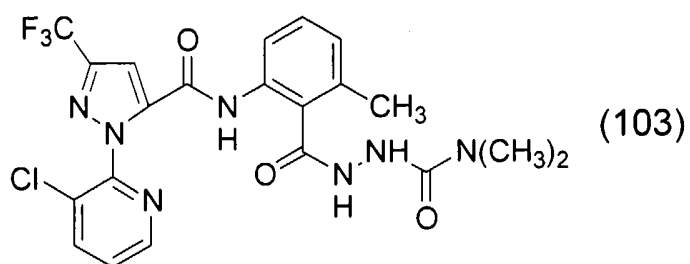


O presente composto (102)

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 2,31 (3H, s) 3,62 (3H, sl), 7,02 (1H, s), 7,40 (1H, sl), 7,52-7,55 (2H, m), 8,11 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,46 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,31 (1H, sl), 10,03 (1H, sl), 10,14 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 103

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, excepto que foi utilizada N-[2-(hidrazinocarbonil)-3-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (103) da fórmula:

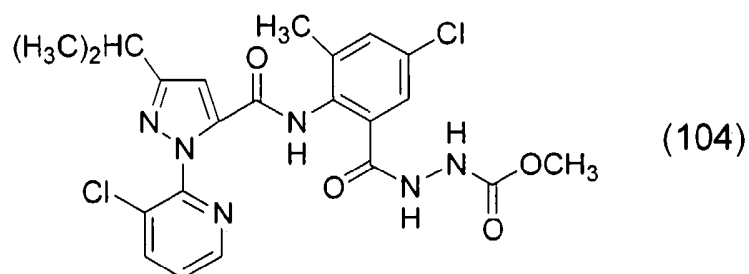


O presente composto (103)

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,29 (3H, s), 2,93 (6H, s), 7,07 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,27 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,71 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,86 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,11 (1H, s), 8,28 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,56 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,99 (1H, sl), 10,10 (1H, sl), 10,19 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 104

Uma mistura de 0,20 g de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,43 g de carbazato de metilo e 5 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 20 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter t-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,22 g do presente composto (104) da fórmula:

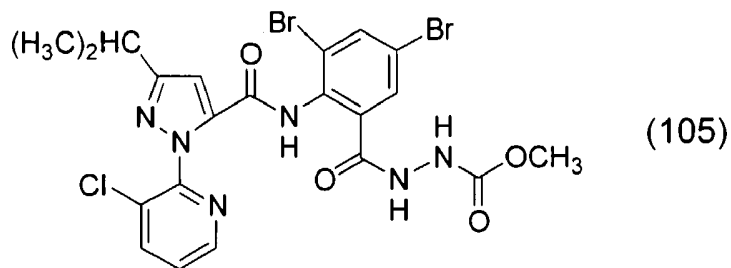


O presente composto (104)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 1,35 (6H, d, $J=7$ Hz), 2,22 (3H, s), 3,08 (1H, hept., $J=7$ Hz), 3,68 (3H, sl), 7,17 (1H, s), 7,45 (1H, sl), 7,58-7,62 (2H, m), 8,17 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,52 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,39 (1H, sl), 10,09 (1H, sl), 10,20 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 105

Uma mistura de 0,20 g de 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,34 g de carbazato de metilo e 4 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 17 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter t-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,16 g do presente composto (105) da fórmula:

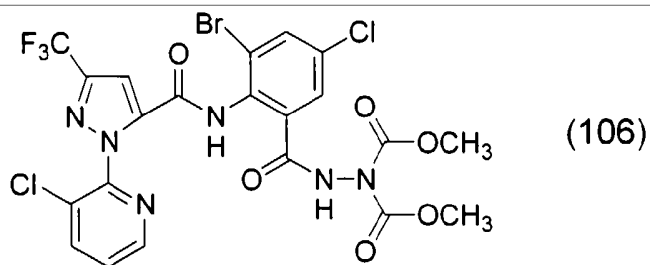


O presente composto (105)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 1,27 (6H, d, $J=7$ Hz), 3,01 (1H, hept., $J=7$ Hz), 3,60 (3H, sl), 7,16 (1H, s), 7,53 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,64 (1H, sl), 8,07 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,11 (1H, sl), 8,45 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,35 (1H, sl), 10,16 (1H, sl), 10,22 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 106

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 95, excepto que foi utilizado o presente composto (59) em vez do presente composto (34) para obter o presente composto (106) da fórmula:

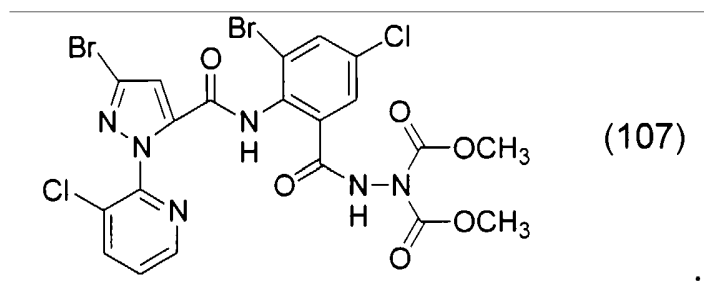


O presente composto (106)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,73 (6H, s), 7,38-7,45 (3H, m), 7,64 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,89 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,37 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,67 (1H, sl), 9,21 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 107

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 95, excepto que foi utilizado o presente composto (70) em vez do presente composto (34) para obter o presente composto (107) da fórmula:

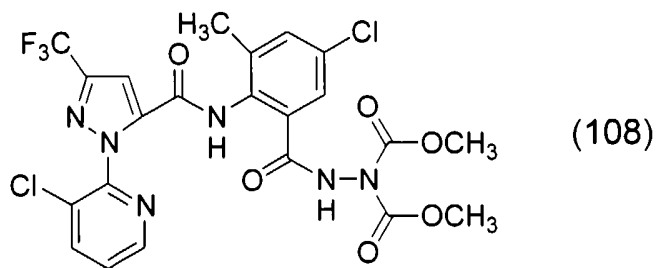


O presente composto (107)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,77 (6H, s), 7,09 (1H, s), 7,36 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,51 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,69 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,88 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,35 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 8,63 (1H, sl), 8,95 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 108

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 95, excepto que foi utilizado o presente composto (5) em vez do presente composto (34) para obter o presente composto (108) da fórmula:

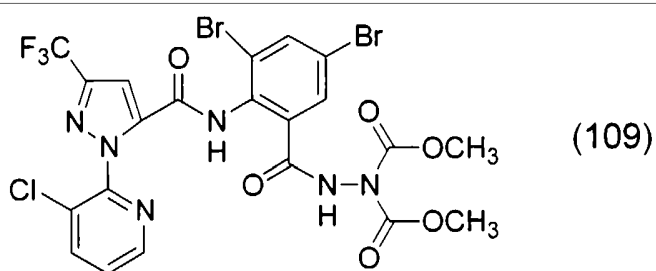


O presente composto (108)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,23 (3H, s), 3,81 (6H, s), 7,24 (1H, s), 7,36 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,39-7,42 (2H, m), 7,91 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,28 (1H, s), 8,40 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,27 (1H, s).

Exemplo de Preparação 109

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 95, excepto que foi utilizado o presente composto (49) em vez do presente composto (34) para obter o presente composto (109) da fórmula:

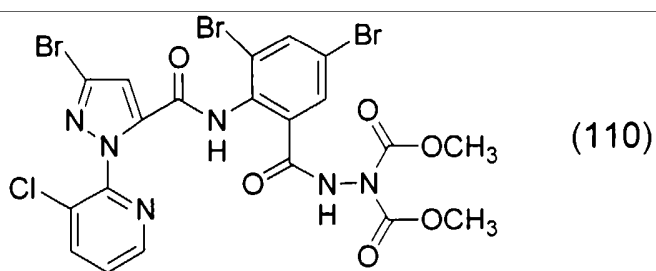


O presente composto (109)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,75 (6H, s), 7,37-7,43 (2H, m), 7,63 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,84 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,90 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,38 (1H, dd, $J=4$ Hz, $J=1$ Hz), 8,57 (1H, sl), 9,17 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 110

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 95, excepto que foi utilizado o presente composto (68) em vez do presente composto (34) para obter o presente composto (110) da fórmula:

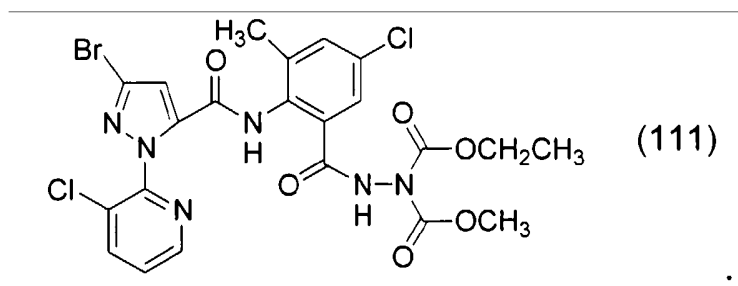


O presente composto (110)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,78 (6H, s), 7,08 (1H, s), 7,37 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,67 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,87-7,90 (2H, m), 8,35 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 8,54 (1H, sl), 8,88 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 111

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 95, excepto que foi utilizado cloroformato de etilo em vez de cloroformato de metilo para obter o presente composto (111) da fórmula:



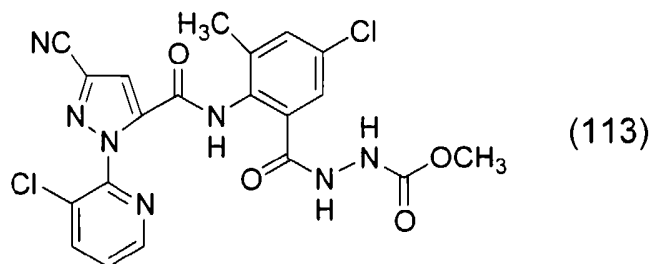
O presente composto (111)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,30 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,24 (3H, s), 3,82 (3H, s), 4,30 (2H, q, $J=7$ Hz), 6,97 (1H, s), 7,34-7,38 (2H, m), 7,45 (1H, s), 7,88 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,27 (1H, s), 8,38 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,21 (1H, s).

Exemplo de Preparação 112

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 95, excepto que foi utilizado cloroformato de isobutilo em vez de cloroformato de metilo para obter o presente composto (112) da fórmula:



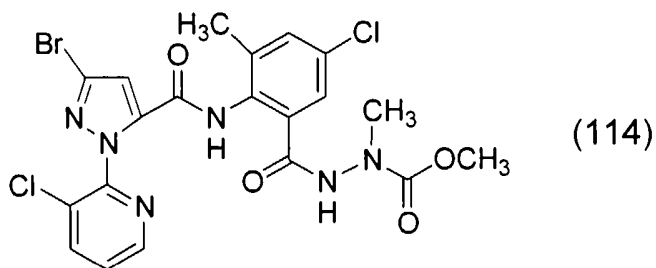


O presente composto (113)

RMN de ¹H (DMSO-d₆) δ (ppm): 2,14 (3H, s), 3,61 (3H, sl), 7,38 (1H, sl), 7,54 (1H, s), 7,67 (1H, dd, J=8 Hz, 5 Hz), 7,81 (1H, s), 8,22 (1H, d, J=8 Hz), 8,53 (1H, d, J=5 Hz), 9,29 (1H, sl), 10,16 (1H, sl), 10,44 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 114

Uma mistura de 0,30 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,69 g de N-metil-N-metoxycarbonil-hidrazina e 15 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada a 60 °C durante 9 horas e a 80 °C durante 22 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,036 g do presente composto (114) da fórmula:

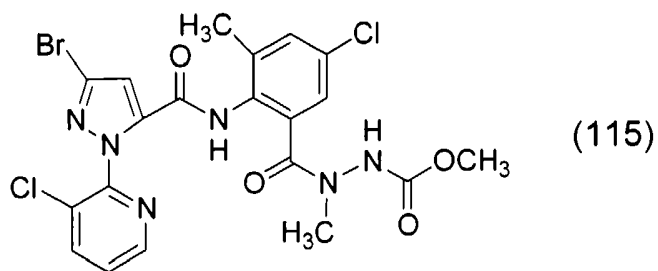


O presente composto (114)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,20 (3H, s), 3,21 (3H, s), 3,74 (3H, sl), 7,05 (1H, s), 7,26-7,38 (3H, m), 7,86 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,03 (1H, s), 8,42 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,47 (1H, s).

Exemplo de Preparação 115

Uma mistura de 0,60 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,41 mL de cloroformato de metilo e 6 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional, seguida de concentração sob pressão reduzida. O resíduo foi distribuído entre água e acetato de etilo, e a camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,46 g do presente composto (115) da fórmula:

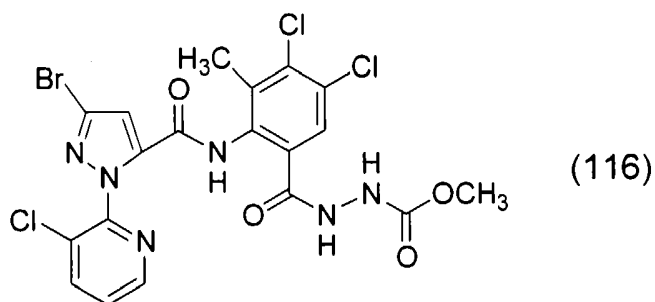


O presente composto (115)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,04 (3H, s), 3,22 (3H, s), 3,57 (2,6H, s), 3,80 (0,4H, s), 7,01 (1H, s), 7,04 (1H, s), 7,28 (1H, s), 7,40 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,61 (1H, sl), 7,87 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,46 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,80 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 116

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,7-dicloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (116) da fórmula:

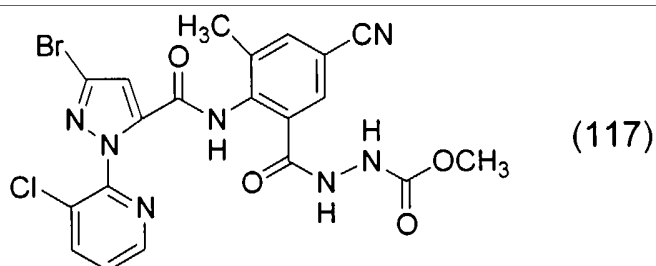


O presente composto (116)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,25 (3H, s), 3,45-3,68 (3H, m), 7,36 (1H, s), 7,57-7,65 (2H, m), 8,18 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,36 (1H, sl), 10,24 (1H, sl), 10,49 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 117

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-6-ciano-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (117) da fórmula:

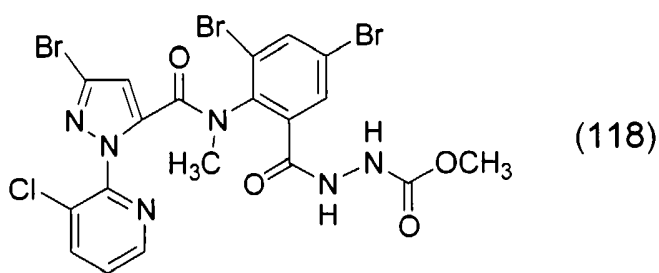


O presente composto (117)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,20 (3H, s), 3,45-3,68 (3H, m), 7,38 (1H, s), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,77 (1H, s), 7,96 (1H, s), 8,17 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,36 (1H, sl), 10,27 (1H, sl), 10,49 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 118

Uma mistura de 0,59 g de ácido 3,5-dibromo-2-{N-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carbonil]-N-metilamino}benzóico, 2 mL de cloreto de tionilo e uma gota de N,N-dimetilformamida foi agitada a 80 °C durante 1 hora. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida, foram ali adicionados 10 mL de hexano e a mistura foi ainda concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante, 10 mL de tetra-hidrofurano, 0,10 g de carbazato de metilo e 1 mL de piridina foram misturados e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. A mistura reaccional foi vertida para 30 mL de água e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,23 g do presente composto (118) da fórmula:



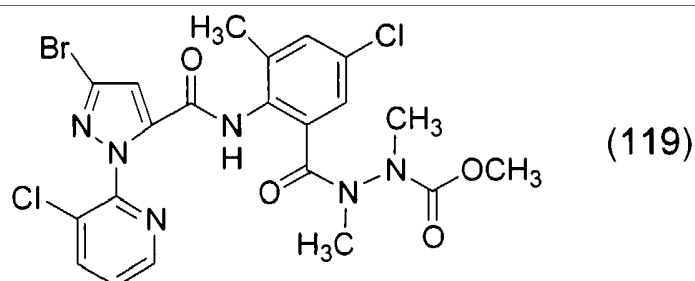
O presente composto (118)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,05 (1,9H, s), 3,38 (1,1H, s), 3,52-3,73 (3H, m), 5,68 (0,7H, sl), 7,11 (0,3H, sl),

7,57-7,81 (2H, m), 8,16-8,32 (2H, m), 8,49-8,55 (1H, m), 9,42 (1H, sl), 10,54 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 119

Uma mistura de 0,30 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,07 mL de cloroformato de metilo e 5 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com um solvente misto de acetato de etilo e hexano para obter 0,09 g do presente composto (119) da fórmula:

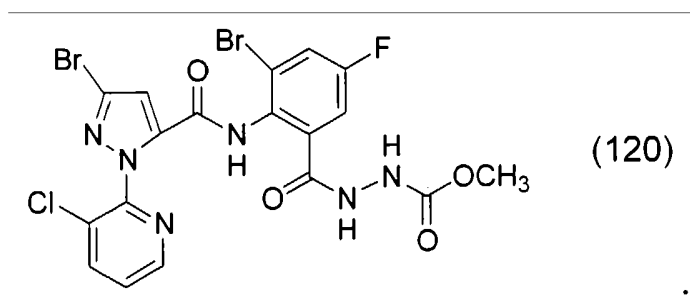


O presente composto (119)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,10-2,24 (3H, m), 2,61-2,87 (3H, m), 2,90-3,18 (3H, m), 3,45-3,74 (3H, m), 7,12-7,30 (1H, m), 7,33-7,44 (1H, m), 7,44-7,58 (1H, m), 7,58-7,66 (1H, m), 8,20 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,47-8,54 (1H, m), 10,10-10,50 (1H, m).

Exemplo de Preparação 120

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-bromo-6-fluoro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (120) da fórmula:

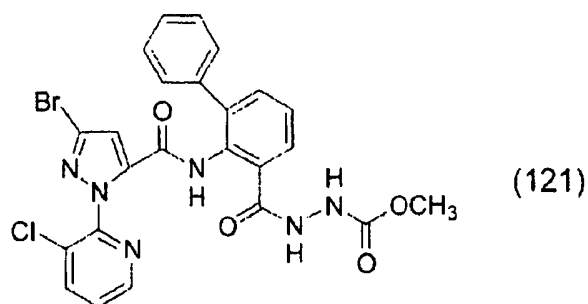


O presente composto (120)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,42-3,69 (3H, m), 7,34 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,41 (1H, s), 7,60 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,89 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,16 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,36 (1H, sl), 10,18 (1H, sl), 10,42 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 121

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, excepto que foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-fenil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (121) da fórmula:

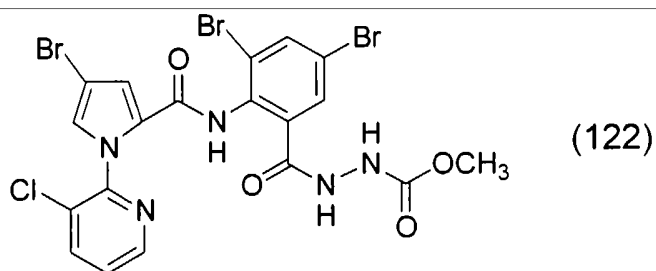


O presente composto (121)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 3,49-3,68 (3H, m), 7,24-7,67 (10H, m), 8,08 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,43 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,29 (1H, sl), 10,08 (1H, sl), 10,19 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 122

Uma mistura de 0,17 g de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,27 g de carbazato de metilo e 20 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 2 dias. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida para obter 0,15 g do presente composto (122) da fórmula:

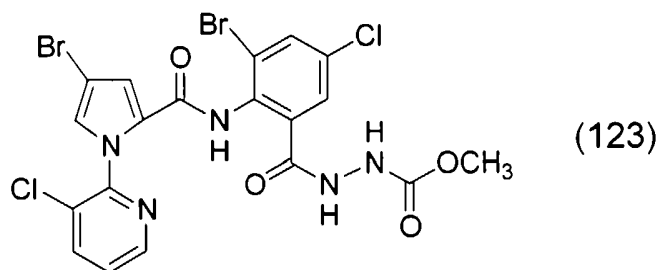


O presente composto (122)

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,67 (3H, s), 7,36 (1H, s), 7,46 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,54 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,70 (1H, s), 8,09 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,13 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,48 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,40 (1H, sl), 9,97 (1H, sl), 10,18 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 123

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 122, excepto que foi utilizada 8-bromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (123) da fórmula:

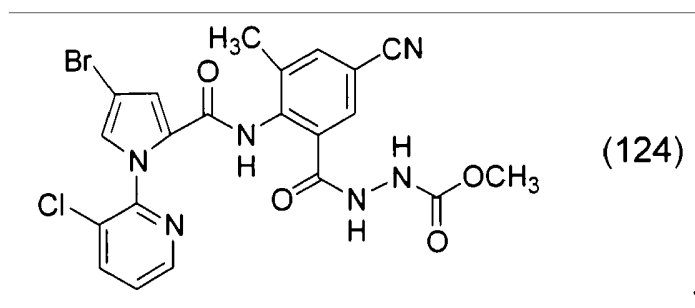


O presente composto (123)

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,62 (3H, s), 7,30 (1H, s), 7,39 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,48 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,52 (1H, s), 7,96 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,03 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,42 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,35 (1H, sl), 9,92 (1H, sl), 10,11 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 124

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 122, excepto que foi utilizada 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-ciano-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (124) da fórmula:

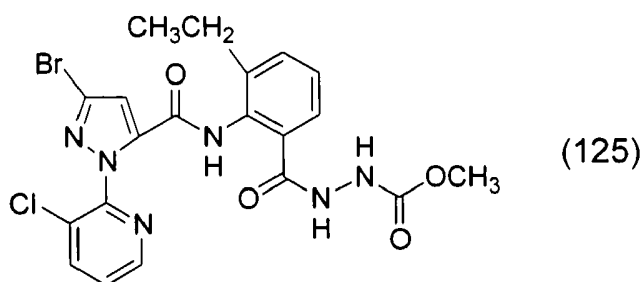


O presente composto (124)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,21 (3H, s), 3,64 (3H, s), 7,25 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,41 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,49 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,77 (1H, s), 7,88 (1H, s), 8,04 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,43 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,36 (1H, sl), 10,05 (1H, sl), 10,27 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 125

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-etil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (125) da fórmula:

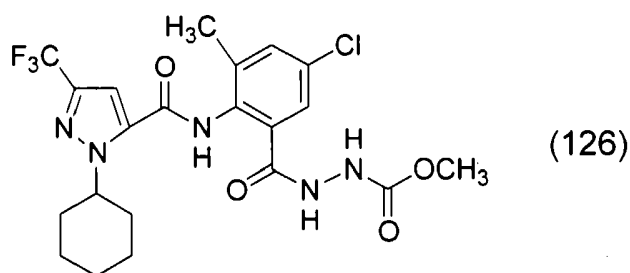


O presente composto (125)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,06-1,13 (3H, m), 2,45-2,60 (2H, m), 3,55-3,70 (3H, m), 7,25-7,47 (4H, m), 7,57-7,63 (1H, m), 8,14-8,19 (1H, m), 8,46-8,53 (1H, m), 9,24 (1H, sl), 9,98 (1H, sl), 10,16 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 126

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (126) da fórmula:

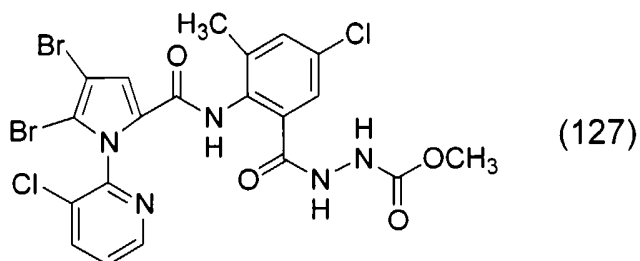


O presente composto (126)

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 1,20-1,41 (3H, m), 1,67-1,80 (5H, m), 1,98-2,00 (2H, m), 2,25 (3H, s), 3,56 (3H, s), 5,00-5,08 (1H, m), 7,33 (1H, s), 7,40 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,55 (1H, d, $J=2$ Hz), 9,02 (1H, sl), 9,94 (1H, sl), 10,04 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 127

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 4,5-dibromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (127) da fórmula:

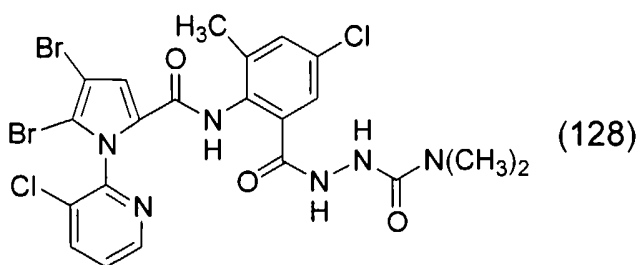


O presente composto (127)

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,09 (3H, s), 3,63 (3H, s), 7,36 (1H, s), 7,42 (1H, s), 7,49 (1H, s), 7,57 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,14 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,29 (1H, sl), 9,79 (1H, sl), 10,12 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 128

Uma mistura de 0,20 g de 4,5-dibromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida, 0,04 g de cloreto de N,N-dimetilcarbamoílo e 0,08 mL de piridina em N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 14 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,16 g do presente composto (128) da fórmula:

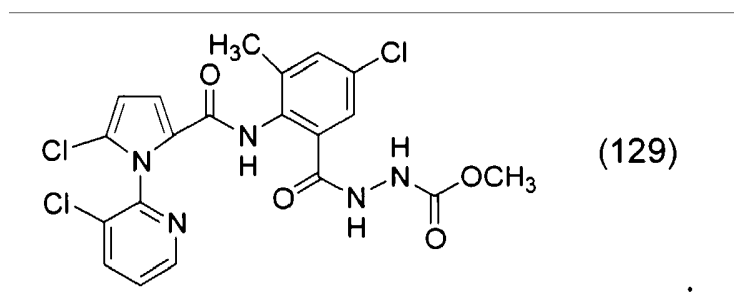


O presente composto (128)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,08 (3H, s), 2,88 (6H, s), 7,40 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,44 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,52 (1H, s), 7,58 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,14 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,50 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 8,56 (1H, sl), 9,75 (1H, sl), 9,81 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 129

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 122, foi utilizada 2-[5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (129) da fórmula:



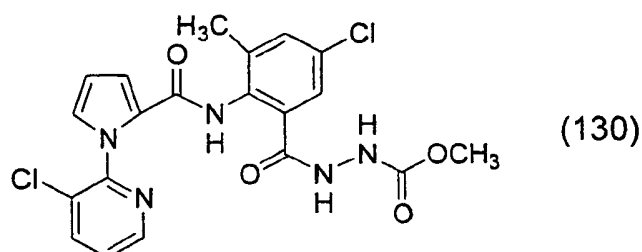
O presente composto (129)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,11 (3H, s), 3,63 (3H, s), 6,48 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,24 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,48 (1H, s), 7,55 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,95 (1H, s), 8,12 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,49 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,31 (1H, sl), 9,74 (1H, sl), 10,13 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 130

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-

(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (130) da fórmula:

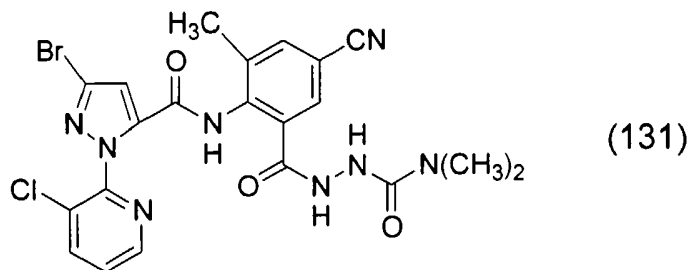


O presente composto (130)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 3,61 (3H, s), 6,37 (1H, d, $J=3$ Hz), 7,12-7,18 (2H, m), 7,40 (1H, s), 7,45-7,50 (2H, m), 8,03 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,42 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,33 (1H, sl), 9,71 (1H, sl), 10,14 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 131

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, foi utilizada 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (131) da fórmula:

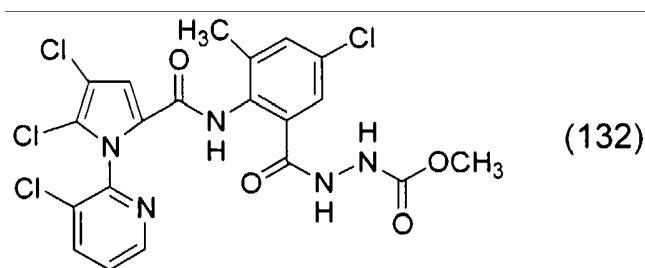


O presente composto (131)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 2,88 (6H, s), 7,49 (1H, s), 7,62 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,82 (1H, s), 7,93 (1H, s), 8,19 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,50 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 8,63 (1H, sl), 9,93 (1H, sl), 10,42 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 132

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 4,5-dicloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (132) da fórmula:

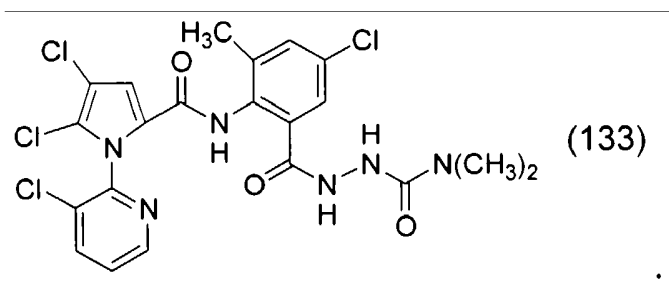


O presente composto (132)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,10 (3H, s), 3,63 (3H, s), 7,39 (2H, s), 7,49 (1H, s), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,15 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,30 (1H, sl), 9,82 (1H, sl), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 133

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 128, foi utilizada 4,5-dicloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4,5-dibromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (133) da fórmula:

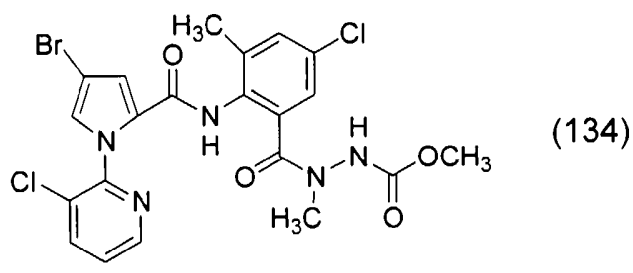


O presente composto (133)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,10 (3H, s), 2,53 (6H, s), 7,37-7,39 (2H, m), 7,51 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,17 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,52 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,31 (1H, sl), 9,82 (1H, sl), 10,13 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 134

Uma mistura de 0,50 g de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida, 0,11 g de cloroformato de metilo, 0,18 mL de piridina e 5 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. A mistura reaccional foi vertida para água e extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,09 g do presente composto (134) da fórmula:

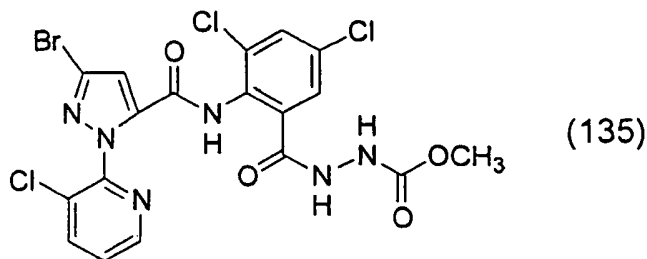


O presente composto (134)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,05-2,12 (3H, m), 3,21 (3H, s), 3,54-3,76 (3H, m), 7,02 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,06 (2H, s), 7,29 (1H, sl), 7,33 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,80-7,86 (2H, m), 8,40 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 8,99 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 135

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (135) da fórmula:



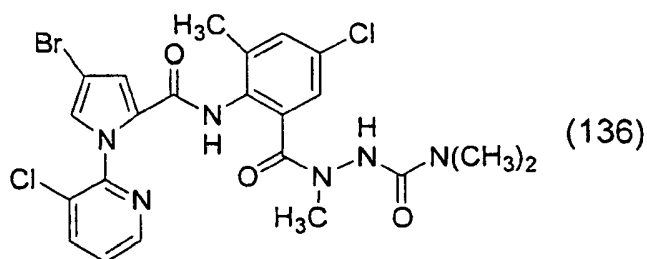
O presente composto (135)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,47-3,62 (3H, m), 7,40 (1H, s), 7,51 (1H, s), 7,60 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,93 (1H, s), 8,16 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,50 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,37 (1H, sl), 10,24 (1H, sl), 10,48 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 136

Uma mistura de 0,25 g de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida, 0,06 g de cloreto de N,N-dimetilcarbamoílo, 0,09 mL de piridina e 5 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada a 70 °C durante 8 horas. A mistura reaccional foi vertida para água e um precipitado

depositado foi recolhido por filtração. O sólido resultante foi lavado com acetonitrilo para obter 0,10 g do presente composto (136) da fórmula:

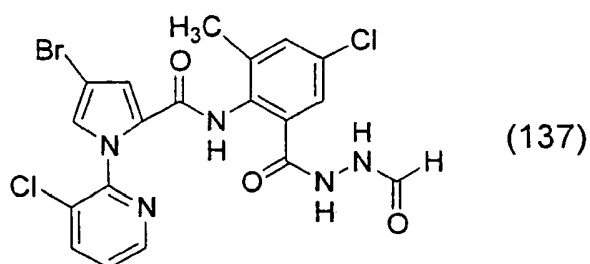


O presente composto (136)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,11 (3H, s), 2,65-2,85 (6H, m), 3,19-3,29 (3H, m), 7,07 (1H, s), 7,14 (1H, s), 7,28 (1H, s), 7,40 (1H, s), 7,50 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,60 (1H, sl), 8,06 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,43 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,86 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 137

Sob arrefecimento com gelo, foram misturados 0,50 g de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida, 4 mL de ácido fórmico e 2 mL de anidrido acético. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. A mistura reaccional foi vertida para água e extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi lavado com acetonitrilo para obter 0,20 g do presente composto (137) da fórmula:

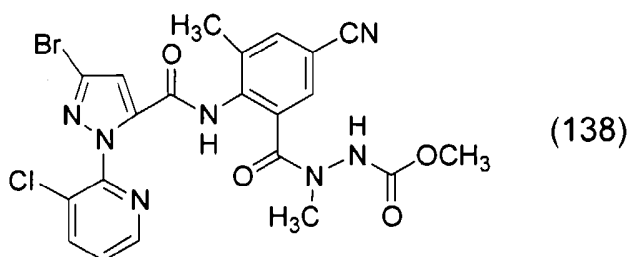


O presente composto (137)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 7,23 (1H, s), 7,42-7,44 (2H, m), 7,48-7,52 (2H, m), 8,05 (1H, d, $J=7$ Hz), 8,43 (1H, d, $J=3$ Hz), 8,98 (1H, s), 9,76 (1H, s), 9,96 (1H, sl), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 138

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 115, foi utilizada 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (138) da fórmula:

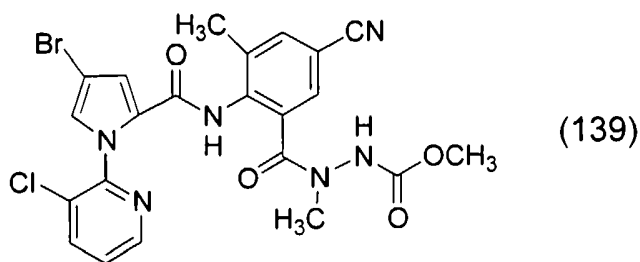


O presente composto (138)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,21 (3H, s), 3,08 (3H, s), 3,45-3,70 (3H, m), 7,30-7,43 (1H, m), 7,44-7,61 (1H, m), 7,63 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,82-7,94 (1H, m), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,21 (1H, sl), 10,24 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 139

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 134, foi utilizada 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (139) da fórmula:



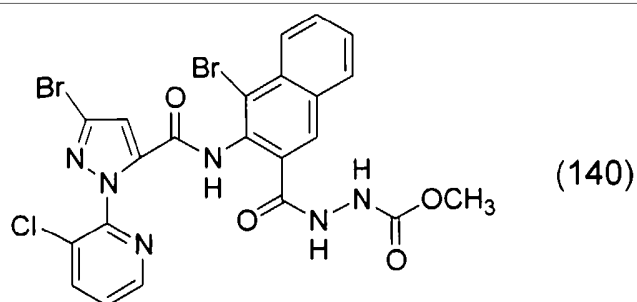
O presente composto (139)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,21 (3H, s), 3,08 (3H, s), 3,47-3,70 (3H, m), 7,18-7,30 (1H, m), 7,41-7,50 (1H, m), 7,51-7,56 (2H, m), 7,80-7,90 (1H, m), 8,12 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1

Hz), 8,45 (1H, dd, J=5 Hz, 1 Hz), 9,10 (1H, sl), 9,73 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 140

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 66, foi utilizada 3-bromo-N-[1-bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[1-cloro-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (140) da fórmula:



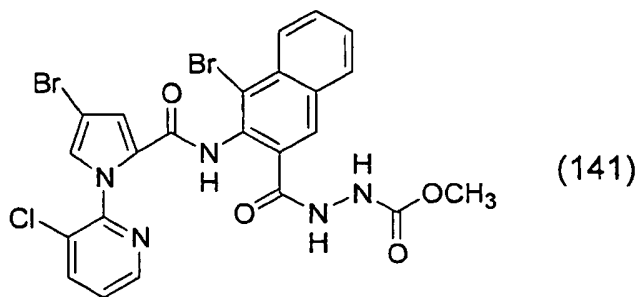
O presente composto (140)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,42-3,71 (3H, m), 7,48 (1H, s), 7,58 (1H, dd, J=8 Hz, 5 Hz), 7,72 (1H, t, J=7 Hz), 7,81 (1H, t, J=7 Hz), 8,10-8,21 (3H, m), 8,24 (1H, d, J=8 Hz), 8,50 (1H, d, J=5 Hz), 9,34 (1H, sl), 10,26 (1H, sl), 10,64 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 141

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 66, foi utilizada 4-bromo-N-[1-bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-

naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de N-[1-cloro-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (141) da fórmula:

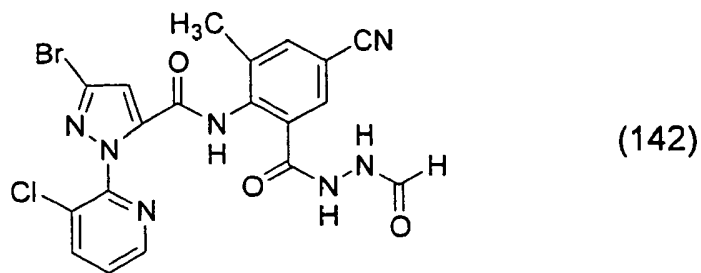


O presente composto (141)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 3,43-3,70 (3H, m), 7,37 (1H, s), 7,42-7,52 (2H, m), 7,70 (1H, t, $J=7$ Hz), 7,79 (1H, t, $J=7$ Hz), 8,03 (1H, d, $J=7$ Hz), 8,06-8,20 (2H, m), 8,23 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,43 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,34 (1H, sl), 10,09 (1H, sl), 10,19 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 142

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 17, foi utilizada 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (142) da fórmula:

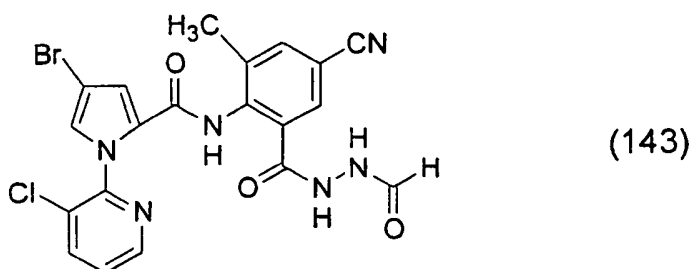


O presente composto (142)

RMN de ^1H (DMSO-d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16-2,34 (3H, m), 7,35-7,45 (1H, m), 7,57-7,66 (1H, m), 7,76-7,88 (1H, m), 7,93-8,02 (1H, m), 8,03-8,12 (1H, m), 8,17 (1H, d, $J=7$ Hz), 8,50 (1H, sl), 9,55-10,03 (1H, m), 10,17-10,58 (2H, m)

Exemplo de Preparação 143

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 17, foi utilizada 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (143) da fórmula:

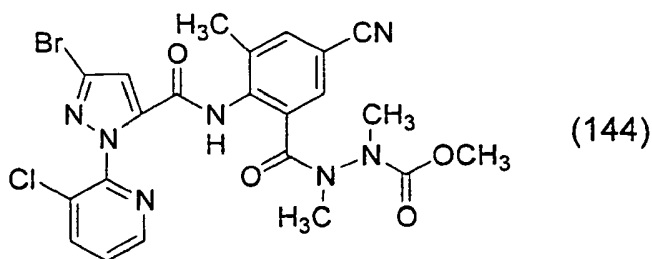


O presente composto (143)

RMN de ^1H (DMSO-d_6 , TMS) δ (ppm): 2,17-2,30 (3H, m), 7,24-7,36 (1H, m), 7,45-7,55 (2H, m), 7,74-7,82 (1H, m), 7,88-7,95 (1H, m), 8,03-8,09 (2H, m), 8,44 (1H, d, $J=5$ Hz), 10,02 (1H, sl), 10,21 (1H, sl), 10,46 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 144

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 119, foi utilizada 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (144) da fórmula:

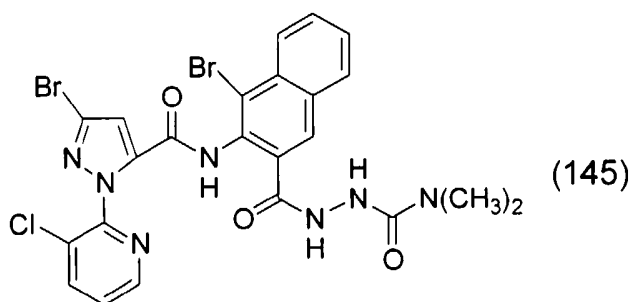


O presente composto (144)

RMN de ^1H (DMSO-d_6 , TMS) δ (ppm): 2,14-2,29 (3H, m), 2,64-2,87 (3H, m), 2,87-3,15 (3H, m), 3,42-3,73 (3H, m), 7,30-7,45 (1H, m), 7,54-7,81 (2H, m), 7,83-8,01 (1H, m), 8,15-8,24 (1H, m), 8,50 (1H, sl), 10,20-10,68 (1H, m)

Exemplo de Preparação 145

Uma mistura de 0,25 g de 3-bromo-N-[1-bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,22 g de cloreto de N,N-dimetilcarbamoílo, 4 mL de acetonitrilo e 1 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas e deixada em repouso à temperatura ambiente, de um dia para o outro. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,20 g do presente composto (145) da fórmula:

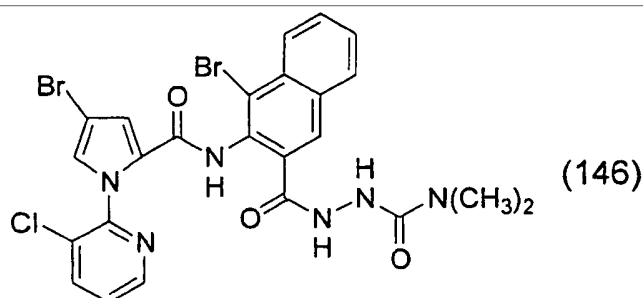


O presente composto (145)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,88 (6H, s), 7,54 (1H, s), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,72 (1H, t, $J=7$ Hz), 7,79 (1H, t, $J=7$ Hz), 8,09 (1H, d, $J=7$ Hz), 8,15 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,19-8,26 (2H, m), 8,50 (1H, dd, $J=5,1$ Hz), 8,54 (1H, sl), 9,90 (1H, sl), 10,57 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 146

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 145, foi utilizada 4-bromo-N-[1-bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 3-bromo-N-[1-bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (146) da fórmula:



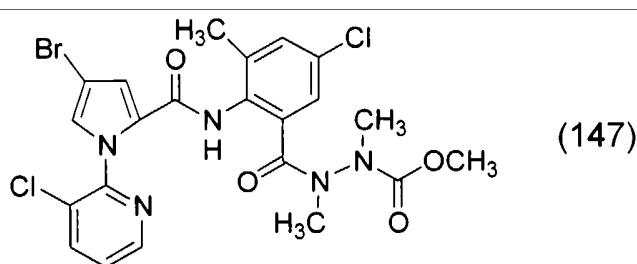
O presente composto (146)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,88 (6H, s), 7,37-7,44 (1H, m), 7,44-7,51 (2H, m), 7,69 (1H, t, $J=7$ Hz), 7,77 (1H, t, $J=7$ Hz), 8,01-8,10 (2H, m), 8,19-8,25 (2H, m), 8,43 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 8,55 (1H, sl), 9,84 (1H, sl), 10,05 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 147

Uma mistura de 0,26 g de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida, 0,05 g de cloroformato de metilo, 0,09 mL de piridina e 5 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. A mistura

reaccional foi vertida para água e extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,20 g do presente composto (147) da fórmula:

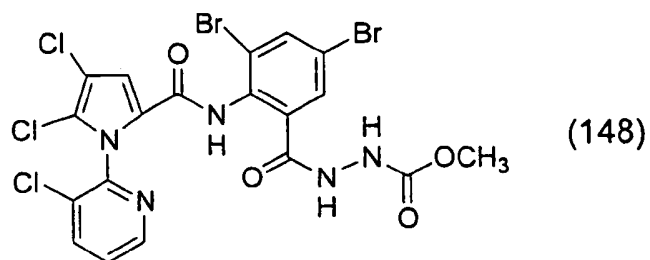


O presente composto (147)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 2,88-2,98 (3H, m), 3,13-3,22 (3H, m), 3,63-3,82 (3H, m), 7,01-7,12 (3H, m), 7,20 (1H, s), 7,30 (1H, d, $J=5$ Hz), 7,79-7,80 (1H, m), 8,37-8,38 (1H, m), 8,45-8,58 (1H, ml)

Exemplo de Preparação 148

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (148) da fórmula:

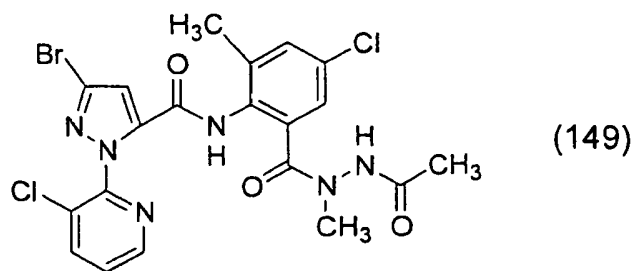


O presente composto (148)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,62 (3H, s), 7,45 (1H, s), 7,58 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,63 (1H, s), 8,10 (1H, s), 8,15 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,34 (1H, sl), 10,00 (1H, sl), 10,15 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 149

Uma mistura de 0,50 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,09 g de cloreto de acetilo, 0,09 g de piridina e 10 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com éter t-butil-metílico e hexano para obter 0,48 g do presente composto (149) da fórmula:

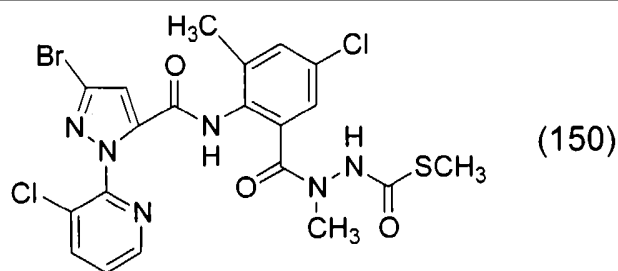


O presente composto (149)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,56 (3H, s), 2,01 (3H, s), 3,24 (3H, s), 6,97 (2H, d, $J=2$ Hz), 7,39-7,42 (2H, m), 7,88 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,39 (1H, s), 8,47 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 150

Uma mistura de 0,50 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,12 g de formato de metilclorotiol, 0,09 g de piridina e 10 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com éter t-butil-metílico e hexano para obter 0,50 g do presente composto (150) da fórmula:

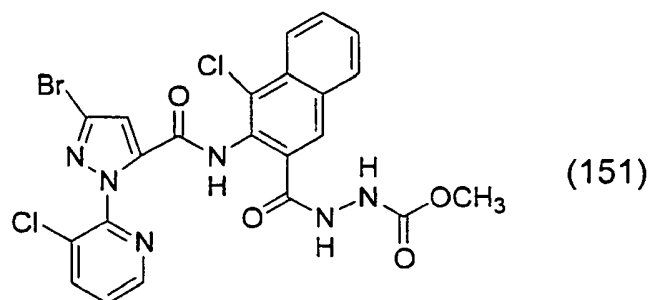


O presente composto (150)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,06 (3H, sl), 2,25 (3H, sl), 3,20 (3H, sl), 6,99-7,29 (3H, m), 7,41 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,88 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,01-8,23 (1H, ml), 8,46 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,49-9,79 (1H, ml)

Exemplo de Preparação 151

Uma mistura de 0,49 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona, 0,90 g de carbazato de metilo e 5 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,31 g do presente composto (151) da fórmula:

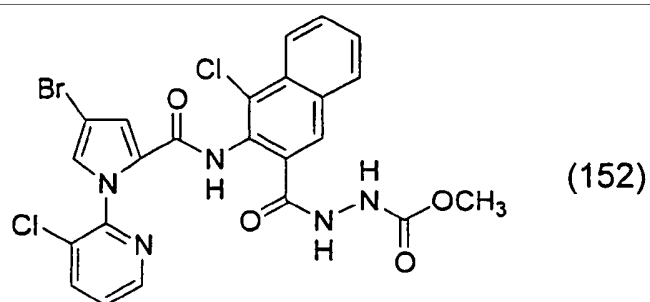


O presente composto (151)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,59-3,68 (3H, m), 7,47 (1H, s), 7,56-7,62 (1H, m), 7,74 (1H, d, $J=7$ Hz), 7,80 (1H, d, $J=7$ Hz), 8,12-8,18 (3H, m), 8,25 (1H, d, $J=7$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,35 (1H, sl), 10,30 (1H, sl), 10,60 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 152

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 151, foi utilizada 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona para obter o presente composto (152) da fórmula:

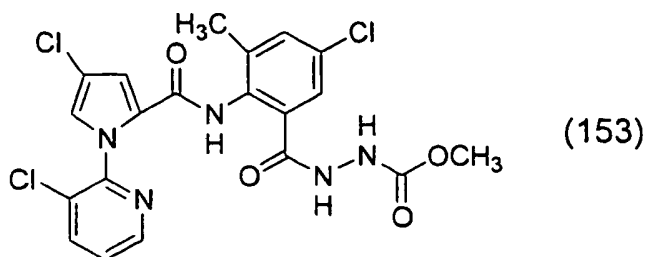


O presente composto (152)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,55-3,70 (3H, m), 7,35 (1H, s), 7,43-7,51 (2H, m), 7,71 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,79 (1H, t, $J=8$ Hz), 8,04 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,12 (2H, d, $J=8$ Hz), 8,23 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,43 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,35 (1H, sl), 10,06 (1H, sl), 10,24 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 153

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 4-cloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (153) da fórmula:

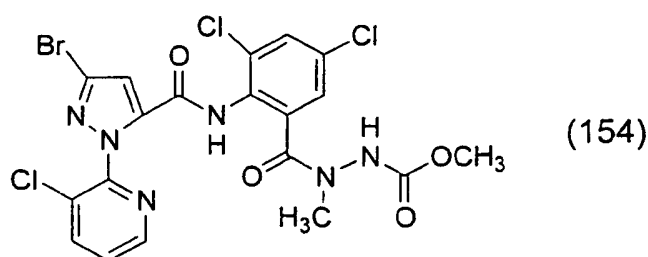


O presente composto (153)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,17 (3H, s), 3,63 (3H, s), 7,18 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,35 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,39 (1H, s), 7,47 (1H, s), 7,49 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,03 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,42 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,31 (1H, sl), 9,76 (1H, sl), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 154

Uma mistura de 0,52 g de 3-bromo-N-[4,6-dicloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,10 g de cloroformato de metilo, 0,09 g de piridina e 7 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com éter t-butil-metílico e hexano para obter 0,49 g do presente composto (154) da fórmula:

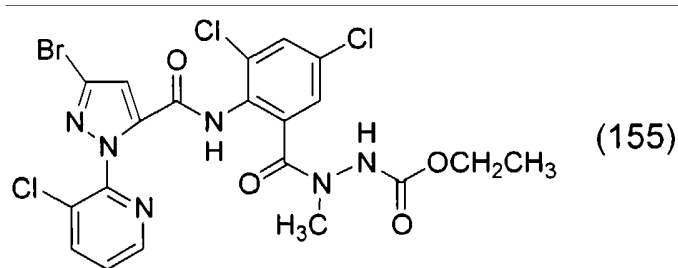


O presente composto (154)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,12-3,18 (3H, ml), 3,60-3,84 (3H, ml), 7,21-7,22 (2H, m), 7,34 (1H, sl), 7,41 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,51 (1H, sl), 7,88 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,48 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,85 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 155

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 154, foi utilizado cloroformato de etilo em vez de cloroformato de metilo para obter o presente composto (155) da fórmula:

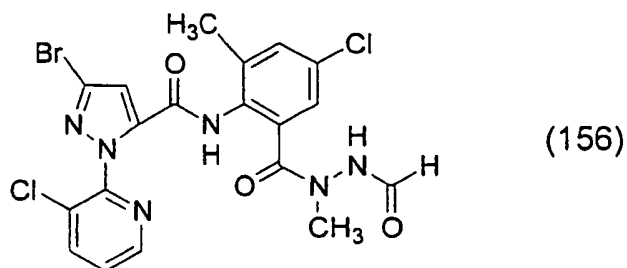


O presente composto (155)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,11-1,39 (3H, m), 3,12-3,18 (3H, m), 4,06-4,25 (2H, m), 7,08-7,22 (2H, m), 7,34 (1H, s), 7,41 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,43 (1H, s), 7,88 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,49 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,87 (1H, s)

Exemplo de Preparação 156

Uma mistura de 0,50 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida e 5 mL de ácido fórmico foi agitada a 50 °C durante 1 hora. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com éter terc-butilico e hexano para obter 0,40 g do presente composto (156) da fórmula:

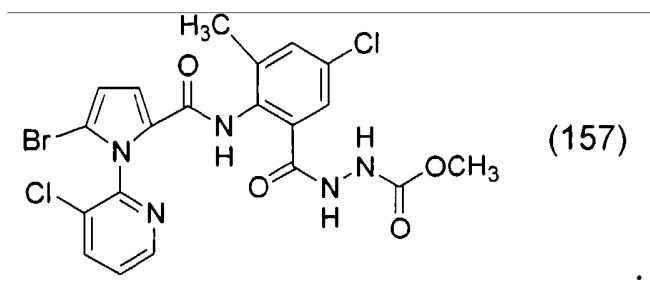


O presente composto (156)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,02 (3H, s), 3,25 (3H, s), 6,99 (2H, d, $J=4$ Hz), 7,35 (1H, s), 7,41 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,64 (1H, s), 7,88 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,47 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 8,58 (1H, s), 10,08 (1H, s)

Exemplo de Preparação 157

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 5-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (157) da fórmula:

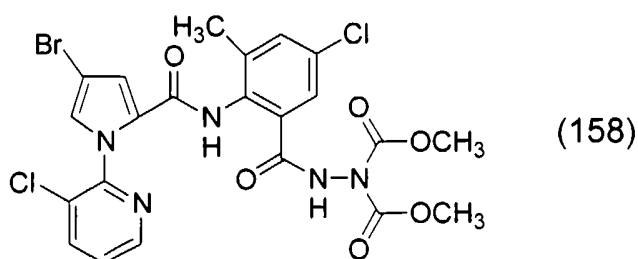


O presente composto 157

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,11 (3H, s), 3,63 (3H, s), 6,54 (1H, d, $J=3$ Hz), 7,24 (1H, d, $J=3$ Hz), 7,39 (1H, s), 7,46 (1H, s), 7,54 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,09 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,28 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,30 (1H, sl), 9,74 (1H, sl), 10,13 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 158

Sob arrefecimento com gelo, foram adicionados 0,14 mL de cloroformato de metilo a uma mistura de 0,50 g do presente composto (93), 0,26 mL de trietilamina e 15 mL de tetra-hidrofurano. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 5 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,21 g do presente composto (158) da fórmula:

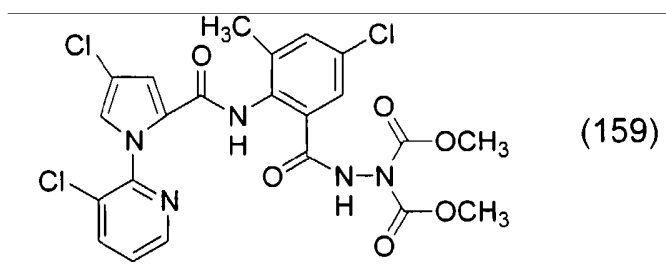


O presente composto (158)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 3,79 (6H, s), 7,01 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,07 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,30 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,32 (1H, s), 7,39 (1H, s), 7,82 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,33 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,45 (1H, sl), 8,88 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 159

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação (158), foi utilizado o presente composto (153) em vez do presente composto (93) para obter o presente composto (159) da fórmula:

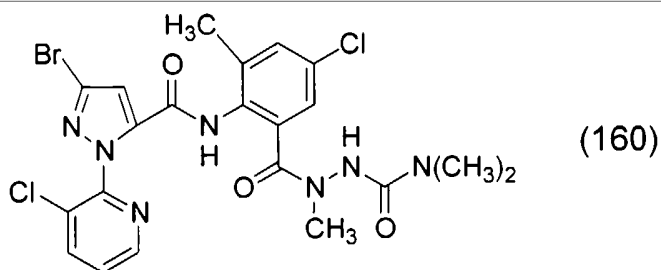


O presente composto (159)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 3,73 (6H, s), 7,00–7,01 (2H, m), 7,24–7,28 (3H, m), 7,79 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,29 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,82 (1H, sl), 9,06 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 160

Sob arrefecimento com gelo, foram misturados 0,50 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,12 g de cloreto de N,N-dimetilcarbamoílo, 0,09 g de piridina e 20 mL de tetra-hidrofurano e a mistura foi agitada a 50 °C durante 14 horas. À mistura foram adicionados mais 0,12 g de cloreto de N,N-dimetilcarbamoílo e 0,09 g de piridina. A mistura foi agitada a 50 °C durante 9 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com éter t-butil-metílico e hexano para obter 0,15 g do presente composto (160) da fórmula:

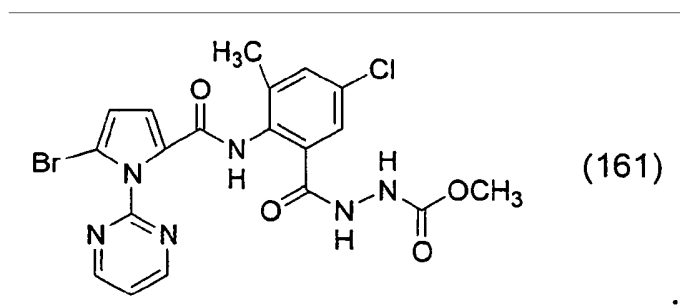


O presente composto (160)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,98 (3H, s), 2,46 (6H, s), 3,30 (3H, s), 6,95 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,05 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,37 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,51 (1H, s), 7,81 (1H, s), 7,85 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,45 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 10,34 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 161

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 5-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (161) da fórmula:

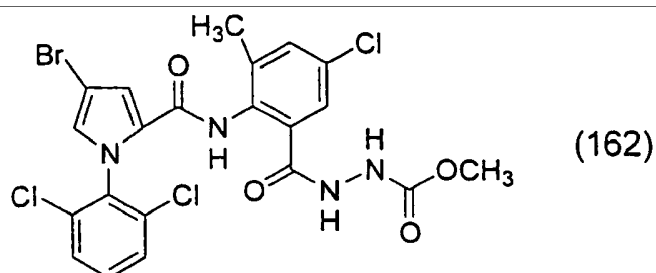


O presente composto (161)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,14 (3H, s), 3,46-3,67 (3H, m), 6,08-6,50 (1H, m), 7,08-7,29 (1H, m), 7,38 (1H, s), 7,51 (1H, s), 7,58-7,65 (1H, m), 8,89-8,95 (2H, m), 9,09-9,39 (1H, m), 9,74-9,90 (1H, m), 10,11 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 162

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (162) da fórmula:

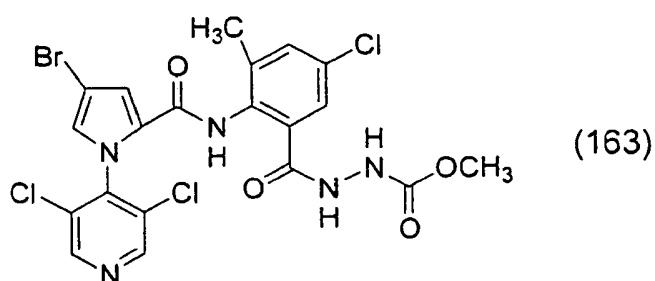


O presente composto (162)

RMN de ¹H (DMSO-d₆, TMS) δ (ppm): 2,11 (3H, s), 3,46-3,68 (3H, m), 7,27 (1H, s), 7,30-7,47 (3H, m), 7,50 (1H, s), 7,53-7,65 (2H, m), 9,02-9,38 (1H, m), 9,71 (1H, sl), 10,13 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 163

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (163) da fórmula:

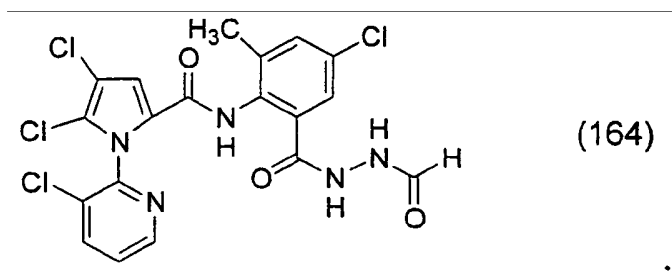


O presente composto (163)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,12 (3H, s), 3,48-3,67 (3H, m), 7,33-7,40 (2H, m), 7,46 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,51 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,76 (2H, s), 9,31 (1H, sl), 9,82 (1H, sl), 10,14 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 164

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 137, foi utilizada 4,5-dicloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (164) da fórmula:

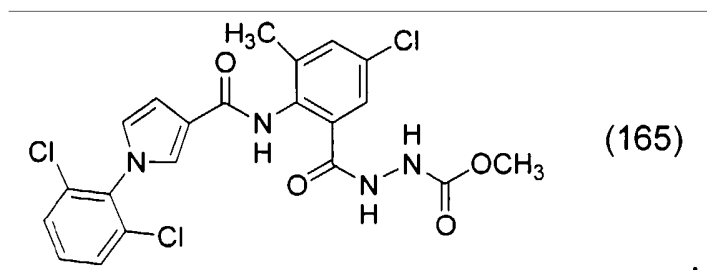


O presente composto (164)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,09-2,19 (3H, s), 7,34-7,53 (3H, m), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,06 (1H, s), 8,16 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,52 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,87 (1H, sl), 10,13 (1H, sl), 10,38 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 165

Sob arrefecimento com gelo, foram misturados 0,43 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-3-carboxamida, 0,15 g de cloroformato de metilo, 2 mL de piridina e 10 mL de acetonitrilo, e a mistura foi agitada durante 1 hora sob arrefecimento com gelo. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,16 g do presente composto (165) da fórmula:



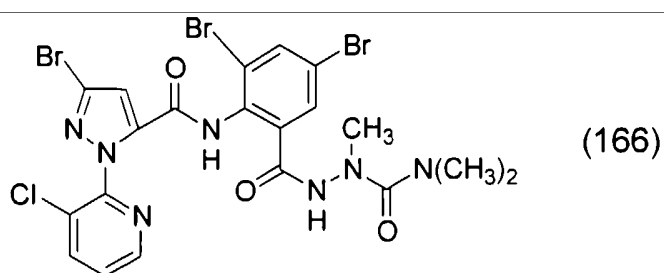
O presente composto (165)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,24 (3H, s), 3,38-3,65 (3H, m), 6,81 (1H, sl), 6,96 (1H, sl), 7,33-7,61 (4H, m), 7,68-7,74 (2H, m), 9,37 (1H, sl), 9,52 (1H, sl), 10,21 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 166

Uma mistura de 0,56 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona,

0,47 g de 2,4,4-trimetilsemicarbazida e 15 mL de 1-metil-2-pirrolidona foi agitada à temperatura ambiente durante 22 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com acetato de etilo para obter 0,11 g do presente composto (166) da fórmula:

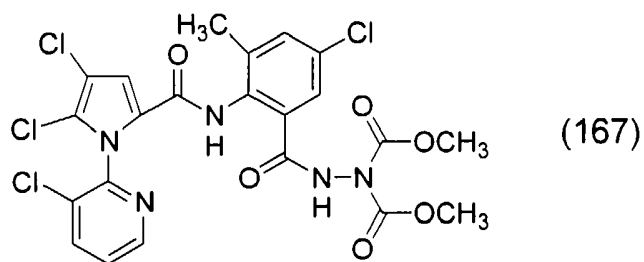


O presente composto (166)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,66 (6H, s), 2,68 (3H, s), 7,45 (1H, sl), 7,59-7,63 (2H, m), 8,15-8,17 (2H, m), 8,49 (1H, d, $J=4$ Hz), 10,50 (1H, sl), 10,55 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 167

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 158, foi utilizado o presente composto (132) em vez do presente composto (93) para obter o presente composto (167) da fórmula:

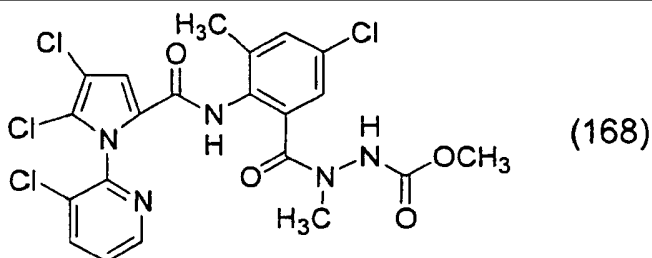


O presente composto (167)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 3,82 (6H, s), 7,00 (1H, s), 7,32 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,36-7,39 (2H, m), 7,86 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,12 (1H, s), 8,43 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 8,85 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 168

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 134, foi utilizada 4,5-dicloro-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (168) da fórmula:

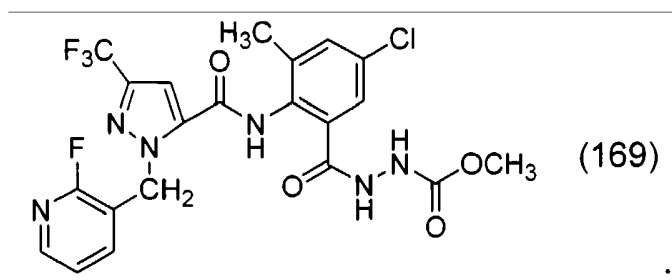


O presente composto (168)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,02-2,11 (3H, m), 3,02-3,28 (3H, m), 3,54-3,89 (3H, m), 6,95-7,15 (1H, m), 7,22-7,31 (2H, m), 7,39 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,70 (1H, sl), 7,87 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,47 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,23 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 169

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 5, foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-[(2-fluoro-3-piridinil)metil]-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (169) da fórmula:

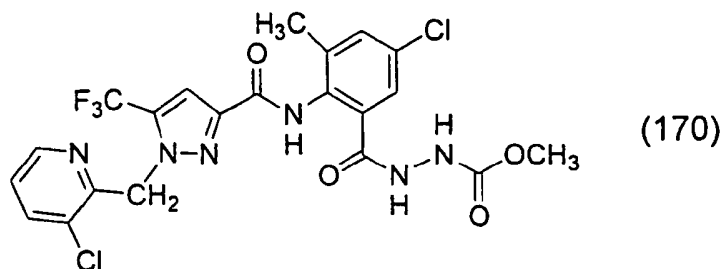


O presente composto (169)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 2,14 (3H, s), 3,52-3,62 (3H, m), 5,85 (2H, s), 7,30-7,36 (1H, m), 7,39 (1H, s), 7,51 (1H, s), 7,59 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,61-7,71 (1H, m), 8,19 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,26 (1H, sl), 10,20 (1H, sl), 10,25 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 170

Sob arrefecimento com gelo, foram misturados 0,08 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-[(3-cloro-2-piridinil)metil]-5-trifluorometil-1H-pirazole-3-carboxamida, 0,05 g de cloroformato de metilo, 1 mL de piridina e 10 mL de acetonitrilo e a mistura foi agitada durante 1 hora sob arrefecimento com gelo. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,06 g do presente composto (170) da fórmula:

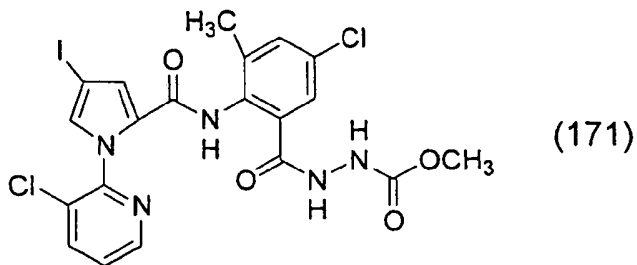


O presente composto (170)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,20 (3H, s), 3,53-3,64 (3H, m), 5,86 (2H, s), 7,41-7,49 (3H, m), 7,59 (1H, s), 8,03 (1H, d, $J=7$ Hz), 8,44 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,32 (1H, sl), 9,96 (1H, sl), 10,25 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 171

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-4-iodo-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (171) da fórmula:

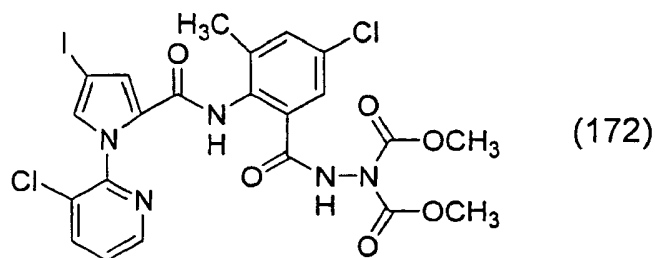


O presente composto (171)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,63 (3H, s), 7,25 (1H, s), 7,38 (1H, s), 7,40 (1H, s), 7,49 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,51 (1H, s), 8,05 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,43 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,33 (1H, sl), 9,72 (1H, sl), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 172

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 158, foi utilizado o presente composto (171) em vez do presente composto (93) para obter o presente composto (172) da fórmula:

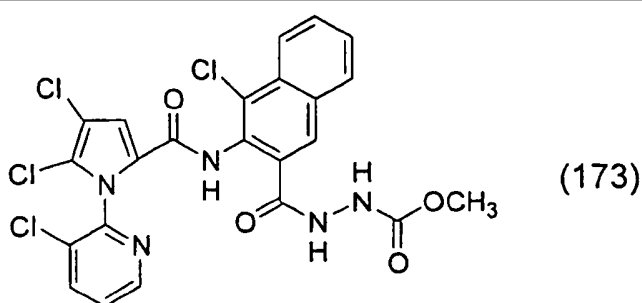


O presente composto (172)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,19 (3H, s), 3,73 (6H, s), 7,10 (1H, d, $J=1$ Hz), 7,14 (1H, d, $J=1$ Hz), 7,25-7,31 (3H, m), 7,79 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,31 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,20 (1H, s), 9,23 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 173

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 151, foi utilizada 10-cloro-2-[4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona para obter o presente composto (173) da fórmula:

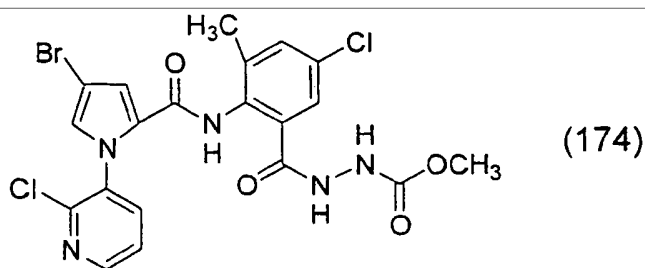


O presente composto (173)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,60 (3H, s), 7,46-7,59 (2H, m), 7,69-7,81 (2H, m), 8,11-8,23 (4H, m), 8,48-8,52 (1H, m), 9,32 (1H, sl), 10,09 (1H, sl), 10,22 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 174

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (174) da fórmula:

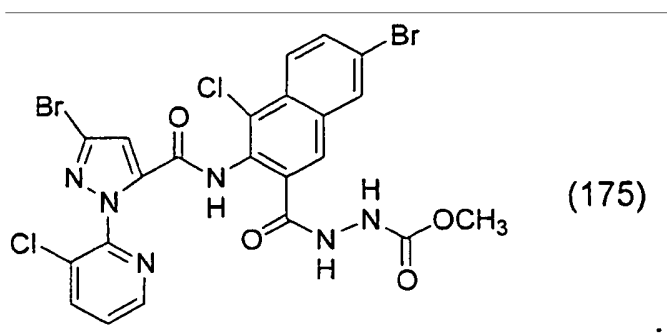


O presente composto (174)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,45-3,67 (3H, m), 7,27 (1H, s), 7,36 (1H, s), 7,42 (1H, d, $J=1$ Hz), 7,48-7,54 (2H, m), 7,94 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,42 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,29 (1H, sl), 9,73 (1H, sl), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 175

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 151, foi utilizada 7-bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona para obter o presente composto (175) da fórmula:



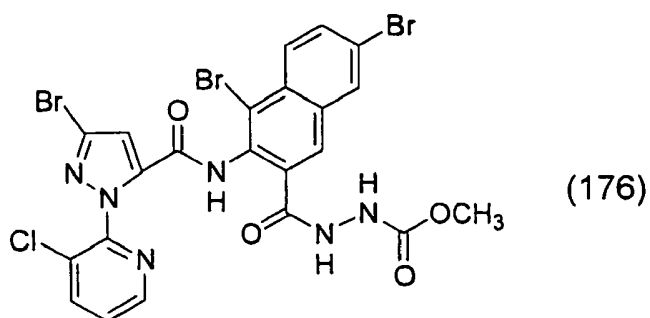
O presente composto (175)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,58-3,70 (3H, m), 7,46 (1H, s), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,93 (1H, d, $J=9$ Hz), 8,08-8,21 (3H, m), 8,46-8,53 (2H, m), 9,36 (1H, sl), 10,33 (1H, sl), 10,62 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 176

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 151, foi utilizada 7,10-dibromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-10-

cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona para obter o presente composto (176) da fórmula:

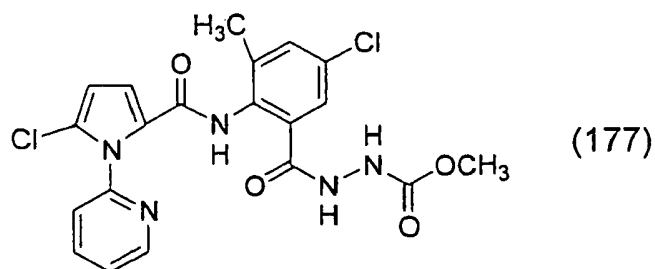


O presente composto (176)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,59-3,69 (3H, m), 7,47 (1H, s), 7,56-7,62 (1H, m), 7,92 (1H, d, $J=9$ Hz), 8,10-8,20 (3H, m), 8,45-8,54 (2H, m), 9,35 (1H, sl), 10,29 (1H, sl), 10,66 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 177

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 5-cloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (177) da fórmula:

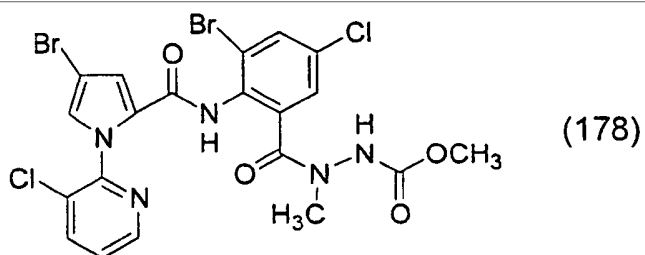


O presente composto (177)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 3,63 (3H, s), 6,42 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,13 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,37 (1H, s), 7,42-7,47 (2H, m), 7,50 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,94 (1H, td, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,50 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,33 (1H, sl), 9,69 (1H, sl), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 178

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 134, foi utilizada 4-bromo-N-[6-bromo-4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (178) da fórmula:

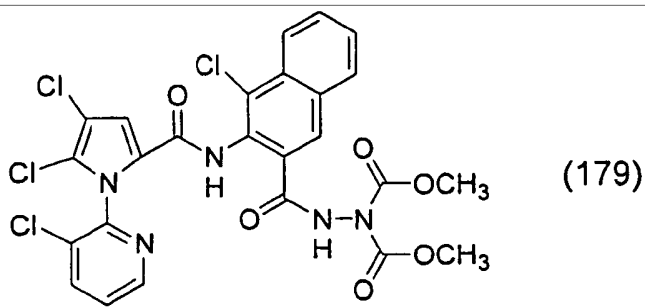


O presente composto (178)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,15 (3H, s), 3,58 (3H, s), 7,04 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,26 (1H, s), 7,35 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,46 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,70 (1H, s), 7,82 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,43 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 8,55 (1H, sl), 8,80 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 179

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 158, foi utilizado o presente composto (173) em vez do presente composto (93) para obter o presente composto (179) da fórmula:

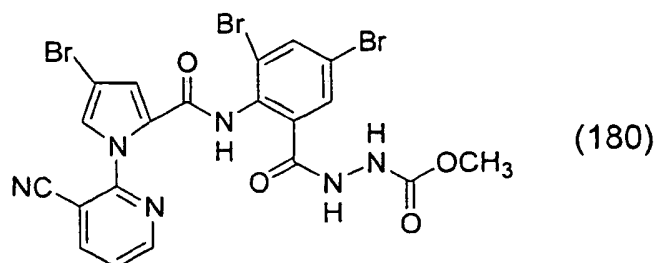


O presente composto (179)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,81 (6H, s), 7,15 (1H, s), 7,35 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,52-7,63 (2H, m), 7,84 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,85 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,04 (1H, s), 8,15 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,41 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 8,46 (1H, sl), 8,68 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 180

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 122, foi utilizada 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-ciano-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (180) da fórmula:



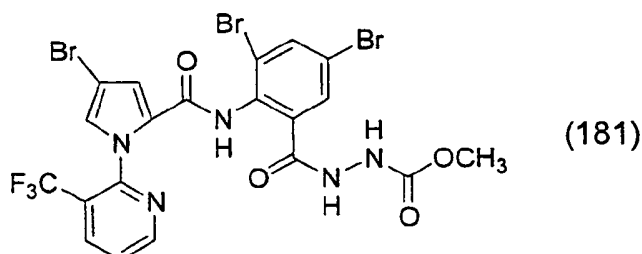
O presente composto (180)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,62 (3H, s), 7,36 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,64 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,64 (1H, s), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,11 (1H, s), 8,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,74 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,24 (1H, sl), 10,03 (1H, sl), 10,14 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 181

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 122, foi utilizada 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-

4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (181) da fórmula:

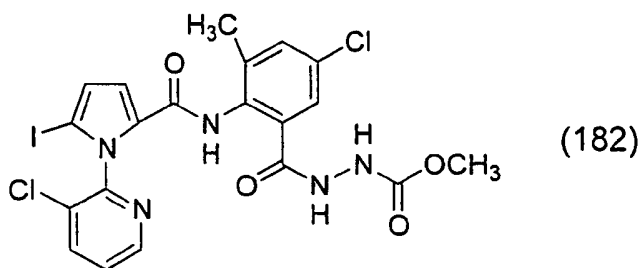


O presente composto (181)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,62 (3H, s), 7,33 (1H, s), 7,50 (1H, s), 7,63 (1H, s), 7,72 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,08 (1H, s), 8,33 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,74 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,35 (1H, sl), 9,88 (1H, sl), 10,11 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 182

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (182) da fórmula:

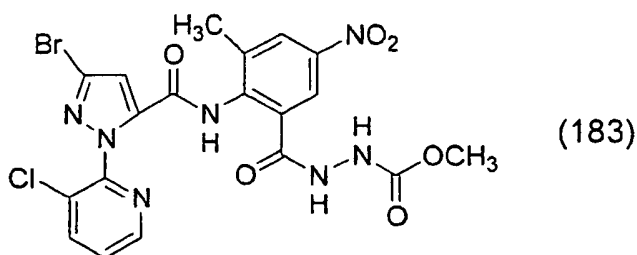


O presente composto (182)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,11 (3H, s), 3,63 (3H, s), 6,63 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,19 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,40 (1H, s), 7,43 (1H, s), 7,52 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,06 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,48 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,28 (1H, sl), 9,71 (1H, sl), 10,13 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 183

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-6-nitro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (183) da fórmula:

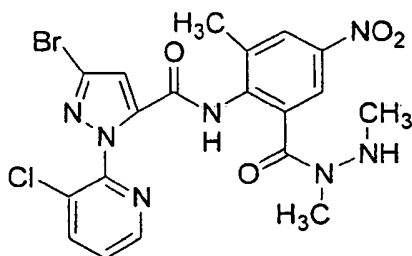


O presente composto (183)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,29 (3H, s), 3,51-3,68 (3H, m), 7,37-7,42 (1H, m), 7,58-7,65 (1H, m), 8,14-8,22 (2H, m), 8,32-8,39 (1H, m), 8,48-8,54 (1H, m), 9,39 (1H, sl), 10,41 (1H, sl), 10,58 (1H, sl)

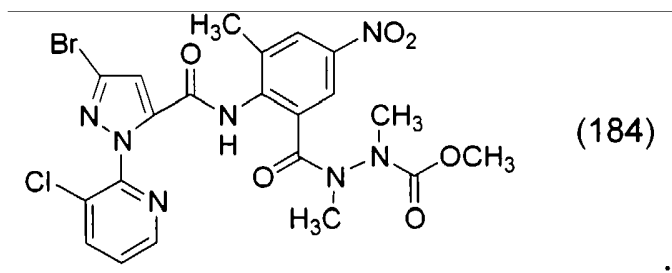
Exemplo de Preparação 184

A uma mistura de 0,26 g de dicloridrato de N,N'-dimetil-hidrazina, 2 mL de água, 0,5 g de carbonato de potássio e 10 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 0,20 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-6-nitro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. A mistura reaccional foi vertida para água e extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metil-4-nitrofenil]-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



Sob arrefecimento com gelo, foi adicionado 0,1 g de cloroformato de metilo a uma mistura de 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metil-4-nitrofenil]-1H-pirazole-5-carboxamida, 1 mL de piridina e 10 mL de acetonitrilo, e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre

sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,07 g do presente composto (184) da fórmula:

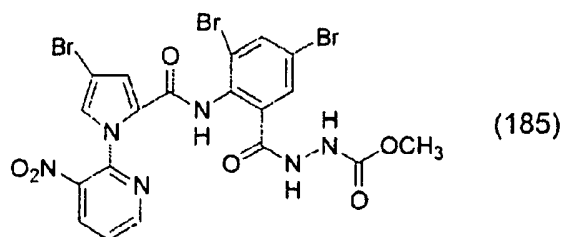


O presente composto (184)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,27-2,37 (3H, m), 2,70-2,88 (3H, m), 2,88-3,11 (3H, m), 3,45-3,74 (3H, m), 7,38-7,46 (1H, m), 7,63 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,92-8,04 (1H, m), 8,21 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,24-8,34 (1H, m), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 10,40-10,75 (1H, m)

Exemplo de Preparação 185

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 122, foi utilizada 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-nitro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (185) da fórmula:

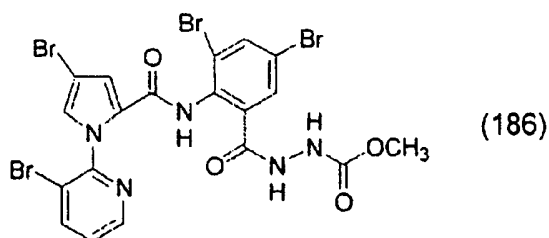


O presente composto (185)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 3,61 (3H, s), 7,36 (1H, s), 7,57 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,62 (1H, s), 7,78 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,10 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,79 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,24 (1H, sl), 9,95 (1H, sl), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 186

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 122, foi utilizada 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-bromo-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (186) da fórmula:

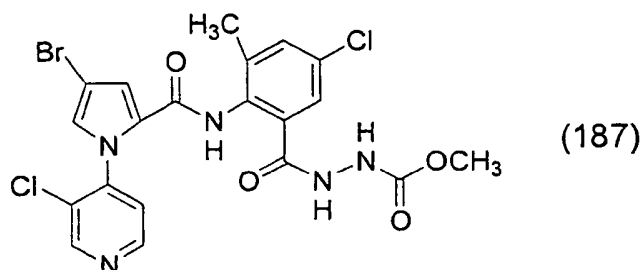


O presente composto (186)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,61 (3H, s), 7,32 (1H, s), 7,40 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,42 (1H, s), 7,63 (1H, s), 8,10 (1H, s), 8,17 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,46 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,36 (1H, sl), 9,90 (1H, sl), 10,16 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 187

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (187) da fórmula:

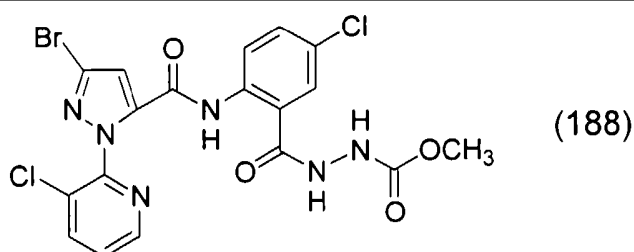


O presente composto (187)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 3,41-3,68 (3H, m), 7,29 (1H, sl), 7,33-7,40 (1H, m), 7,43 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,52 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,55 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,59 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,72 (1H, sl), 9,30 (1H, sl), 9,78 (1H, sl), 10,15 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 188

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (188) da fórmula:



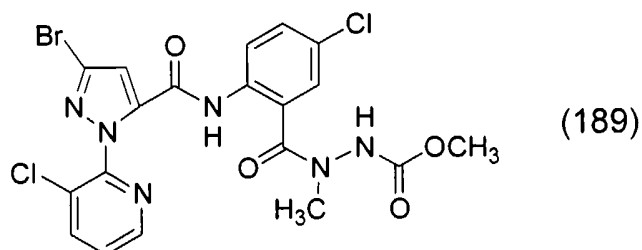
O presente composto (188)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,68 (3H, sl), 7,23 (1H, sl), 7,62 (1H, dd, $J=9$ Hz, 2 Hz), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,88 (1H, s), 8,18 (1H, d, $J=9$ Hz), 8,25 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,54 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,49 (1H, sl), 10,78 (1H, sl), 11,77 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 189

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 115, foi utilizada 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-

pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (189) da fórmula:

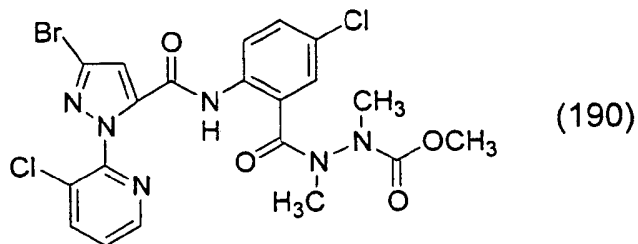


O presente composto (189)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,07 (3H, s), 3,51 (3H, sl), 7,29 (2H, sl), 7,47-7,54 (2H, m), 7,65 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,22 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,52 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,55 (1H, sl), 10,14 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 190

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 119, foi utilizada 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (190) da fórmula:

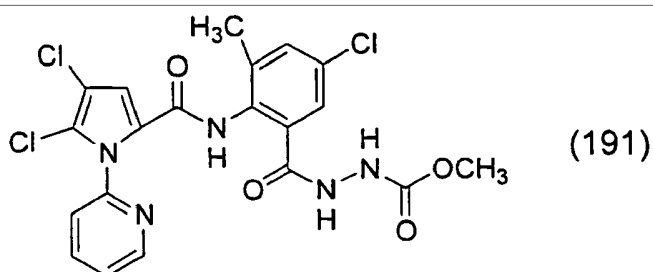


O presente composto (190)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,83-3,07 (6H, m), 3,52-3,70 (3H, m), 7,29-7,60 (4H, m), 7,64 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,22 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 10,53-10,68 (1H, ml).

Exemplo de Preparação 191

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 4,5-dicloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (191) da fórmula:

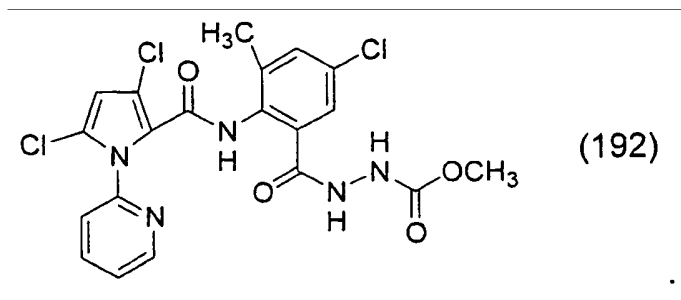


O presente composto (191)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 3,63 (3H, s), 7,24 (1H, s), 7,35 (1H, s), 7,49-7,51 (3H, m), 7,97 (1H, td, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,52 (1H, dd, $J=6$ Hz, 2 Hz), 9,31 (1H, sl), 9,78 (1H, sl), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 192

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 3,5-dicloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (192) da fórmula:

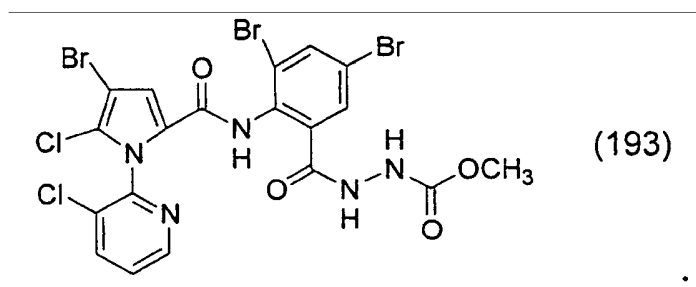


O presente composto (192)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,09 (3H, s), 3,68 (3H, s), 6,69 (1H, s), 7,42 (1H, s), 7,48-7,60 (3H, m), 7,94-8,01 (1H, m), 8,51 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,37 (1H, sl), 9,71 (1H, sl), 10,33 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 193

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foi utilizada 4-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (193) da fórmula:



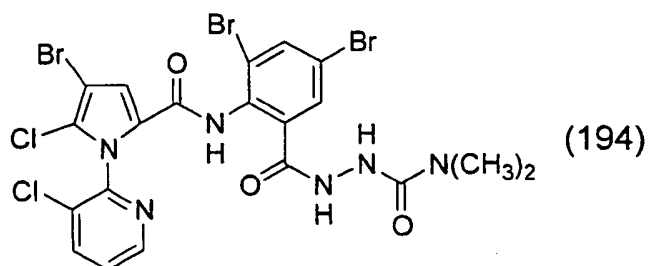
O presente composto (193)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,62 (3H, s), 7,47 (1H, s), 7,58 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,63 (1H, s), 8,10 (1H, s), 8,15 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,51 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,34 (1H, sl), 10,00 (1H, sl), 10,15 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 194

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 128, foi utilizada 4-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4,5-dibromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-

pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (194) da fórmula:

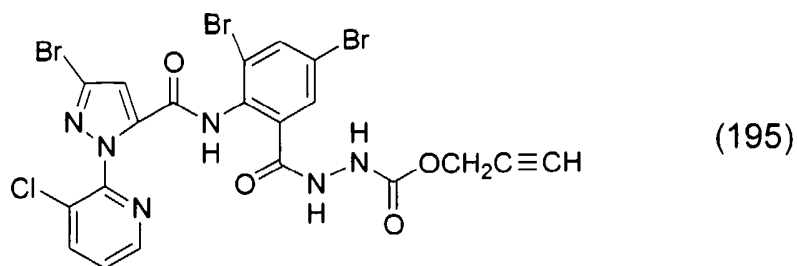


O presente composto (194)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,85 (6H, s), 7,53 (1H, s), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,70 (1H, s), 8,06 (1H, s), 8,16 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,51 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,56 (1H, sl), 9,82 (1H, sl), 9,97 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 195

Uma mistura de 0,59 g de 3-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,23 g de cloroformato de propargilo, 0,16 g de piridina e 2 mL de acetonitrilo foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com acetato de etilo para obter 0,22 g do presente composto (195) da fórmula:

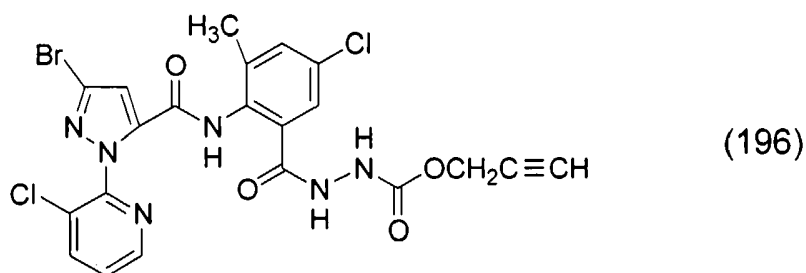


O presente composto (195)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,56 (1H, s), 4,71 (2H, s), 7,41 (1H, s), 7,60 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,66 (1H, s), 8,14-8,16 (2H, m), 8,50 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,60 (1H, sl), 10,29 (1H, sl), 10,50 (1H, sl).

Exemplo de Preparação 196

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 34, foi utilizado cloroformato de propargilo em vez de cloroformato de metilo para obter o presente composto (196) da fórmula:

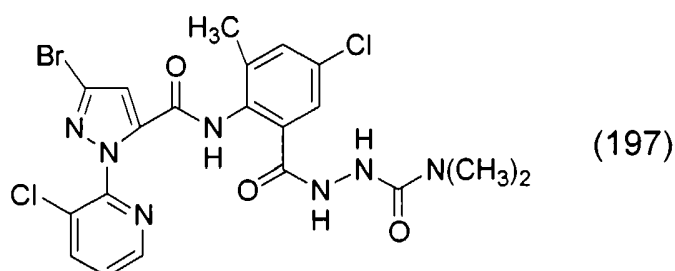


O presente composto (196)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,56 (1H, sl), 4,72 (2H, s), 7,35 (1H, s), 7,39 (1H, sl), 7,55 (1H, s), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,17 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,50 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,55 (1H, s), 10,23-10,26 (2H, ml).

Exemplo de Preparação 197

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 10, foi utilizada 3-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (197) da fórmula:

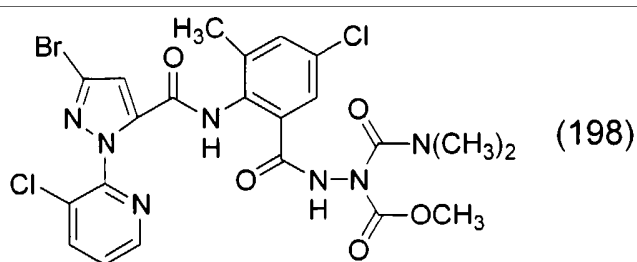


O presente composto (197)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,20 (3H, s), 2,93 (6H, s), 7,50-7,52 (2H, m), 7,58 (1H, sl), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,24 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,56 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,60 (1H, s), 9,89 (1H, sl), 10,23 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 198

A uma mistura de 0,20 g do presente composto (197), 0,10 mL de trietilamina e 5 mL de tetra-hidrofurano foram adicionados, gota a gota, 0,040 mL de cloroformato de metilo sob arrefecimento com gelo. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 2,5 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel até 0,13 g do presente composto (198) da fórmula:

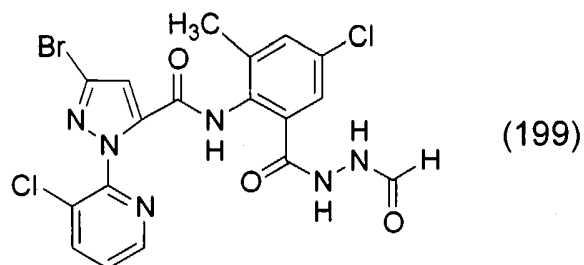


O presente composto (198)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 3,05 (3H, sl), 3,15 (3H, sl), 3,76 (3H, s), 6,99 (1H, s), 7,35–7,38 (2H, m), 7,44 (1H, s), 7,86 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,39 (1H, s), 8,46 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,40 (1H, s)

Exemplo de Preparação 199

Uma mistura de 1,0 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 1,33 g de hidrazida fórmica e 40 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada a 50 °C durante 3,5 horas e a 70 °C durante 7 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e foi ali vertida água. A mistura foi extraída com éter terc-butil-metílico. A camada orgânica foi lavada com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,36 g do presente composto (199) da fórmula:

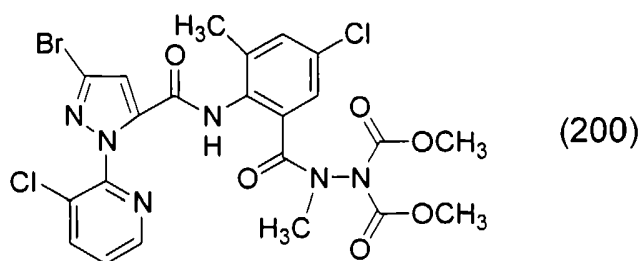


O presente composto (199)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,10-2,21 (3,0H, m), 7,25-7,62 (4,7H, m), 7,79-7,81 (0,2H, m), 8,05 (0,3H, s), 8,16 (1,0H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1,0H, d, $J=5$ Hz), 9,48-9,55 (0,7H, m), 10,05-10,45 (2,1H, m)

Exemplo de Preparação 200

A uma mistura de 0,20 g do presente composto (115), 0,14 mL de trietilamina e 10 mL de acetonitrilo foram adicionados 0,12 mL de cloroformato de metilo à temperatura ambiente. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 18 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,010 g do presente composto (200) da fórmula:

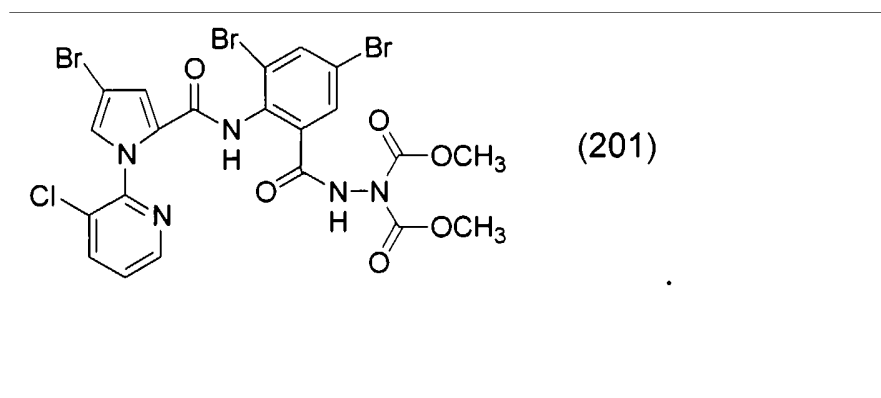


O presente composto (200)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,21 (3H, s), 3,23 (3H, s), 3,89 (6H, sl), 6,46 (1H, s), 7,08 (1H, s), 7,30 (1H, s), 7,43 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,92 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,51 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,21 (1H, s)

Exemplo de Preparação 201

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 158, foi utilizado o presente composto (122) em vez do presente composto (93) para obter o presente composto (201) da fórmula:

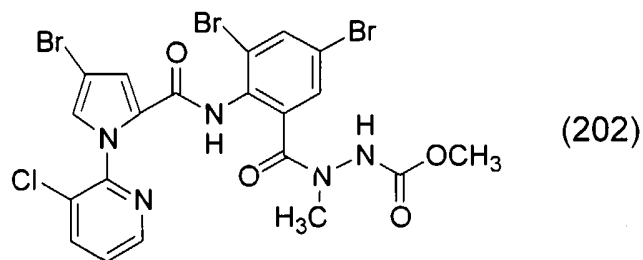


O presente composto (201)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,74 (6H, s), 7,08 (2H, s), 7,30 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,66 (1H, s), 7,82 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,86 (1H, s), 8,28 (1H, sl), 8,32 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,60 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 202

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 134, foi utilizada 4-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (202) da fórmula:

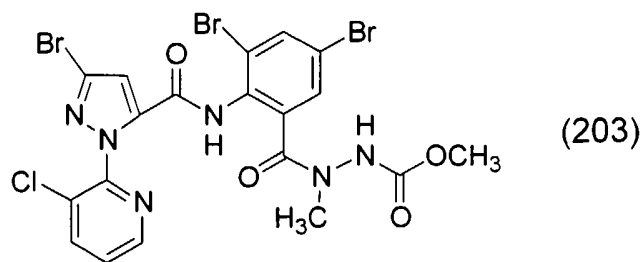


O presente composto (202)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,05 (0,5H, sl), 3,13 (2,5H, s), 3,59 (2,5H, s), 3,82 (0,5H, sl), 7,05 (1,0H, d, $J=2$ Hz), 7,21 (1,0H, s), 7,35 (1,3H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,42 (1,0H, s), 7,65 (2,0H, s), 7,82 (1,0H, d, $J=8$ Hz), 8,43 (1,0H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 8,57 (0,7H, s)

Exemplo de Preparação 203

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 115, foi utilizada 3-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (203) da fórmula:

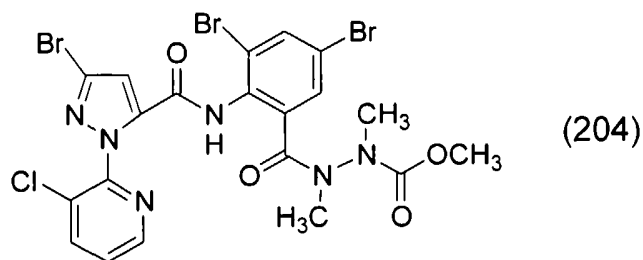


O presente composto (203)

RMN de ^1H (100 °C, DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,96 (3H, s), 3,04 (3H, sl), 7,30 (1H, s), 7,38 (1H, s), 7,58 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,96 (1H, s), 8,11 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,47 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,68 (1H, sl), 10,08 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 204

Uma mistura de 0,30 g de 3-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,15 mL de cloroformato de metilo e 3 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2,5 horas. Em seguida, foram ali adicionados 0,08 mL de cloroformato de metilo e a mistura foi agitada durante 1 hora. Em seguida, foram ali adicionados 0,08 mL de cloroformato de metilo e a mistura foi ainda agitada durante 0,5 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,24 g do presente composto (204) da fórmula:

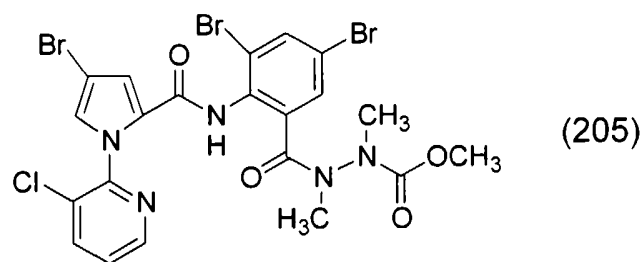


O presente composto (204)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,71 (1,4H, s), 2,83 (1,6H, s), 2,94 (1,5H, s), 3,06 (1,5H, s), 3,35-3,70 (3,0H, m), 7,41 (0,5H, s), 7,45 (0,6H, s), 7,47 (0,6H, s), 7,60-7,64 (1,3H, m), 8,07 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 8,13 (0,5H, s), 8,18 (1,0H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1,0H, m), 10,52 (0,5H, s), 10,67 (0,5H, s)

Exemplo de Preparação 205

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 147, foi utilizada 4-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (205) da fórmula:

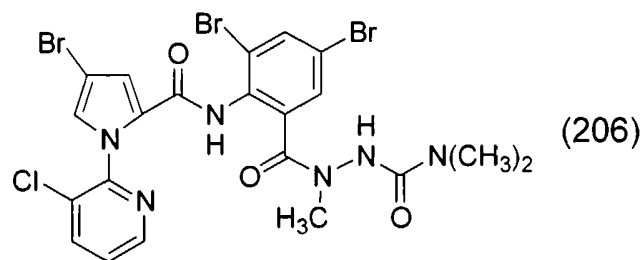


O presente composto (205)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,73 (1,4H, s), 2,82 (1,8H, s), 2,89 (1,3H, s), 3,06 (1,5H, s), 3,35-3,70 (3,0H, m), 7,32 (0,5H, s), 7,34-7,38 (0,6H, m), 7,43 (0,5H, s), 7,48-7,53 (2,4H, m), 8,03 (0,4H, d, $J=2$ Hz), 8,07-8,10 (1,6H, m), 8,43-8,45 (1,0H, m), 9,93 (0,5H, s), 10,07 (0,5H, s)

Exemplo de Preparação 206

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 136, foi utilizada 4-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida para obter o presente composto (206) da fórmula:

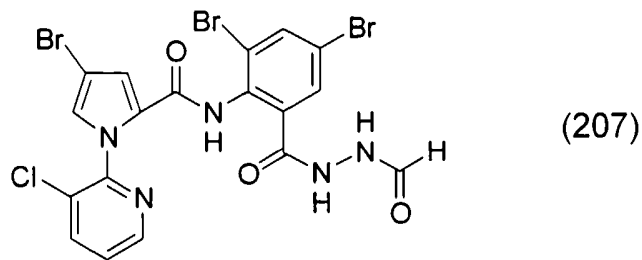


O presente composto (206)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,47 (6H, s), 3,29 (3H, s), 7,04 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,31 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,43 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,51 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,53 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,80 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,09 (1H, s), 8,41 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,67 (1H, s)

Exemplo de Preparação 207

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 199, foi utilizada 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (207) da fórmula:

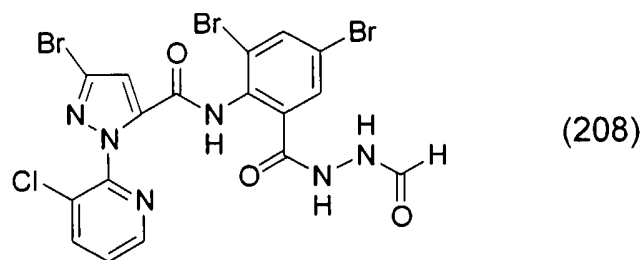


O presente composto (207)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,31 (0,6H, s), 7,38 (0,3H, s), 7,44 (0,6H, d, $J=2$ Hz), 7,47-7,52 (1,5H, m), 7,65-7,75 (1,3H, m), 8,03-8,12 (2,7H, m), 8,43 (1,0H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,49-9,52 (0,3H, m), 9,94-9,99 (0,4H, m), 10,17 (1,0H, s), 10,39-10,44 (1,0H, m)

Exemplo de Preparação 208

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 199, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (208) da fórmula:

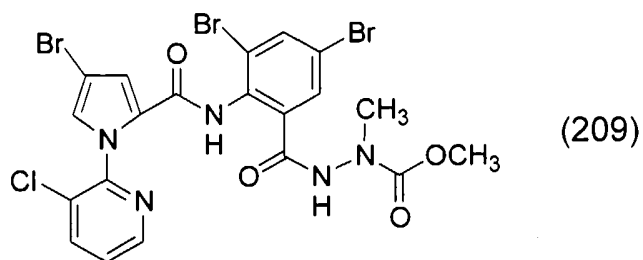


O presente composto (208)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,41 (0,7H, s), 7,45 (0,3H, s), 7,58-7,63 (1,0H, m), 7,69-7,73 (1,0H, m), 7,77-7,79 (0,4H, m), 8,04 (0,6H, s), 8,13-8,18 (2,0H, m), 8,49-8,51 (1,0H, m), 9,55-9,58 (0,4H, m), 10,18 (0,6H, s), 10,45-10,60 (2,0H, m)

Exemplo de Preparação 209

Uma mistura de 0,30 g de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,28 g de N-metil-N-metoxycarbonil-hidrazina e 15 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada a 80 °C durante 35 horas, e, em seguida, deixada arrefecer até à temperatura ambiente. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com éter terc-butil-metílico. A camada orgânica foi lavada sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,18 g do presente composto (209) da fórmula:

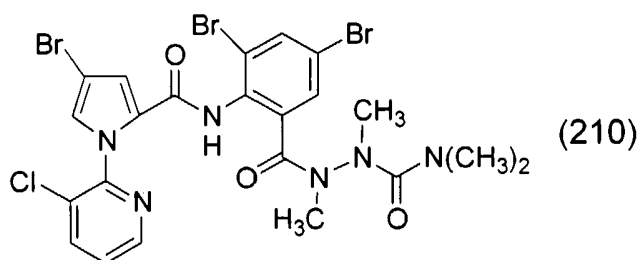


O presente composto (209)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,84 (3H, s), 3,45-3,70 (3H, ml), 7,38 (1H, sl), 7,47 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,50 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,54 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,05 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,12 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,41 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,95 (1H, s), 10,50 (1H, s)

Exemplo de Preparação 210

Uma mistura de 0,16 g de 4-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida, 0,12 mL de cloreto de N,N-dimetilcarbamoílo e 0,2 mL de piridina foi agitada a 80 °C durante 5 horas e, em seguida, deixada arrefecer até à temperatura ambiente. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,15 g do presente composto (210) da fórmula:

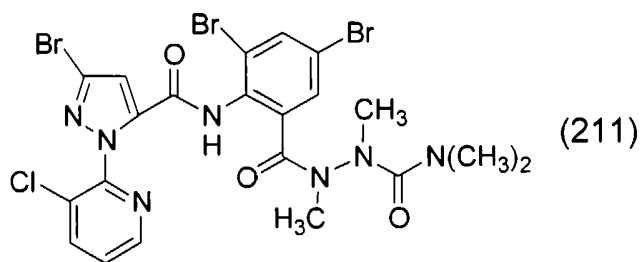


O presente composto (210)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,44 (4,5H, s), 2,58 (3,0H, s), 2,74 (1,5H, sl), 2,78 (1,0H, s), 3,12 (2,0H, s), 7,14 (0,7H, d, $J=2$ Hz), 7,32 (0,7H, d, $J=2$ Hz), 7,38 (0,3H, s), 7,47-7,54 (2,3H, m), 8,00 (0,7H, d, $J=2$ Hz), 8,07-8,10 (1,3H, m), 8,42-8,45 (1,0H, m), 9,95 (0,7H, sl), 10,08 (0,3H, sl)

Exemplo de Preparação 211

Uma mistura de 0,16 g de 3-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,12 mL de cloreto de N,N-dimetilcarbamoílo e 2 mL de piridina foi agitada a 80 °C durante 5 horas, e, em seguida, deixada arrefecer até à temperatura ambiente. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,12 g do presente composto (211) da fórmula:

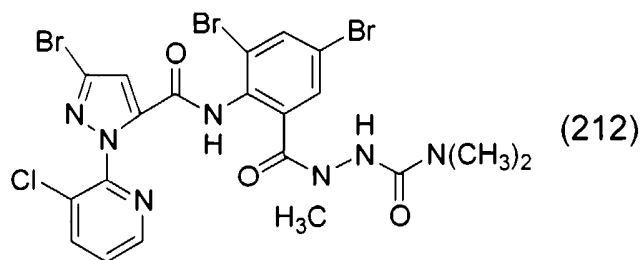


O presente composto (211)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,35 (4,5H, s), 2,49 (2,0H, s), 2,57 (1,0H, sl), 2,67 (1,5H, sl), 2,73 (1,0H, s), 3,05 (2,0H, s), 7,10 (0,7H, s), 7,34 (0,7H, s), 7,39 (0,3H, s), 7,52-7,57 (1,3H, m), 7,97 (0,7H, d, $J=2$ Hz), 8,06 (0,3H, s), 8,11 (1,0H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,41-8,45 (1,0H, m), 10,49 (0,7H, s), 10,62 (0,3H, s)

Exemplo de Preparação 212

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 160, foi utilizada 3-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida em vez de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida para obter o presente composto (212) da fórmula:

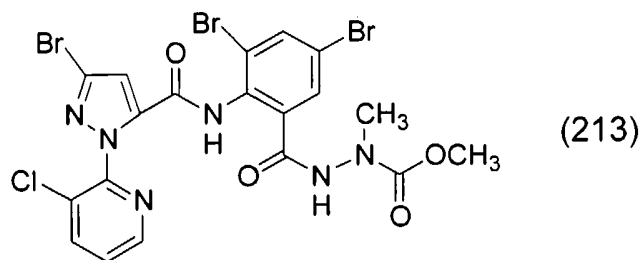


O presente composto (212)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,50 (6H, s), 3,28 (3H, s), 7,38 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,46 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,50 (1H, s), 7,55 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,78 (1H, s), 7,86 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,46 (1H, d, $J=5$ Hz), 10,20 (1H, s).

Exemplo de Preparação 213

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 114, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (213) da fórmula:

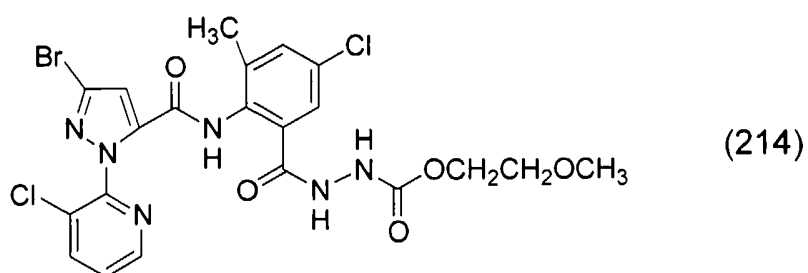


O presente composto (213)

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,87 (3H, s), 3,46-3,66 (3H, ml), 7,46 (1H, s), 7,58-7,61 (2H, m), 8,13-8,18 (2H, m), 8,47 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 10,54 (1H, s), 10,61 (1H, s)

Exemplo de Preparação 214

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 34, foi utilizado cloroformato de 2-metoxietilo em vez de cloroformato de metilo para obter o presente composto (214) da fórmula:

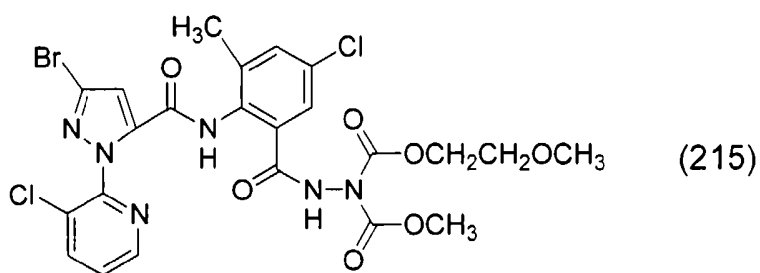


O presente composto (214)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,21 (3H, s), 3,39 (3H, sl), 3,61 (2H, sl), 4,31 (2H, sl), 6,96 (1H, sl), 7,01 (1H, s), 7,32-7,39 (3H, m), 7,85 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,03 (1H, sl), 8,41 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,47 (1H, s)

Exemplo de Preparação 215

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 95, foi utilizado o presente composto (214) em vez do presente composto (34) para obter o presente composto (215) da fórmula:

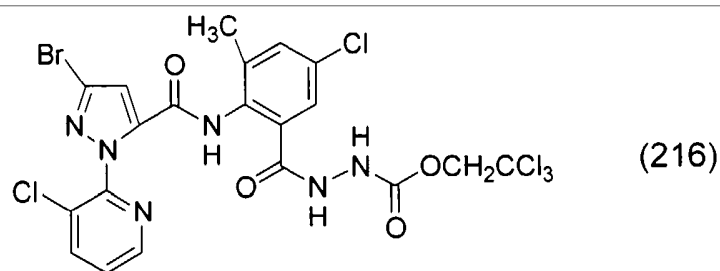


O presente composto (215)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,24 (3H, s), 3,31 (3H, s), 3,58 (2H, t, $J=5$ Hz), 3,83 (3H, s), 4,32 (2H, sl), 6,98 (1H, s), 7,32-7,37 (2H, m), 7,46 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,88 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,34 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,70 (1H, s), 9,33 (1H, s)

Exemplo de Preparação 216

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 34, foi utilizado cloroformato de 2,2,2-tricloroetilo em vez de cloroformato de metilo para obter o presente composto (216) da fórmula:

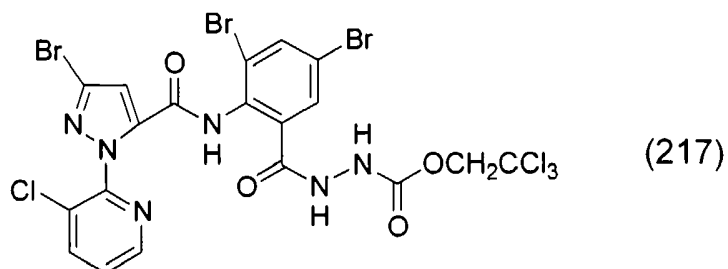


O presente composto (216)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,22 (3,0H, s), 4,89 (0,4H, s), 4,97 (1,6H, s), 7,41 (1,0H, s), 7,46 (0,8H, s), 7,53 (0,2H, s), 7,62 (1,0H, s), 7,67 (1,0H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,24 (1,0H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,56 (1,0H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,52 (0,2H, s), 10,00 (0,8H, s), 10,31-10,36 (1,0H, m), 10,41 (0,8H, s), 10,50 (0,2H, s)

Exemplo de Preparação 217

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 195, foi utilizado cloroformato de 2,2,2-tricloroetilo em vez de cloroformato de propargilo para obter o presente composto (217) da fórmula:

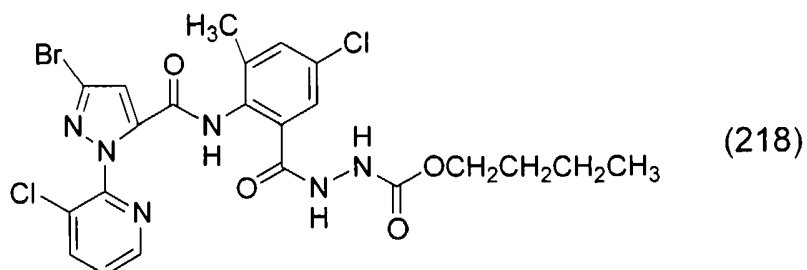


O presente composto (217)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 4,83-4,90 (2,0H, ml), 7,40 (1,0H, s), 7,60 (1,0H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,67 (0,7H, s), 7,74 (0,3H, s), 8,14-8,18 (2,0H, m), 8,50 (1,0H, d, $J=5$ Hz), 9,51 (0,3H, s), 9,99 (0,7H, s), 10,41 (0,7H, s), 10,48-10,54 (1,3H, m)

Exemplo de Preparação 218

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 34, foi utilizado cloroformato de butilo em vez de cloroformato de metilo para obter o presente composto (218) da fórmula:

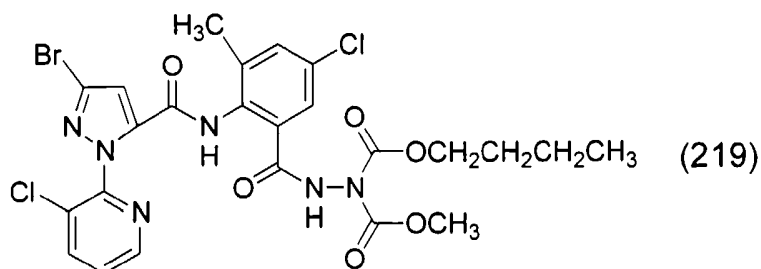


O presente composto (218)

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 0,90 (3H, sl), 1,36 (2H, sl), 1,56 (2H, sl), 2,15 (3H, s), 3,92-4,06 (2H, ml), 7,34-7,39 (2H, ml), 7,55 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,17 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,49 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,26 (1H, s), 10,13 (1H, s), 10,23 (1H, s)

Exemplo de Preparação 219

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 95, foi utilizado o presente composto (218) em vez do presente composto (34) para obter o presente composto (219) da fórmula:

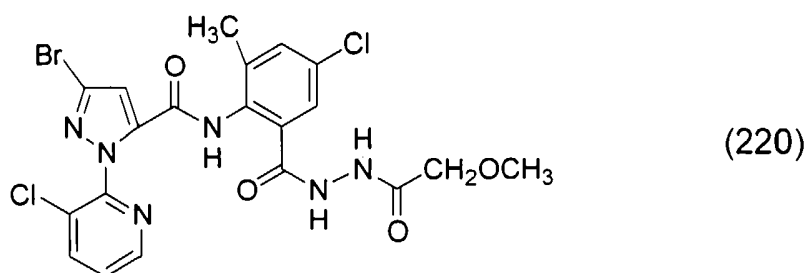


O presente composto (219)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 0,93 (3H, t, $J=7$ Hz), 1,38 (2H, qt, $J=7$ Hz, 7 Hz), 1,65 (2H, tt, $J=7$ Hz, 7 Hz), 2,23 (3H, s), 3,81 (3H, s), 4,24 (2H, t, $J=7$ Hz), 6,97 (1H, s), 7,34-7,38 (2H, m), 7,44 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,88 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,35 (1H, s), 8,38 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,24 (1H, s)

Exemplo de Preparação 220

Uma mistura de 0,30 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,10 g de cloreto de metoxiacetilo e 3 mL de piridina foi agitada à temperatura ambiente durante 2,5 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas e lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,21 g do presente composto (220) da fórmula:

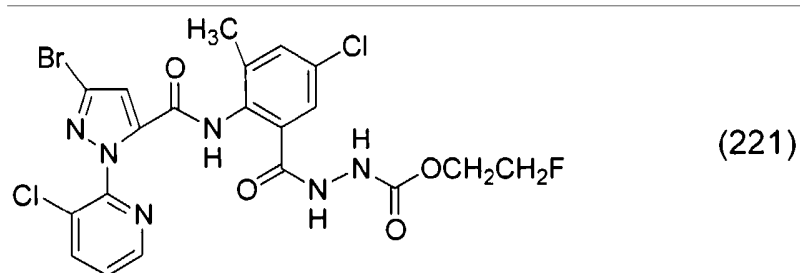


O presente composto (220)

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,21 (3H, s), 3,50 (3H, s), 4,08 (2H, s), 7,02 (1H, s), 7,34-7,40 (3H, m), 7,86 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,44 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 8,57 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,85 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,58 (1H, s).

Exemplo de Preparação 221

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 34, foi utilizado cloroformato de 2-fluoroetilo em vez de cloroformato de metilo para obter o presente composto (221) da fórmula:

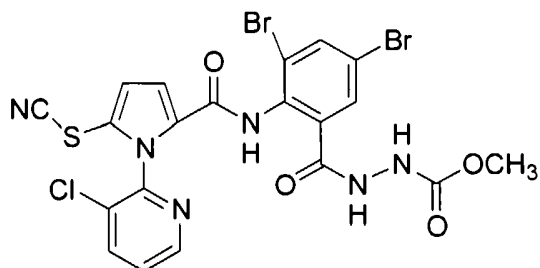


O presente composto (221)

RMN de ^1H (DMSO-d_6 , TMS) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 4,20-4,34 (2H, m), 4,53-4,70 (2H, m), 7,35 (1H, s), 7,39 (1H, s), 7,55 (1H, s), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,17 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,50 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,49 (1H, s), 10,19 (1H, sl), 10,24 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 222

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 122, foi utilizada 6,8-dibromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-tiocianato-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (222) da fórmula:



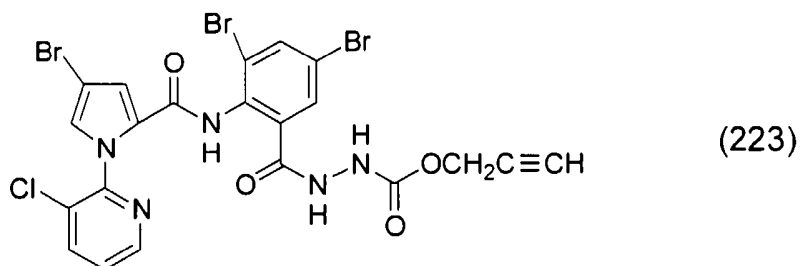
(222)

O presente composto (222)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,61 (3H, s), 7,10 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,38 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,64 (1H, sl), 8,11 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,15 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,54 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,35 (1H, sl), 10,14 (2H, sl)

Exemplo de Preparação 223

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foram utilizados 4-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida e cloroformato de propargilo em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida e cloroformato de metilo respectivamente para obter o presente composto (223) da fórmula:

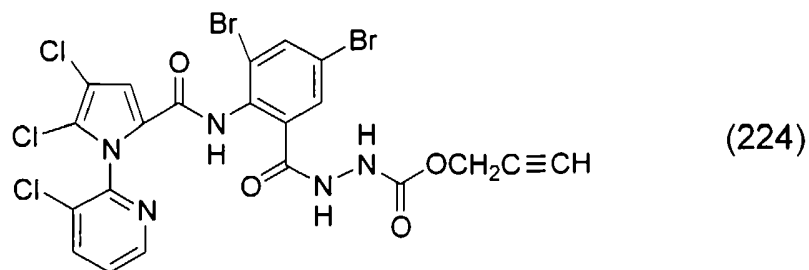


O presente composto (223)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,55 (1H, s), 4,70 (2H, s), 7,30 (1H, s), 7,44 (1H, d, $J=1$ Hz), 7,49 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,64 (1H, s), 8,05 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,11 (1H, s), 8,43 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,60 (1H, sl), 9,94 (1H, sl), 10,22 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 224

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 93, foram utilizados N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida e cloroformato de propargilo em vez de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida e cloroformato de metilo respectivamente para obter o presente composto (224) da fórmula:

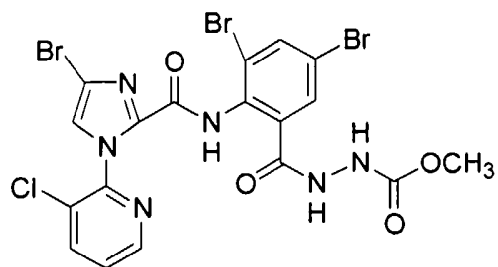


O presente composto (224)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,55 (1H, s), 4,71 (2H, s), 7,44 (1H, s), 7,56-7,64 (2H, m), 8,10 (1H, s), 8,15 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,58 (1H, sl), 10,02 (1H, sl), 10,23 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 225

Uma mistura de 0,10 g de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-imidazol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,16 g de carbazato de metilo e 10 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 1 dia. A mistura reaccional foi vertida para água e extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,080 g do presente composto (125) da fórmula:



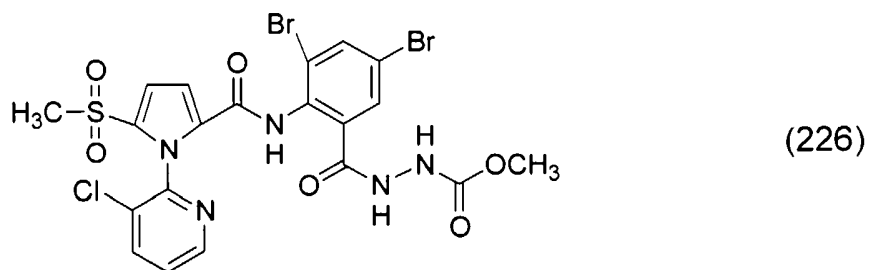
(225)

O presente composto (225)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,63 (3H, s), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,90 (1H, s), 8,04 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,11 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,24 (1H, s), 8,49 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,36 (1H, sl), 10,17 (1H, sl), 10,27 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 226

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 122, foi utilizada 6,8-dibromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-metilsulfonil-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (226) da fórmula:

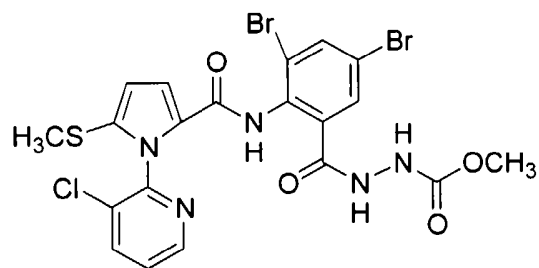


O presente composto (226)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,27 (3H, s), 3,61 (3H, s), 7,11 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,36 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,53 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,65 (1H, sl), 8,04 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,12 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,46 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,36 (1H, sl), 10,16 (1H, sl), 10,22 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 227

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 122, foi utilizada 6,8-dibromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-metiltio-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (227) da fórmula:



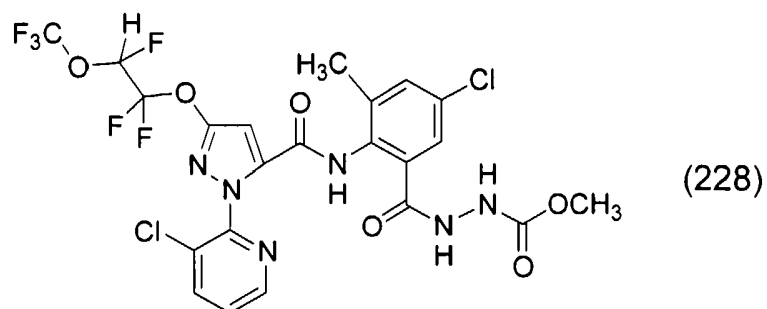
(227)

O presente composto (227)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,25 (3H, s), 3,60 (3H, s), 6,52 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,27 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,49 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,62 (1H, sl), 8,04 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,07 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,45 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 9,34 (1H, sl), 9,77 (1H, sl), 10,10 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 228

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, foi utilizada 6-cloro-2-{1-(3-cloro-2-piridinil)-3-[1,1,2-trifluoro-2-(trifluorometoxi)etoxi]-1H-pirazol-5-il}-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (228) da fórmula:

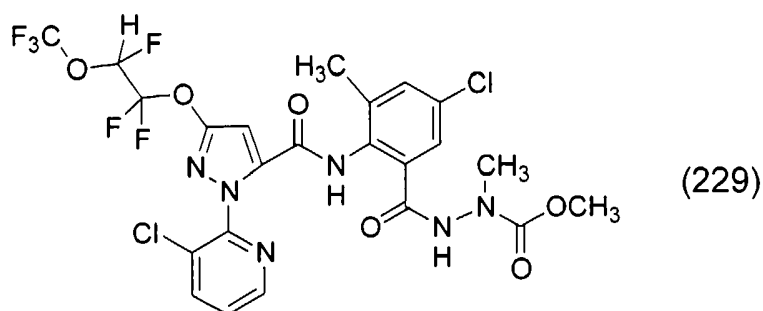


O presente composto (228)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 3,62 (3H, s), 7,20 (1H, s), 7,37 (1H, dt, $J=51$ Hz, 4 Hz), 7,38 (1H, s), 7,55 (1H, s), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,17 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,32 (1H, s), 10,16 (1H, s), 10,30 (1H, s)

Exemplo de Preparação 229

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 114, foi utilizada 6-cloro-2-{1-(3-cloro-2-piridinil)-3-[1,1,2-trifluoro-2-(trifluorometoxi)etoxi]-1H-pirazol-5-il}-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (229) da fórmula:

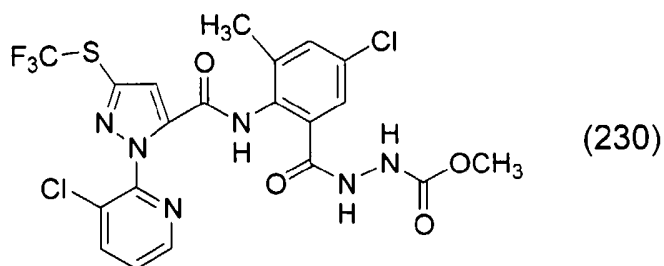


O presente composto (229)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 2,91 (3H, s), 3,47-3,68 (3H, ml), 7,24 (1H, s), 7,31 (1H, s), 7,37 (1H, dt, $J=51$ Hz, 4 Hz), 7,57 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,17 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,48 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 10,32 (1H, s), 10,53 (1H, s)

Exemplo de Preparação 230

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação 72, foi utilizada 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometiltio)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter o presente composto (230) da fórmula:

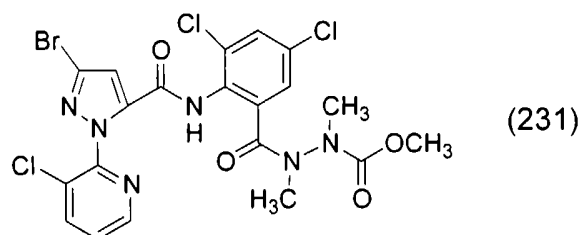


O presente composto (230)

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 3,62 (3H, sl), 7,39 (1H, sl), 7,55 (1H, s), 7,62-7,68 (2H, m), 8,20 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,52 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,32 (1H, sl), 10,16 (1H, sl), 10,36 (1H, sl)

Exemplo de Preparação 231

Uma mistura de 0,50 g de 3-bromo-N-[4,6-dicloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida, 0,18 g de cloroformato de metilo, 0,16 g de piridina e 10 mL de acetonitrilo foram misturados sob arrefecimento com gelo e a mistura foi agitada durante 3,5 horas sob arrefecimento com gelo. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com uma mistura de éter terc-butil-metílico e hexano para obter 0,47 g do presente composto (231) da fórmula:



O presente composto (231)

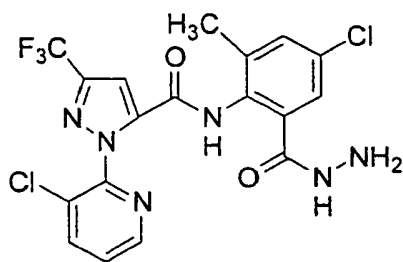
RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,73 (1,4H, s), 2,83 (1,6H, s), 2,95 (1,6H, s), 3,07 (1,4H, s), 3,49-3,68 (3,0H, m), 7,32-7,44 (2,0H, m), 7,62 (1,0H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,85 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,92 (0,5H, s), 8,19 (1,0H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,49-8,52 (1,0H, m), 10,53 (0,5H, s), 10,71 (0,5H, s)

Em seguida, serão mostrados nos Exemplos de Preparação de Referência exemplos de métodos de preparação para compostos intermediários utilizados nos Exemplos de Preparação.

Exemplo de Preparação de Referência 1

Uma mistura de 0,44 g de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,05 g de mono-hidrato de hidrazina e 10 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Depois da mistura reaccional ter sido misturada com água e acetato de etilo, as camadas foram separadas. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter

0,10 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



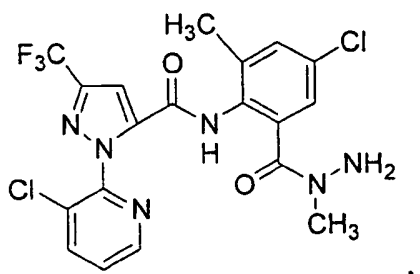
N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 4,36 (2H, s), 7,32 (1H, s), 7,48 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=4$ Hz, 8 Hz), 7,74 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,56 (1H, sl), 10,39 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 2

Uma mistura de 0,44 g de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,05 g de metil-hidrazina e 10 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Depois da mistura reaccional ter sido misturada com água e acetato de etilo, as camadas foram separadas. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,40 g de N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-

metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



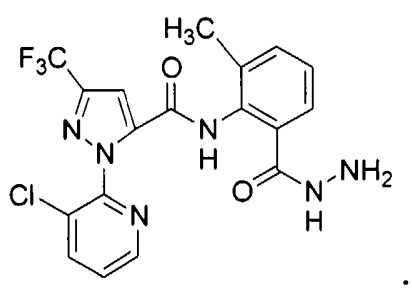
N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,17 (1,8H, s), 2,30 (1,2H, s), 2,76 (1,2H, s), 3,05 (1,8H, s), 4,54 (1,2H, sl), 4,99 (0,8H, sl), 7,16-7,23 (1H, m), 7,36 (0,6H, s), 7,46 (0,4H, s), 7,66-7,70 (2H, m), 8,24 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 10,25 (0,6H, sl), 10,51 (0,4H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 3

Uma mistura de 0,40 g de 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,09 mL de mono-hidrato de hidrazina e 20 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,26 g de

1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



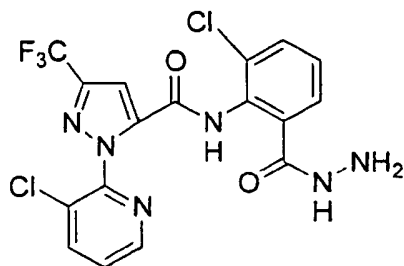
1-(3-Cloro-2-piridinil)-N-[2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 4,05 (2H, s), 7,18-7,40 (5H, m), 7,42 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,89 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,48 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 10,04 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 4

Uma mistura de 0,27 g de 8-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,025 mL de mono-hidrato de hidrazina e 10 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com um solvente misto de clorofórmio e éter t-butil-metílico para obter 0,21 g de N-[2-cloro-6-

(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

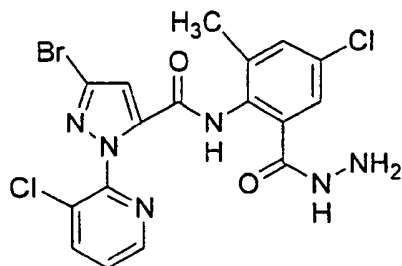


N-[2-Cloro-6-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 4,35 (2H, sl), 7,38-7,39 (2H, m), 7,61-7,66 (2H, m), 7,79 (1H, s), 8,20 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,52 (1H, s), 10,04 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 5

Uma mistura de 0,40 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,08 mL de mono-hidrato de hidrazina e 10 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. A mistura reaccional foi vertida para água e, em seguida, filtrada. O bolo de filtração resultante foi lavado com água e éter terc-butil-metílico. O bolo de filtração foi dissolvido em acetato de etilo, seco sobre sulfato de magnésio anidro e concentrado sob pressão reduzida para obter 0,35 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

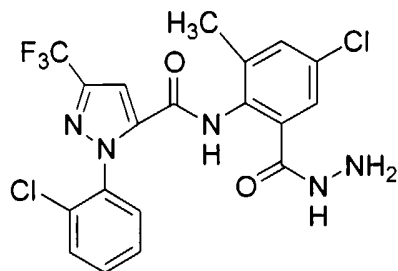


3-Bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,14 (3H, s), 4,37 (2H, sl), 7,31 (1H, s), 7,38 (1H, s), 7,47 (1H, s), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,17 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,50 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,55 (1H, sl), 10,26 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 6

Uma mistura de 0,88 g de 6-cloro-2-[1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,19 mL de mono-hidrato de hidrazina e 3 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,94 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

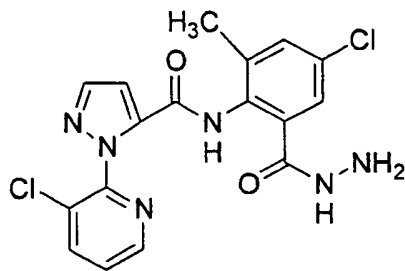


N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 4,03 (2H, sl), 7,19-7,54 (8H, m), 9,74 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 7

Uma mistura de 0,50 g de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,13 mL de mono-hidrato de hidrazina e 20 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 4 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com um solvente misto de acetato de etilo e hexano para obter 0,44 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



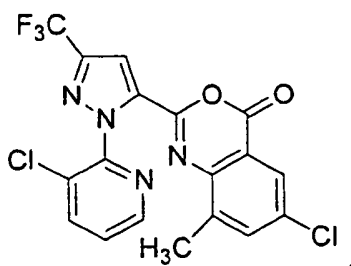
N-[4-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,19 (3H, s), 4,03 (2H, sl), 7,05 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,19 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,36 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,50 (1H, s), 7,83-7,86 (2H, m), 8,46 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,64 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 8

A uma solução de 3,1 g de cloreto de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo em 100 mL de acetonitrilo, foi adicionado 1,9 g de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 10 minutos e, em seguida, foi ali adicionado 1,0 g de trietilamina. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos e em seguida, foi ali adicionado mais 2,0 g de trietilamina. Depois da mistura ter sido agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos, foi adicionado 1,2 g de cloreto de metanossulfonilo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Depois da mistura reaccional ter sido concentrada sob pressão reduzida, foram vertidos acetato de etilo e água para o resíduo para separar camadas. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre

sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 4,2 g de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



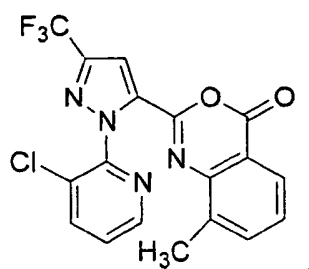
6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,73 (3H, s), 7,80 (1H, s), 7,82 (1H, dd, $J=4$ Hz, 8 Hz), 7,90 (1H, s), 7,91 (1H, s), 8,39 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,66 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 9

A uma solução de 2,0 g de cloreto de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo em 50 mL de acetonitrilo, foi adicionado 0,98 g de ácido 2-amino-3-metilbenzóico. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 10 minutos e, em seguida, foram ali adicionados 0,9 mL de trietilamina. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos e, em seguida, foram ali adicionados mais 1,8 mL de trietilamina. Depois da mistura ter sido agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos, foram adicionados

0,56 mL de cloreto de metanossulfonilo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 1,17 g de 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



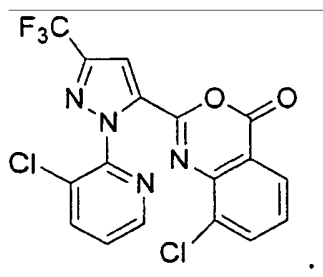
2-[1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,84 (3H, s), 7,39 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,50-7,55 (3H, m), 7,99 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,01 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,59 (1H, dd, $J=4,5$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 10

A uma solução de 0,80 g de cloreto 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo em 20 mL de acetonitrilo, foi adicionado 0,44 g de ácido 2-amino-3-clorobenzóico. A mistura foi agitada à temperatura ambiente

durante 10 minutos e, em seguida, foram ali adicionados 0,36 mL de trietilamina. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos e, em seguida, foram ali adicionados mais 0,72 mL de trietilamina. Depois da mistura ter sido agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos, foram adicionados 0,22 mL de cloreto de metanossulfonilo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 20 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 1,17 g de 8-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

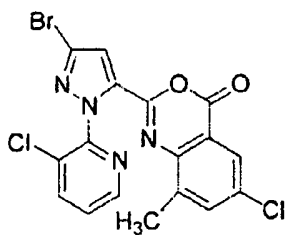


8-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,43 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,52 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,53 (1H, s), 7,75 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,00 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,11 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,57 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 11

A uma mistura de 0,44 g de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico, 6 mL de acetonitrilo e 0,20 g de trietilamina foram adicionados 0,125 mL de cloreto de metanossulfonilo. Depois da mistura resultante ter sido agitada à temperatura ambiente durante 15 minutos, foi adicionado 0,27 g de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos. À mistura, foram adicionados 0,40 mL de trietilamina. Depois da mistura ter sido agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos, foram adicionados 0,13 mL de cloreto de metanossulfonilo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 16 horas. A mistura reaccional foi filtrada e o bolo de filtração foi lavado com éter terc-butil-metílico. O bolo de filtração resultante foi dissolvido em acetato de etilo, lavado sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seco sobre sulfato de magnésio anidro e concentrado sob pressão reduzida para obter 0,098 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona. Além disso, o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida e o resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,093 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

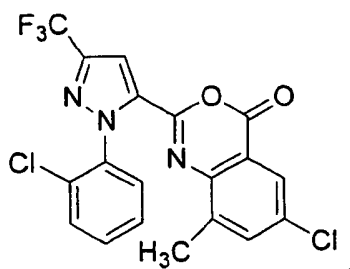


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,81 (3H, s), 7,25 (1H, s), 7,48-7,51 (2H, m), 7,95-7,98 (2H, m), 8,56 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 12

A uma mistura de 1,0 g de cloreto de 1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo e 10 mL de acetonitrilo foi adicionado 0,60 g de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico e a mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 10 minutos. À mistura, foram adicionados 0,46 mL de trietilamina. Depois da mistura ter sido agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos, foram ali adicionados mais 0,92 mL de trietilamina. Depois da mistura ter sido agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos, foram ali adicionados 0,28 mL de cloreto de metanossulfonilo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. A mistura reaccional foi filtrada e o filtrado resultante foi concentrado sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,98 g de 6-cloro-2-[1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



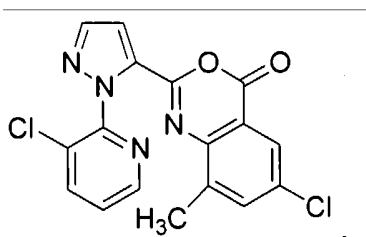
6-cloro-2-[1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,82 (3H, s), 7,45-7,60 (6H, m), 7,99 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 13

Uma mistura de 1,22 g de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico e 1,15 mL de cloreto de tionilo foi aquecida a refluxo durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi dissolvido em 15 mL de acetonitrilo e foi ali adicionado 0,27 g de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 10 minutos. À mistura foram adicionados 0,73 mL de trietilamina e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos. Foram ali adicionados mais 1,45 mL de trietilamina e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos., em seguida, foram adicionados 0,44 mL de cloreto de metanossulfonilo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram

combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com éter terc-butil-metílico para obter 0,68 g de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



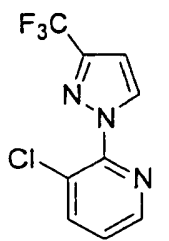
6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,82 (3H, s), 7,28 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,46-7,49 (2H, m), 7,91 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,95-7,99 (2H, m), 8,57 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 14

Uma mistura de 15,30 g de 3-trifluorometil-1H-pirazole, 16,64 g de 2,3-dicloropiridina, 26,42 g de carbonato de potássio e 100 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada a 130 °C durante 14 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e, em seguida, foi ali vertida água. A mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida. O

resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 22,88 g de 3-cloro-2-(3-trifluorometil-1H-pirazol-1-il)piridina da fórmula:



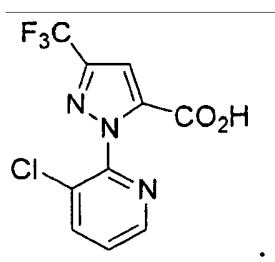
3-Cloro-2-(3-trifluorometil-1H-pirazol-1-il)piridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,75 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,37 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,95 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,14 (1H, d, $J=1$ Hz), 8,49 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 15

A uma mistura de 15 g de 3-cloro-2-(3-trifluorometil-1H-pirazol-1-il)piridina e 150 mL de tetra-hidrofurano foram adicionados, gota a gota, 39 mL de uma solução de diisopropilamida de lítio 2,0 mol/L em heptano/tetra-hidrofurano/etilbenzeno a -78°C e, em seguida, agitada a -78°C durante 15 minutos. Foi introduzido dióxido de carbono na mistura a uma velocidade tal que a temperatura interna foi mantida a -60°C ou menos. Depois da mistura ficar amarela, foi ainda agitada a -78°C durante 10 minutos. Depois de a temperatura da mistura reaccional ter sido deixada aumentar até à temperatura ambiente, foram vertidos 200 mL de água e 200 mL de hexano na mistura. A camada aquosa foi ajustada a

pH 10-12 pela adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, as camadas foram separadas. A camada orgânica foi extraída com uma solução aquosa de hidróxido de sódio 0,5 N. As camadas aquosas foram combinadas, lavadas com éter dietílico, ajustadas a cerca de pH 3 pela adição de ácido clorídrico 2 N e, em seguida, extraídas três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida para obter 16,08 g de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:



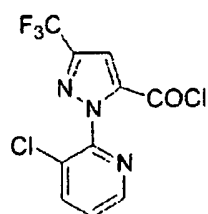
Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 7,60 (1H, s), 7,74 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,30 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,60 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 16

Uma mistura de 16,08 g de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico e 12 mL de cloreto de tionilo foi aquecida a refluxo durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e

submetida a destilação sob pressão reduzida (125 °C/3 mmHg) para obter 14,2 g de cloreto de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo da fórmula:

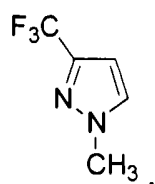


Cloreto 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,52 (1H, s), 7,52 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,97 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,53 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 17

A uma mistura de 18 g de 4-etoxi-1,1,1-trifluoro-3-buten-2-ona e 50 mL de metanol foram adicionados 5,7 mL de metilhidrazina e a mistura foi aquecida a refluxo durante 4 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente, concentrada sob pressão reduzida e submetida a destilação sob pressão reduzida (60 °C/15 mmHg) para obter 8,71 g de 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazole da fórmula:

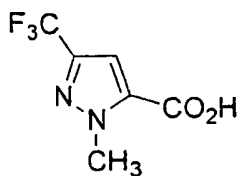


1-Metil-3-trifluorometil-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,97 (3H, s), 6,51 (1H, d, $J=2$ Hz) 7,40 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 18

A uma mistura de 8,71 g de 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazole e 130 mL de tetra-hidrofurano foram adicionados, gota a gota, 32 mL de uma solução de diisopropilamida de lítio 2,0 mol/L em heptano/tetra-hidrofurano/etilbenzeno a -78 °C. A mistura foi agitada a -78 °C durante 2 horas e, em seguida, vertida para uma mistura de gelo seco e 50 mL de tetra-hidrofurano. A mistura foi agitada durante 2 horas, enquanto se deixava aumentar até cerca da temperatura ambiente. Foram vertidos água e éter dietílico para a mistura reaccional. A camada aquosa foi ajustada a pH 10-12 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, as camadas foram separadas. A camada aquosa resultante foi lavada duas vezes com éter dietílico, ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e, em seguida, extraída três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida para obter 8,19 g de ácido 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

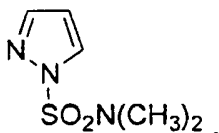


Ácido 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 4,13 (3H, s), 7,22 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 19

A uma mistura de 15 g de pirazole e 200 mL de tolueno foram adicionados, gota a gota, 23,7 mL de cloreto de dimetilsulfamóilo à temperatura ambiente. Em seguida, foram adicionados 40 mL de trietilamina à mistura e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 18 horas. A mistura reaccional foi filtrada e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 17,6 g de N,N-dimetil-1H-pirazole-1-sulfonamida da fórmula:



N,N-Dimetil-1H-pirazole-1-sulfonamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,95 (6H, s), 6,40 (1H, dd, $J=2$ Hz, $J=1$ Hz), 7,75 (1H, d, $J=1$ Hz), 7,95 (1H, d, $J=2$ Hz,).

Exemplo de Preparação de Referência 20

A uma mistura de 17,6 g de N,N-dimetil-1H-pirazole-1-sulfonamida e 200 mL de tetra-hidrofurano foram adicionados,

gota a gota, 80 mL de uma solução 1,3 M de n-butil-lítio em hexano a -78 °C e a mistura resultante foi agitada a -78 °C durante 15 minutos. À mistura, foi adicionada, gota a gota, uma solução de 35,8 g de 1,2-dibromo-1,1,2,2-tetracloroetano em 60 mL de tetra-hidrofurano e a mistura resultante foi agitada a -78 °C durante 15 minutos. A mistura reaccional foi trazida até à temperatura ambiente e agitada durante 1 hora. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 21,3 g de 5-bromo-N,N-dimetil-1H-pirazole-1-sulfonamida da fórmula:



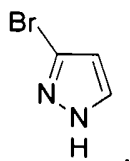
5-Bromo-N,N-dimetil-1H-pirazole-1-sulfonamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,08 (6H, s), 6,43 (1H, m), 7,61 (1H, m).

Exemplo de Preparação de Referência 21

Uma mistura de 21,3 g de 5-bromo-N,N-dimetil-1H-pirazole-1-sulfonamida e 30 mL de ácido trifluoroacético foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Depois de ter sido vertido hexano para a mistura reaccional, a mistura foi filtrada. Depois

de ter sido adicionado éter terc-butil-metílico ao filtrado resultante, a mistura foi lavada sucessivamente com uma solução aquosa saturada de hidrogenocarbonato de sódio, água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio e concentrada sob pressão reduzida para obter 10,7 g de 3-bromo-1H-pirazole da fórmula:

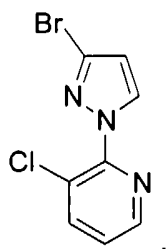


3-Bromo-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,37 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,55 (1H, d, $J=2$ Hz), 12,6 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 22

Uma mistura de 10,7 g de 3-bromo-1H-pirazole, 11,8 g de 2,3-dicloropiridina, 57,3 g de carbonato de césio e 80 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada a 100 °C durante 8 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e foi ali vertida água. A mistura foi extraída duas vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 12,9 g de 2-(3-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina da fórmula:



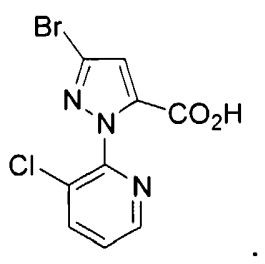
2-(3-Bromo-1H-pirazole-1-il)-3-cloropiridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,51 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,31 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,91 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,04 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,45 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 23

A uma mistura de 9,2 g de 2-(3-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina e 80 mL de tetra-hidrofurano foram adicionados, gota a gota, 21,3 mL de uma solução de diisopropilamida de lítio 2,0 M em heptano/tetra-hidrofurano/etilbenzeno a -78 °C. A mistura resultante foi agitada a -78 °C durante 15 minutos, vertida para uma mistura de gelo seco e 50 mL de tetra-hidrofurano e agitada durante 1 hora deixando-a subir até próximo da temperatura ambiente. Depois de terem sido vertidos água e éter dietílico para a mistura reaccional, a camada aquosa foi ajustada a pH 10-12 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e as camadas foram separadas. A camada aquosa resultante foi lavada duas vezes com éter dietílico, ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e extraída três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa

saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida para obter 7,96 g de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:



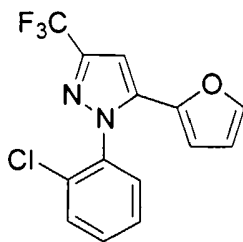
Ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 7,25 (1H, s), 7,68 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,24 (1H, dd, $J=8$ Hz, $J=1$ Hz), 8,56 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 24

A uma mistura de 12,96 g de 4,4,4-trifluoro-1-(2-furil)-1,3-butanodiona, 8,56 g de acetato de sódio e 40 mL de ácido acético foi adicionado 11,26 g de cloridrato de 2-clorofenil-hidrazina à temperatura ambiente. A mistura foi agitada a 60 °C durante 1 hora e concentrada sob pressão reduzida. Depois da mistura reaccional ter sido concentrada sob pressão reduzida e ter sido vertida água para o resíduo, a mistura foi extraída três vezes com clorofórmio. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob

pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 18,43 g de 1-(2-clorofenil)-5-(2-furil)-3-trifluorometil-1H-pirazole da fórmula:



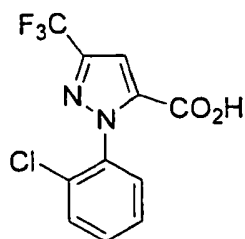
1-(2-Clorofenil)-5-(2-furil)-3-trifluorometil-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 5,76 (1H, d, $J=3$ Hz), 6,31 (1H, dd, $J=3$ Hz, 2 Hz), 6,95 (1H, s), 7,40 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,43-7,59 (4H, m).

Exemplo de Preparação de Referência 25

Uma solução aquosa de 27,94 g de permanganato de potássio em 100 mL de água foi adicionada, gota a gota, a uma mistura de 18,43 g de 1-(2-clorofenil)-5-(2-furil)-3-trifluorometil-1H-pirazole e 250 mL de acetona mantendo a 40 °C ou menos. Em seguida, a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 20 horas. A mistura reaccional foi filtrada através de Celite (marca registrada) para obter a filtrado. O filtrado foi ajustado a pH 10-12 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, extraído duas vezes com acetato de etilo. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e, em seguida, extraída três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas,

lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida para obter 10,65 g de ácido 1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

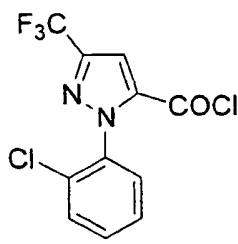


Ácido 1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,33 (1H, s), 7,42-7,54 (4H, m)

Exemplo de Preparação de Referência 26

Uma mistura de 10,65 g de ácido 1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico e 8 mL de cloreto de tionilo foi aquecida a refluxo durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente, concentrada sob pressão reduzida e submetida a destilação sob pressão reduzida (110 °C/5 mmHg) para obter 8,39 g de cloreto de 1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo da fórmula:

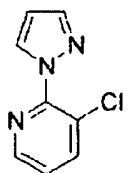


Cloreto de 1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carbonilo

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,42-7,57 (5H, m).

Exemplo de Preparação de Referência 27

Uma mistura de 2 g de pirazole, 4,34 g de 2,3-dicloropiridina, 9,58 g de carbonato de césio e 40 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada a 100 °C durante 8 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e foi ali adicionada água. A mistura foi extraída três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 3,57 g de 3-cloro-2-(1H-pirazol-1-il)piridina da fórmula:

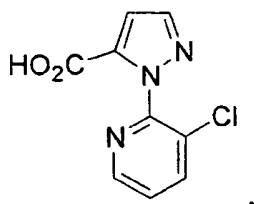


3-Cloro-2-(1H-pirazole-1-il)piridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,50 (1H, dd, $J=2$ Hz, 1 Hz), 7,28 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,83 (1H, d, $J=1$ Hz), 7,92 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,17 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,46 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 28

A uma mistura de 2,0 g de 3-cloro-2-(1H-pirazol-1-il)piridina e 100 mL de tetra-hidrofurano foram adicionados, gota a gota, 6,7 mL de uma solução de diisopropilamida de lítio 2,0 mol/L em heptano/tetra-hidrofurano/etilbenzeno a -78 °C. A mistura foi agitada a -78 °C durante 10 minutos, vertida numa mistura de gelo seco e 50 mL de tetra-hidrofurano, e agitada durante 0,5 horas, deixando-a subir até próximo da temperatura ambiente. Depois de terem sido adicionados água e éter dietílico à mistura reaccional, a camada aquosa foi ajustada a pH 10-12 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e as camadas foram separadas. Depois de a camada aquosa ter sido lavada duas vezes com éter dietílico, a camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e a mistura foi extraída três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida para obter 1,22 g de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

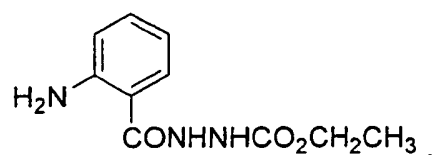


Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,10 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,42 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,82 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,91 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 29

Uma mistura de 16,3 g de anidrido isatóico, 10,4 g de carbazato de etilo e 50 mL de etanol foi aquecida a refluxo durante 3 horas. Depois da mistura reaccional ter sido deixada arrefecer até próximo da temperatura ambiente, foi ali adicionado acetato de etilo e a mistura foi lavada duas vezes com água. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com éter terc-butil-metílico para obter 14,9 g de N-(2-aminobenzoil)-N'-etoxycarbonil-hidrazina da fórmula:

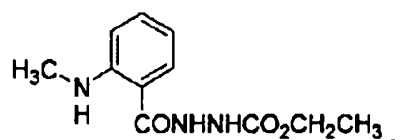


N-(2-Aminobenzoil)-N'-etoxycarbonil-hidrazina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,28 (3H, t, $J=8$ Hz), 4,22 (2H, q, $J=8$ Hz), 5,45 (2H, sl), 6,63-6,68 (2H, m), 6,85 (1H, sl), 7,22 (1H, sl), 7,43 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,95 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 30

Uma mistura de 8,86 g de anidrido N-metilisatóico, 5,73 g de carbazato de etilo e 25 mL de etanol foi aquecida a refluxo durante 2 horas. Depois da mistura reaccional ter sido deixada até próximo da temperatura ambiente, foi ali adicionado acetato de etilo e a mistura foi lavada duas vezes com água. A camada orgânica foi seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com éter terc-butil-metílico para obter 5,99 g de N-(2-metilaminobenzoil)-N'-etoxycarbonil-hidrazina da fórmula:

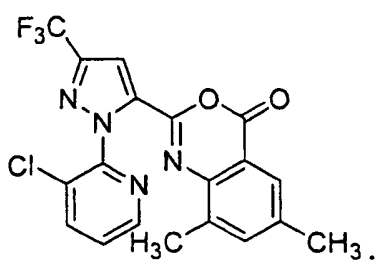


N-(2-metilaminobenzoil)-N'-etoxycarbonil-hidrazina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,28 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,85 (3H, d, $J=5$ Hz), 4,21 (2H, q, $J=7$ Hz), 6,55-6,59 (1H, m), 6,66 (1H, d, $J=8$ Hz), 6,78 (1H, sl), 7,29-7,37 (2H, m), 7,43 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 7,91 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 31-(1)

Uma mistura de 1,0 g de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico e 2 mL de cloreto de tionilo foi aquecida a refluxo durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi dissolvido em 15 mL de acetonitrilo e foi ali adicionado 0,49 g de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos. À mistura, foram adicionados 0,7 mL de trietilamina e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos. Foram adicionados mais 1,4 mL de trietilamina e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos. Em seguida, foram adicionados 0,5 mL de cloreto de metanossulfonilo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 5 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com água e éter terc-butil-metílico para obter 0,71 g de 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-dimetil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

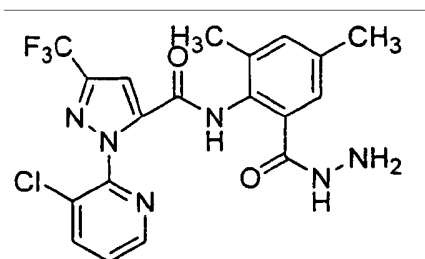


2-[1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-dimetil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,72 (3H, s), 2,37 (3H, s), 7,54 (1H, s), 7,77 (1H, s), 7,78-7,85 (2H, m), 8,39 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,66 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 31-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-dimetil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4,6-dimetil-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

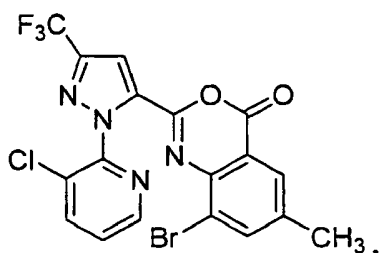


N-[4,6-dimetil-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,11 (3H, s), 2,27 (3H, s), 4,34 (2H, sl), 7,11 (1H, s), 7,17 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,74 (1H, s), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,37 (1H, sl), 10,26 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 32-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-bromo-5-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 8-bromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



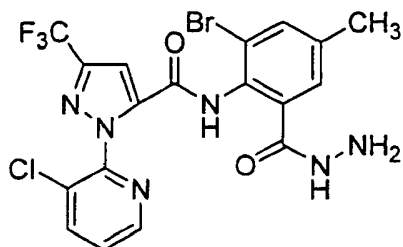
8-Bromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,41 (3H, s), 7,77 (1H, dd, J=8 Hz, 4 Hz), 7,87 (1H, s), 7,93 (1H, s), 7,98 (1H, s), 8,36 (1H, d, J=8 Hz), 8,63 (1H, d, J=4 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 32-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 8-bromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[6-bromo-2-(hidrazinocarbonil)-4-metilfenil]-1-(3-

cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

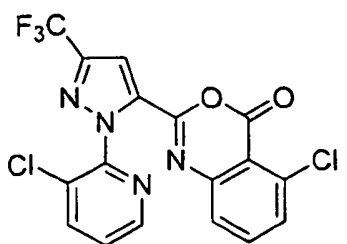


N-[6-Bromo-2-(hidrazinocarbonil)-4-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,31 (3H, s), 4,33 (2H, sl), 7,24 (1H, s), 7,43 (1H, s), 7,57-7,65 (2H, m), 8,15 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,38 (1H, sl), 10,31 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 33-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-6-clorobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 5-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

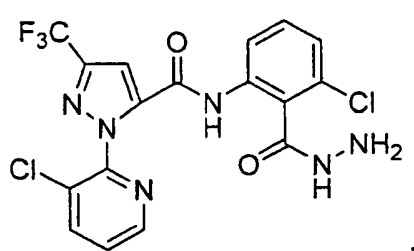


5-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,91 (1H, d, J=8 Hz), 7,68 (1H, d, J=8 Hz), 7,77 (1H, t, J=8 Hz), 7,83 (1H, dd, J=8 Hz, 4 Hz), 7,91 (1H, s), 8,37 (1H, d, J=8 Hz), 8,64 (1H, d, J=4 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 33-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 5-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[3-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

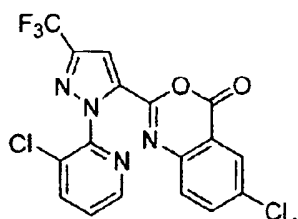


N-[3-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 4,47 (2H, sl), 7,32-7,50 (3H, m), 7,65-7,75 (2H, m), 8,25 (1H, d, J=8 Hz), 8,56 (1H, d, J=4 Hz), 9,58 (1H, sl), 10,29 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 34-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-5-clorobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

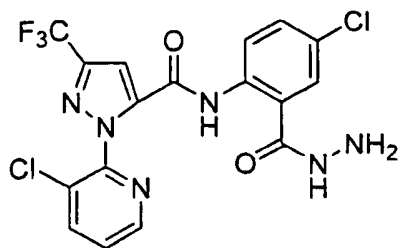


6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,02 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,83 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,87-7,92 (2H, m), 8,08 (1H, s), 8,37 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,64 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 34-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

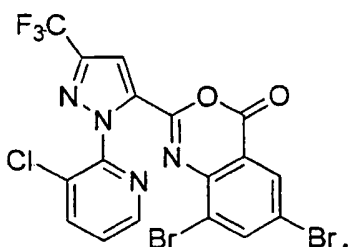


N-[4-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,52-7,56 (2H, m), 7,73 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,85 (1H, s), 8,19 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,29 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,58 (1H, d, $J=4$ Hz), 10,30 (1H, sl), 12,52 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 35-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

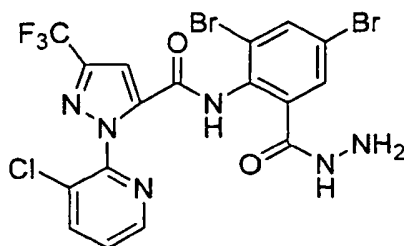


2-[1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,77 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,94 (1H, s), 8,19-8,21 (1H, m), 8,35-8,39 (2H, m), 8,63 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 35-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



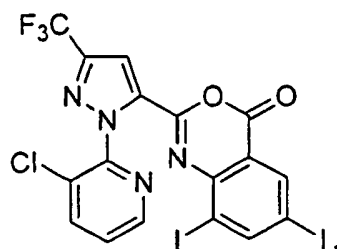
N-[4,6-Dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 4,40 (2H, sl), 7,61 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,79 (1H, s), 8,08 (1H, s),

8,21 (1H, d, J=8 Hz), 8,54 (1H, d, J=4 Hz), 9,60 (1H, sl), 10,62 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 36-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3,5-diiodobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-diiodo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



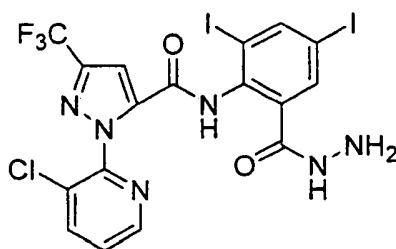
2-[1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-diiodo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,74 (1H, dd, J=8 Hz, 4 Hz), 7,89 (1H, s), 8,31-8,35 (2H, m), 8,59-8,63 (2H, m).

Exemplo de Preparação de Referência 36-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-diiodo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

para obter N-[4,6-diiodo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

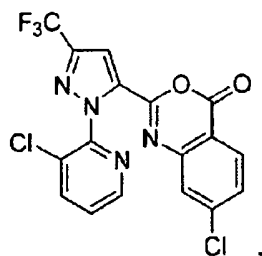


N-[4,6-Diiodo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 4,39 (2H, sl), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,71 (1H, s), 7,79 (1H, s), 8,20 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,33 (1H, s), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,51 (1H, sl), 10,58 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 37-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-4-clorobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 7-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

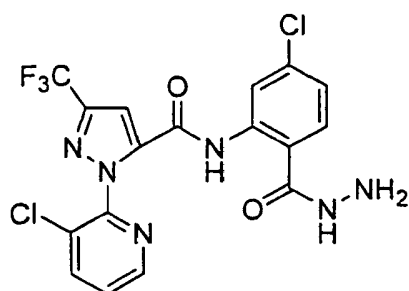


7-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,02 (1H, s), 7,68 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,84 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,91 (1H, s), 8,10 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,38 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,64 (1H, d, $J=4$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 37-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 7-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[5-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

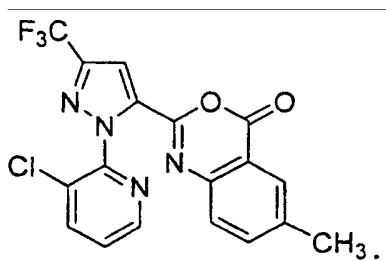


N-[5-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,31 (1H, d, J=8 Hz), 7,55 (1H, s), 7,75 (1H, dd, J=8 Hz, 4 Hz), 7,82 (1H, d, J=8 Hz), 8,27 (1H, s), 8,31 (1H, d, J=8 Hz), 8,59 (1H, d, J=4 Hz), 10,32 (1H, sl), 12,86 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 38-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-5-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

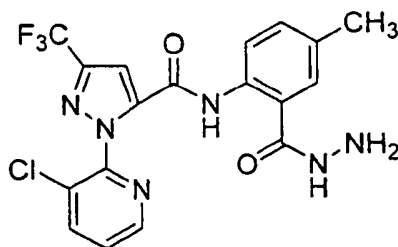


2-[1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,43 (3H, s), 6,94 (1H, d, J=8 Hz), 7,69 (1H, d, J=8 Hz), 7,80-7,85 (2H, m), 7,92 (1H, s), 8,36 (1H, d, J=8 Hz), 8,63 (1H, d, J=4 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 38-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[2-(hidrazinocarbonil)-4-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

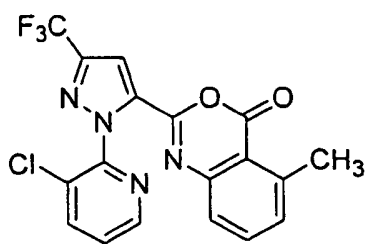


N-[2-(Hidrazinocarbonil)-4-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,29 (3H, s), 4,71 (2H, sl), 7,29 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,51-7,54 (1H, m), 7,61-7,63 (1H, m), 7,72-7,74 (1H, m), 8,07 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,29 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,56-8,59 (1H, m), 10,13 (1H, sl), 12,52 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 39-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-6-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-5-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

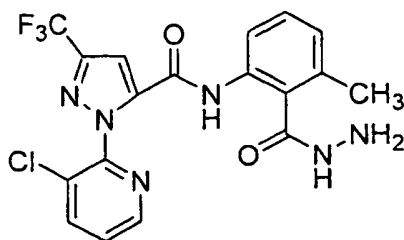


2-[1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-5-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,68 (3H, s), 6,82 (1H, d, $J=8$ Hz) 7,44 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,70 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,82 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,85 (1H, s), 8,36 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,64 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 39-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-5-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[2-(hidrazinocarbonil)-3-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

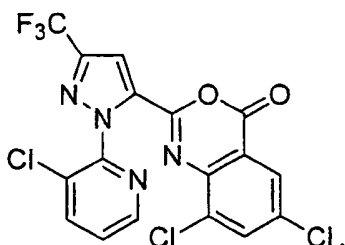


N-[2-(Hidrazinocarbonil)-3-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,27 (3H, s), 4,48 (2H, sl), 7,11 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,24-7,35 (2H, m), 7,65-7,72 (2H, m), 8,25 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,55 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,35 (1H, sl), 10,15 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 40-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3,5-diclorobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

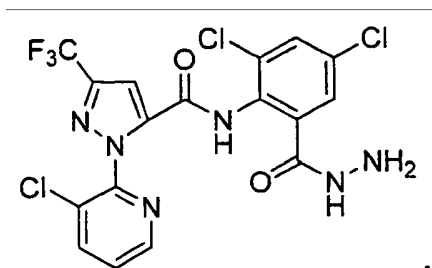


2-[1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,78 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,95 (1H, s), 8,06 (1H, s), 8,14 (1H, s), 8,37 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,63 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 40-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4,6-dicloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



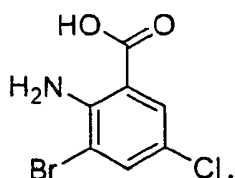
N-[4,6-Dicloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 4,38 (2H, sl), 7,47 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,79 (1H, s), 7,86 (1H, s), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,64 (1H, sl), 10,63 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 41-(1)

A uma mistura de 1,7 g de ácido 2-amino-5-clorobenzóico e 100 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 1,8 g de N-bromossuccinimida à temperatura ambiente e a mistura foi

agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e foi recolhido um precipitado depositado por filtração para obter 1,1 g de ácido 2-amino-3-bromo-5-clorobenzóico da fórmula:

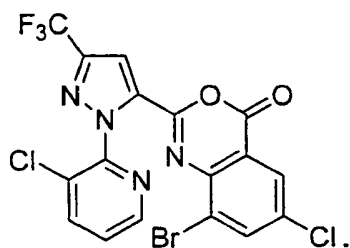


Ácido 2-amino-3-bromo-5-clorobenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,87 (2H, sl), 7,74 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,76 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 41-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-bromo-5-clorobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 8-bromo-6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

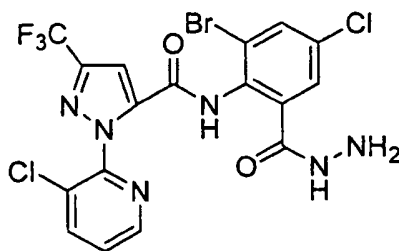


8-Bromo-6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,77 (1H, dd, $J=8, 5$ Hz), 7,94 (1H, s), 8,10 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,27 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,37 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,63 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 41-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 8-bromo-6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4-H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[6-bromo-4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



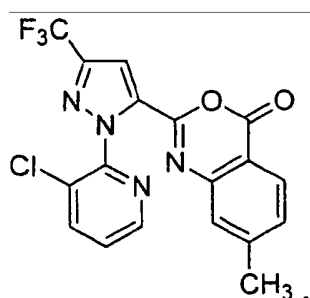
N-[6-Bromo-4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 4,35 (2H, sl), 7,50 (1H, s), 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,79 (1H, s), 7,98 (1H, s),

8,21 (1H, d, J=8 Hz), 8,53 (1H, d, J=4 Hz), 9,60 (1H, sl), 10,63 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 42-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-4-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-7-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



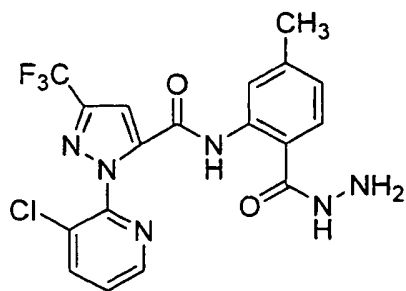
2-[1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-7-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,41 (3H, s), 6,84 (1H, s), 7,46 (1H, d, J=8 Hz), 7,82-7,85 (2H, m), 8,00 (1H, d, J=8 Hz), 8,37 (1H, d, J=8 Hz), 8,64 (1H, d, J=4 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 42-(2)

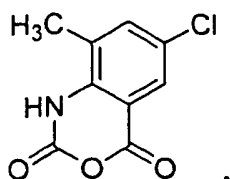
De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-7-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[2-(hidrazinocarbonil)-5-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



Exemplo de Preparação de Referência 43-(1)

Uma mistura de 1,85 g de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico, 0,90 g de trifosgênio e 10 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 5 horas. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida e um cristal precipitado foi lavado com água para obter 1,20 g de 6-cloro-8-metil-1H-benzo[d]-1,3-oxazina-2,4-diona da fórmula:

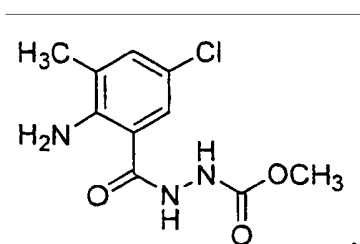


6-Cloro-8-metil-1H-benzo[d]-1,3-oxazina-2,4-diona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,33 (3H, s), 7,69 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,73 (1H, d, $J=2$ Hz), 11,18 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 43-(2)

Uma mistura de 1,05 g de 6-cloro-8-metil-1H-benzo[d]-1,3-oxazina-2,4-diona, 0,46 g de carbazato de metilo e 20 mL de metanol foi aquecida a refluxo durante 3 horas. Depois da mistura reaccional ter sido deixada arrefecer até próximo da temperatura ambiente, foi ali vertida água e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. A camada orgânica resultante foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo foi lavado com tolueno para obter 0,77 g de N-(2-amino-5-cloro-3-metilbenzoil)-N'-metoxycarbonil-hidrazina da fórmula:



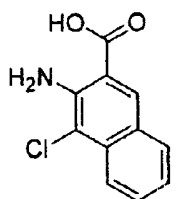
N-(2-Amino-5-cloro-3-metilbenzoil)-N'-etoxycarbonil-hidrazina

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,10 (3H, s), 3,63 (3H, s), 6,32 (2H, sl), 7,19 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,45 (1H, d, $J=2$ Hz), 9,14 (1H, sl), 10,12 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 44-(1)

A uma mistura de 1,9 g de ácido 3-amino-2-naftóico e 100 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionada 1,3 g de N-clorossuccinimida à temperatura ambiente e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Depois de ter

sido adicionada água à mistura reaccional, um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 1,3 g de ácido 3-amino-4-cloro-2-naftóico da fórmula:

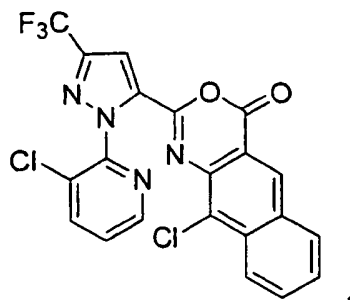


Ácido 3-amino-4-cloro-2-naftóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,27-7,31 (1H, m), 7,60-7,64 (1H, m), 7,88 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,93 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 44-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 3-amino-4-cloro-2-naftóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 10-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona da fórmula:

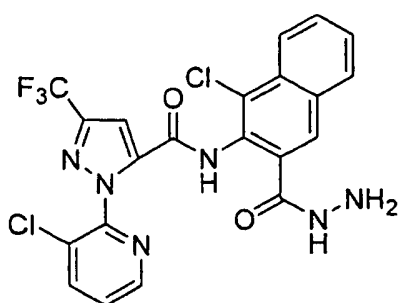


10-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,77 (1H, t, $J=7$ Hz), 7,84 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,87-7,94 (2H, m), 8,24 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,35 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,42 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,67 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,91 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 44-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 10-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[1-cloro-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



N-[1-Cloro-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO-d_6 , TMS) δ (ppm): 4,39 (2H, sl), 7,65 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,70 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,78 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,86 (1H, s), 8,05-8,11 (2H, m), 8,18-8,24 (2H, m), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,70 (1H, sl), 10,77 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 45-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 44-(1), foi utilizada N-bromossuccinimida em vez de N-clorossuccinimida para obter ácido 3-amino-4-bromo-2-naftóico da fórmula:



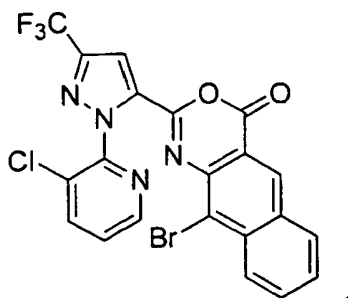
Ácido 3-amino-4-bromo-2-naftóico

RMN de ^1H (DMSO-d_6 , TMS) δ (ppm): 7,28 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,61 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,86 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,92 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,57 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 45-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 3-amino-4-bromo-2-naftóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter

10-bromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona da fórmula:

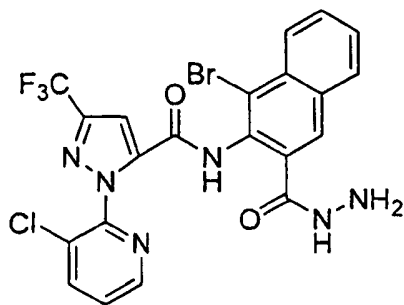


10-Bromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,76 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,82 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,87-7,94 (2H, m), 8,24 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,34 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,42 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,67 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,95 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 45-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 10-bromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[1-bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



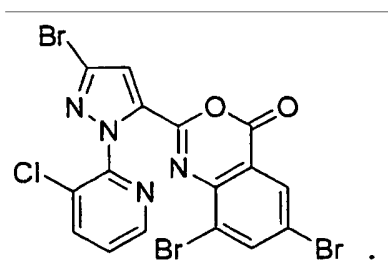
N-[1-Bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 4,37 (2H, sl), 7,64 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,70 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,77 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,87 (1H, s), 8,05-8,10 (2H, m), 8,17-8,24 (2H, m), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,66 (1H, sl), 10,80 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 46-(1)

Uma mistura de 11,0 g de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico e 2 mL de cloreto de tionilo foi aquecida a refluxo durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi dissolvido em 15 mL de acetonitrilo e foi adicionado 0,88 g de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos. À mistura foram adicionados 0,7 mL de trietilamina. Depois da mistura ter sido agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos, foram adicionados mais 1,4 mL de trietilamina. Depois da mistura ter sido agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos, foram adicionados 0,5 mL de cloreto de metanossulfonilo e a mistura

foi agitada à temperatura ambiente durante 5 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com água e éter terc-butil-metílico para obter 0,80 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

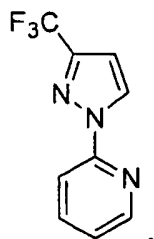


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,56 (1H, s), 7,71 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,18 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,32 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,35 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,59 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 47-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 14, foi utilizada 2-cloropiridina em vez de 2,3-dicloropiridina para obter 2-(3-trifluorometil-1H-pirazol-1-il)piridina da fórmula:

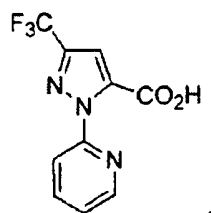


2-(3-Trifluorometil-1H-pirazol-1-il)piridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,71 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,27-7,28 (1H, m), 7,86 (1H, t, $J=8$ Hz), 8,04 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,44 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,63 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 47-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 15, foi utilizada 2-(3-trifluorometil-1H-pirazol-1-il)piridina em vez de 3-cloro-2-(3-trifluorometil-1H-pirazol-1-il)piridina para obter ácido 1-(2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

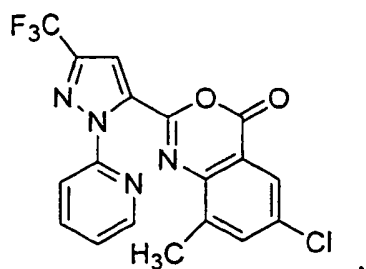


Ácido 1-(2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 7,47 (1H, s), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,78 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,09 (1H, t, $J=8$ Hz), 8,55 (1H, d, $J=5$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 47-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-(2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-(2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

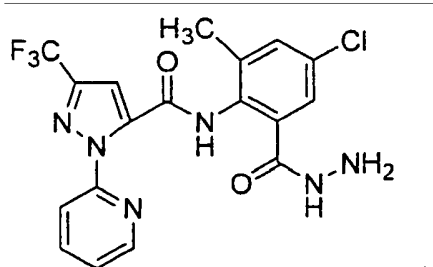


6-Cloro-2-[1-(2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 7,26 (1H, s), 7,42 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,58 (1H, s), 7,79 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,96-8,00 (2H, m), 8,43 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 47-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 6-cloro-2-[1-(2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



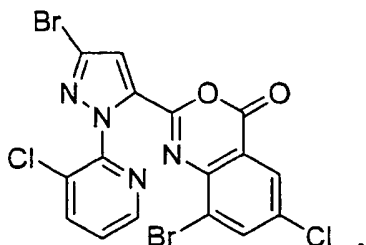
N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,31 (3H, s), 4,44 (2H, s), 7,34-7,35 (2H, m), 7,50-7,55 (2H, m), 7,81 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,07 (1H, t, $J=8$ Hz), 8,48 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,55 (1H, sl), 10,39 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 48-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-bromo-5-clorobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para

obter 8-bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

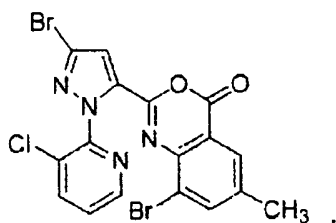


8-Bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,56 (1H, s), 7,72 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,08 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,25 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,32 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,59 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 49-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-bromo-5-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 8-bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

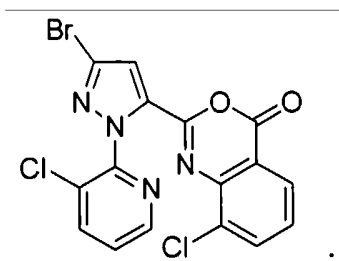


8-Bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,40 (3H, s), 7,50 (1H, s), 7,71 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,91 (1H, s), 7,96 (1H, s), 8,31 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,59 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 50

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-clorobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

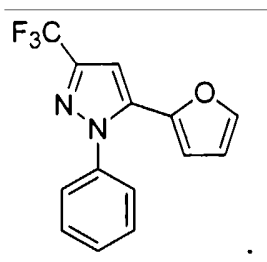


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,52-7,61 (2H, m), 7,73 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,93 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,04 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,32 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,60 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 51-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 24, foi utilizada fenil-hidrazina em vez de 2-clorofenil-hidrazina para obter 5-(2-furil)-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazole da fórmula:

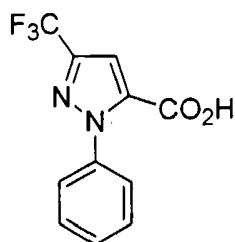


5-(2-Furil)-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 5,96 (1H, d, $J=4$ Hz), 6,33 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz), 6,90 (1H, s), 7,43-7,48 (6H, m).

Exemplo de Preparação de Referência 51-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 25, foi utilizado 5-(2-furil)-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazole em vez de 5-(2-furil)-1-(2-clorofenil)-3-trifluorometil-1H-pirazole para obter ácido 1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

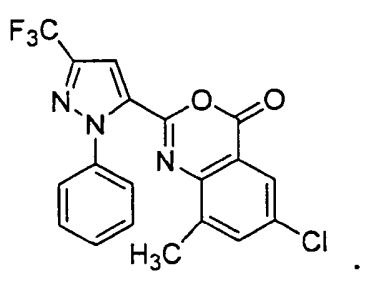


Ácido 1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,29 (1H, s), 7,46-7,51 (5H, m)

Exemplo de Preparação de Referência 51-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-(1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

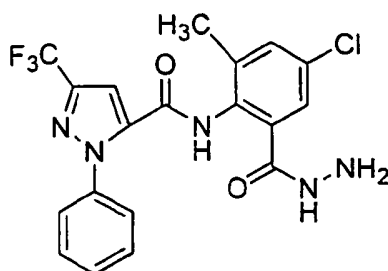


6-Cloro-2-(1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,88 (3H, s), 7,47-7,54 (7H, m), 7,99 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 51-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 6-cloro-2-(1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

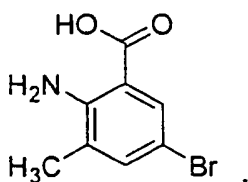


N-[4-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-fenil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 2,19 (3H, s), 4,41 (2H, sl), 7,32 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,46-7,52 (5H, m), 7,56 (2H, d, $J=7$ Hz), 9,61 (1H, sl), 10,29 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 52-(1)

A uma mistura de 1,5 g de ácido 2-amino-5-clorobenzóico e 100 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 1,8 g de N-bromossuccinimida à temperatura ambiente e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Depois de terem sido vertidos 30 mL de água para a mistura reaccional, a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 1,2 g de ácido 2-amino-5-bromo-3-metilbenzóico da fórmula:

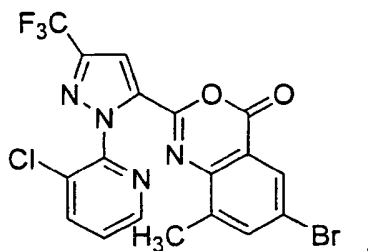


Ácido 2-amino-5-bromo-3-metilbenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,11 (3H, s), 7,33 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,68 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 52-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-5-bromo-3-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 6-bromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

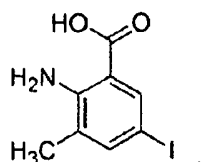


6-Bromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,73 (3H, s), 7,81 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,90 (1H, s), 7,93 (1H, s), 8,04 (1H, t, $J=1$ Hz), 8,39 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,66 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 53-(1)

A uma mistura de 2,6 g de ácido 2-amino-3-metilbenzóico e 100 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 2,3 g de N-iodossuccinimida à temperatura ambiente e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Depois de ter sido vertida água na mistura reaccional, um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 1,7 g de ácido 2-amino-5-iodo-3-metilbenzóico da fórmula:

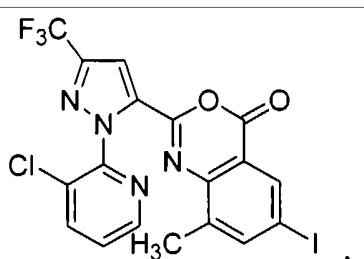


Ácido 2-amino-5-iodo-3-metilbenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,08 (3H, s), 7,44 (1H, d, $J=1$ Hz), 7,86 (1H, d, $J=1$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 53-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 31-(1), foi utilizado ácido 2-amino-5-iodo-3-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dimetilbenzóico para obter 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6-iodo-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



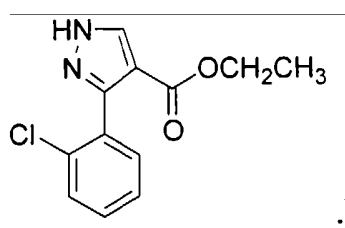
2-[1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-6-iodo-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,70 (3H, s), 7,81 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,89 (1H, s), 8,07 (1H, s), 8,19 (1H, s), 8,39 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,66 (1H, d, $J=4$ Hz).

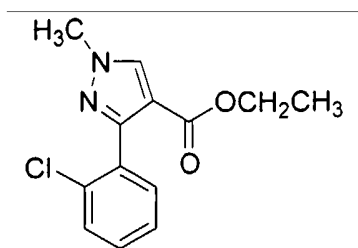
Exemplo de Preparação de Referência 54-(1)

Uma mistura de 1,41 g de 2-(2-clorobenzoil)-3-(N,N-dimetilamino)acrilato de etilo (um composto descrito no documento JP-A 7-101940), 0,30 g de mono-hidrato de hidrazina e

5 mL de ácido acético foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida. Foi vertida água para o resíduo e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida para obter 3-(2-clorofenil)-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo da fórmula:



O 3-(2-clorofenil)-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo resultante, 1,07 g de iodeto de metilo, 1,04 g de carbonato de potássio e 5 mL de N,N-dimetilformamida foram misturados sob arrefecimento com gelo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,72 g de 3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo da fórmula:



e 0,48 g de 5-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo.

3-(2-Clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo

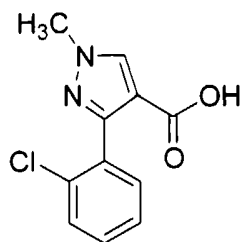
RMN de ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 1,12 (3H, t, $J=7$ Hz), 3,68 (3H, s), 4,09-4,15 (2H, m), 7,31 (1H, dd, $J=7$ Hz, 2 Hz), 7,38 (1H, td, $J=7$ Hz, 1 Hz), 7,44 (1H, td, $J=8$ Hz, 2 Hz), 7,52 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,01 (1H, s).

5-(2-Clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo

RMN de ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 1,13 (3H, t, $J=7$ Hz), 3,98 (3H, s), 4,14 (2H, q, $J=7$ Hz), 7,27-7,35 (2H, m), 7,38-7,41 (1H, m), 7,43-7,45 (1H, m), 7,96 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 54-(2)

Uma mistura de 0,72 g de 3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo, 0,23 g de hidróxido de potássio, 1 mL de água e 5 mL de etanol foi agitada à temperatura ambiente durante 3 dias. Depois da mistura reaccional ter sido concentrada sob pressão reduzida, foi vertida água para o resíduo resultante e a mistura foi lavada com éter terc-butil-metílico. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido cítrico aquoso a 10% e, em seguida, extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida para obter 0,61 g de ácido 3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxílico da fórmula:



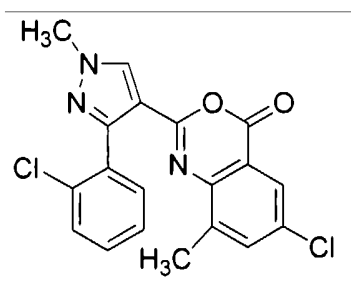
Ácido 3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 3,66 (3H, s), 7,30 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 7,37 (1H, td, $J=8$ Hz, 1 Hz), 7,43 (1H, td, $J=8$ Hz, 2 Hz), 7,51 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,02 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 54-(3)

Uma mistura de 0,61 g de ácido 3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxílico, 0,28 mL de cloreto de tionilo e 10 mL de tolueno foi aquecida a refluxo durante 1 hora. Depois da mistura reaccional ter sido deixada arrefecer até à temperatura ambiente, foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo resultante foi dissolvido em 10 mL de acetonitrilo. Foi ali adicionado 0,48 g de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico e a mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos. À mistura, foi adicionado 0,26 g de trietilamina, a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos. Foi ali adicionado mais 0,52 g de trietilamina e a mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos. Em seguida, foi adicionado 0,30 g de cloreto de metanossulfonilo à mistura reaccional sob arrefecimento com gelo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Foram vertidos água e acetato de etilo para a mistura reaccional e foi recolhido 0,26 g de um sólido por filtração.

Adicionalmente, o filtrado foi separado em duas camadas. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com acetato de etilo para obter 0,25 g de um sólido. Ambos estes sólidos eram 6-cloro-2-[3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazol-4-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



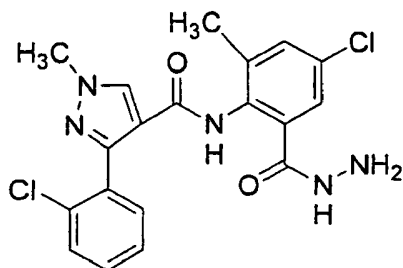
6-Cloro-2-[3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazol-4-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 1,86 (3H, s), 3,68 (3H, s), 7,52-7,63 (3H, m), 7,69-7,72 (2H, m), 7,81 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,18 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 54-(4)

Depois de 0,19 g de 6-cloro-2-[3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazol-4-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,10 g de monohidrato de hidrazina e 10 mL de N-metilpirrolidinona terem sido misturados sob arrefecimento com gelo, a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 8 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida para obter

0,18 g de N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxamida da fórmula:

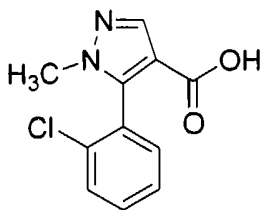


N-[4-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 3,60 (3H, s), 4,39 (2H, sl), 7,29 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,42-7,53 (4H, m), 7,60 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,11 (1H, s), 9,53 (2H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 55-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 54-(2), foi utilizado 5-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo em vez de 3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo para obter ácido 5-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxílico da fórmula:

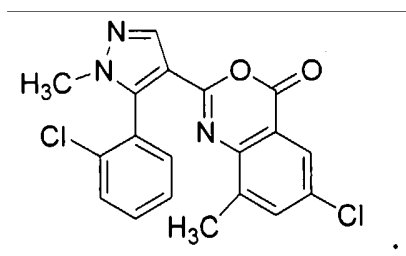


Ácido 5-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 3,97 (3H, s), 7,26-7,35 (2H, m), 7,37-7,39 (1H, m), 7,42-7,44 (1H, m), 7,98 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 55-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 54-(3), foi utilizado ácido 5-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxílico em vez de ácido 3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxílico para obter 6-cloro-2-[5-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazol-4-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

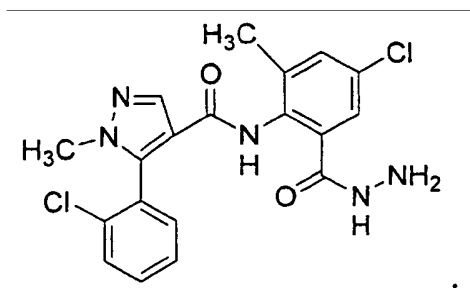


6-Cloro-2-[5-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazol-4-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 1,90 (3H, s), 3,99 (3H, s), 7,40-7,50 (3H, m), 7,56 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,71 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,82 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,63 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 55-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 54-(4), foi utilizada 6-cloro-2-[5-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazol-4-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazol-4-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-5-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxamida da fórmula:



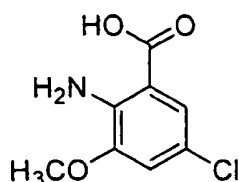
N-[4-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-5-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 3,94 (3H, s), 4,39 (2H, sl), 7,30 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,33-7,46 (5H, m), 8,36 (1H, s), 9,49-9,59 (2H, ml).

Exemplo de Preparação de Referência 56-(1)

A uma mistura de 1,67 g de ácido 2-amino-3-metoxibenzóico e 100 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 1,3 g de N-clorossuccinimida à temperatura ambiente e a mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado

depositado foi recolhido por filtração para obter 1,2 g de ácido 2-amino-5-cloro-3-metoxibenzóico.

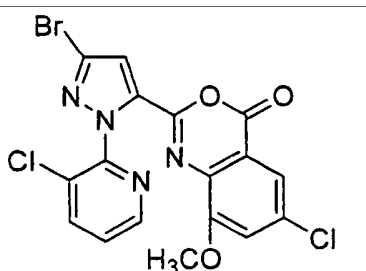


Ácido 2-amino-5-cloro-3-metoxibenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,84 (3H, s), 6,99 (1H, s), 7,28 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 56-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-5-cloro-3-metoxibenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metoxi-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

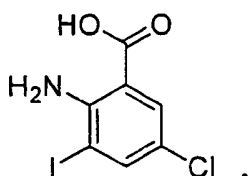


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metoxi-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,71 (3H, s), 7,45 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,48 (1H, s), 7,57 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,78 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,28 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,57 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 57-(1)

A uma mistura de 1,5 g de ácido 2-amino-5-clorobenzóico e 100 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionada 2,7 g de N-iodosuccinimida à temperatura ambiente e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 24 horas. Depois de terem sido vertidos 30 mL de água para a mistura reaccional, a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 1,2 g de ácido 2-amino-5-cloro-3-iodobenzóico da fórmula:

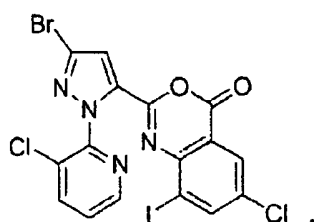


Ácido 2-amino-5-cloro-3-iodobenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,76 (2H, sl), 7,75 (1H, d, $J=1$ Hz), 7,87 (1H, d, $J=1$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 57-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-5-cloro-3-iodobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-iodo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

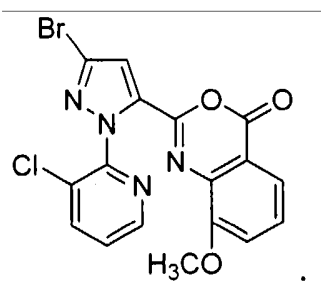


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-iodo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,53 (1H, s), 7,69 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,08 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,29 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,38 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,57 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 58

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-metoxibenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metoxi-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

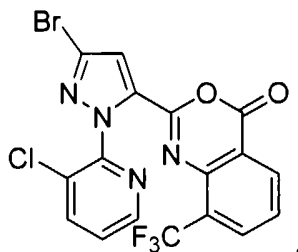


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metoxi-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 3,67 (3H, s), 7,40 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 7,46 (1H, s), 7,52 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 7,78 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,28 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,57 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 59

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-trifluorometilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-trifluorometil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

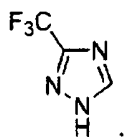


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-trifluorometil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,56 (1H, s), 7,69-7,77 (2H, m) 8,15 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,29 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,37 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,55 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 60-(1)

A uma solução de 4,8 g de mono-hidrato de hidrazina em 160 mL de etanol, foi adicionado, gota a gota, 14,2 g de trifluoroacetato de etilo. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi dissolvido em 100 mL de etanol, e foi ali adicionada 9,9 g de acetato de formamidina. A mistura foi agitada durante 3 horas sob aquecimento a refluxo. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. Uma solução aquosa de bicarbonato de sódio foi vertida para o resíduo resultante e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 7,0 g de 3-trifluorometil-1H-1,2,4-triazole da fórmula:

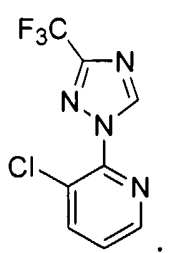


3-Trifluorometil-1H-1,2,4-triazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 8,48 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 60-(2)

Uma mistura de 3,5 g de 3-trifluorometil-1H-1,2,4-triazole, 3,8 g de 2,3-dicloropiridina, 6,0 g de carbonato de potássio e 30 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada a 120 °C durante 27 horas. Depois da mistura reaccional ter sido deixada arrefecer até à temperatura ambiente, foi vertida água e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,72 g de 3-cloro-2-(3-trifluorometil-1H-1,2,4-triazol-1-il)piridina da fórmula:

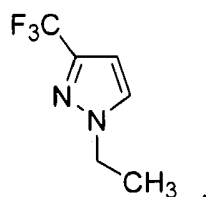


3-Cloro-2-(3-trifluorometil-1H-1,2,4-triazol-1-il)piridina

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 7,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,01 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,53 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 8,82 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 61-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 17, foi utilizada etil-hidrazina em vez de metil-hidrazina para obter 1-etil-3-trifluorometil-1H-pirazole da fórmula:

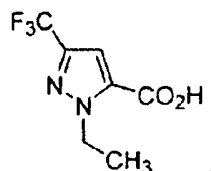


1-Etil-3-trifluorometil-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,52 (3H, t, $J=7$ Hz), 4,23 (2H, q, $J=7$ Hz), 6,51 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,44 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 61-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 18, foi utilizado 1-etil-3-trifluorometil-1H-pirazole em vez de 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazole para obter ácido 1-etil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

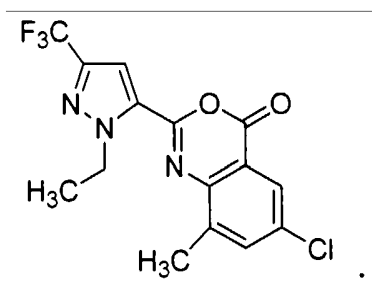


Ácido 1-etil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,51 (3H, t, $J=7$ Hz), 4,68 (2H, q, $J=7$ Hz), 7,21 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 61-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-etil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-(1-etil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

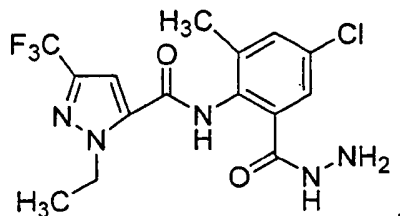


6-Cloro-2-(1-etil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,58 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,59 (3H, s), 4,89 (2H, q, $J=7$ Hz), 7,33 (1H, s), 7,69 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,07 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 61-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 6-cloro-2-(1-etil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-etil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



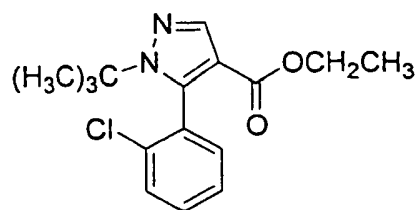
N-[4-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-etil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,48 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,30 (3H, s), 4,04 (2H, s), 4,66 (2H, q, $J=7$ Hz), 7,08 (1H, s), 7,29 (1H, s), 7,40 (1H, s), 7,45 (1H, sl), 9,81 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 62-(1)

Uma mistura de 2,82 g de 2-(2-clorobenzoil)-3-(N,N-dimetilamino)acrilato de etilo (um composto descrito no documento JP-A 7-101940), 1,25 g de cloridrato de terc-butil-hidrazina e 10 mL de etanol foi aquecida a refluxo durante 8 horas. Depois da mistura reaccional ter sido deixada arrefecer até à temperatura ambiente, foi vertida água na mistura e a

mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,48 g de 1-terc-butil-5-(2-clorofenil)-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo da fórmula:

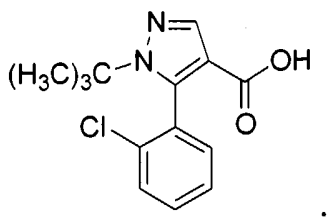


1-terc-Butil-5-(2-clorofenil)-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo

RMN de ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 1,04 (3H, t, $J=7$ Hz), 1,47 (9H, s), 3,98-4,12 (2H, m), 7,28-7,35 (2H, m), 7,38-7,42 (1H, m), 7,45-7,48 (1H, m), 7,99 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 62-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 54-(2), foi utilizado 1-terc-butil-5-(2-clorofenil)-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo em vez de 3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxilato de etilo para obter ácido 1-terc-butil-5-(2-clorofenil)-1H-pirazole-4-carboxílico da fórmula:

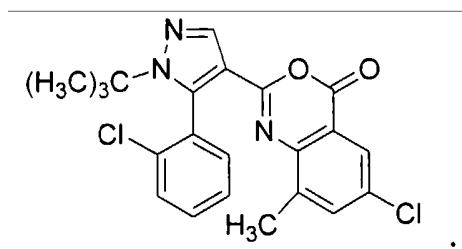


Ácido 1-terc-butil-5-(2-clorofenil)-1H-pirazole-4-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 1,45 (9H, s), 7,25-7,33 (2H, m), 7,39 (1H, td, $J=7$ Hz, 2 Hz), 7,44 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,00 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 62-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 54-(3), foi utilizado ácido 1-terc-butil-5-(2-clorofenil)-1H-pirazole-4-carboxílico em vez de ácido 3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxílico para obter 2-[1-terc-butil-5-(2-clorofenil)-1H-pirazol-4-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

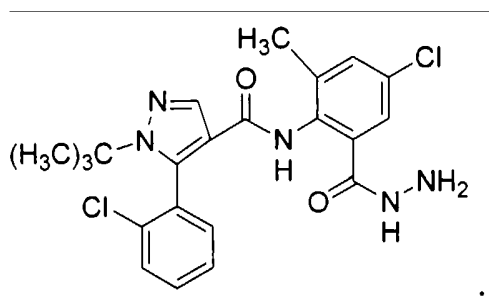


2-[1-terc-Butil-5-(2-clorofenil)-1H-pirazol-4-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 1,44 (9H, s), 1,77 (3H, s), 7,47-7,59 (3H, m), 7,65-7,68 (2H, m), 7,80 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,18 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 62-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 54-(4), foi utilizada 2-[1-terc-butil-5-(2-clorofenil)-1H-pirazol-4-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[3-(2-clorofenil)-1-metil-1H-pirazol-4-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 1-terc-butil-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-5-(2-clorofenil)-1H-pirazole-4-carboxamida da fórmula:

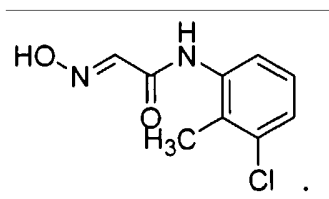


1-terc-Butil-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-5-(2-clorofenil)-1H-pirazole-4-carboxamida

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 1,40 (9H, s), 2,06 (3H, s), 4,37 (2H, sl), 7,28 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,38-7,53 (5H, m), 8,10 (1H, s), 9,36 (1H, sl), 9,53 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 63-(1)

Uma mistura de 4,62 g de hidrato de cloral, 3,5 g de 3-cloro-2-metilanilina, 30 g de sulfato de sódio anidro, 120 mL de água e 2 mL de ácido clorídrico 2 N foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Em seguida, à mistura resultante foi adicionado 1,8 g de cloridrato de hidroxilamina e a mistura foi aquecida a refluxo durante 30 minutos. A mistura reaccional foi arrefecida em gelo e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 2,5 g de N-(3-cloro-2-metilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida da fórmula:

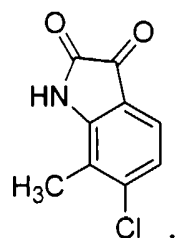


N-(3-cloro-2-metilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 7,22 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,33 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,38 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,67 (1H, s), 9,78 (1H, sl), 12,21 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 63-(2)

A 2,5 g de ácido sulfúrico concentrado foi adicionado 2,5 g de N-(3-cloro-2-metilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida a 50 °C e a mistura foi agitada a 80 °C durante 30 minutos. A mistura reaccional foi vertida para 200 g de gelo e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 1,3 g de 6-cloro-7-metil-1H-indole-2,3-diona da fórmula:

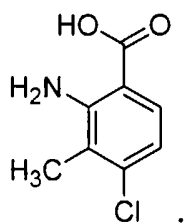


6-Cloro-7-metil-1H-indole-2,3-diona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 7,15 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,37 (1H, d, $J=8$ Hz), 11,28 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 63-(3)

Uma solução mista de 1,3 g de 6-cloro-7-metil-1H-indole-2,3-diona e 50 mL de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N foi adicionada, gota a gota, a 2 g de peróxido de hidrogénio aquoso (30%) e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. A mistura reaccional foi ajustada a pH 4 por adição de ácido clorídrico 2 N e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,6 g de ácido 2-amino-4-cloro-3-metilbenzóico da fórmula:

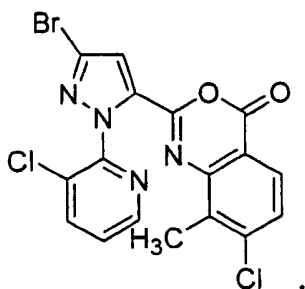


Ácido 2-amino-4-cloro-3-metilbenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 6,62 (1H, d, J=9 Hz) 7,61 (1H, d, J=9 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 63-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-4-cloro-3-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-7-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

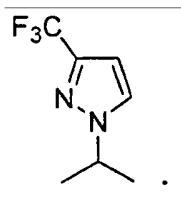


2-[2-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-7-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,76 (3H, s), 7,55 (1H, s), 7,65 (1H, d, J=9 Hz), 7,77 (1H, dd, J=8 Hz, 4 Hz), 7,94 (1H, d, J=9 Hz), 8,35 (1H, dd, J=8 Hz, 1 Hz), 8,64 (1H, dd, J=4 Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 64-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 14, foi utilizado iodeto de isopropilo em vez de 2,3-dicloropiridina para obter 1-isopropil-3-trifluorometil-1H-pirazole da fórmula:

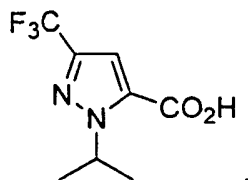


1-Isopropil-3-trifluorometil-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,53 (6H, d, $J=7$ Hz), 4,53-4,60 (1H, m), 6,50 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,45 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 64-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 18, foi utilizado 1-isopropil-3-trifluorometil-1H-pirazole em vez de 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazole para obter ácido 1-isopropil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

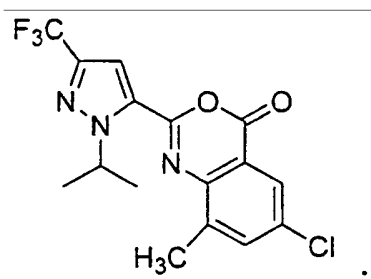


Ácido 1-isopropil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,53 (6H, d, $J=7$ Hz), 5,49-5,56 (1H, m), 7,17 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 64-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-isopropil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-(1-isopropil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

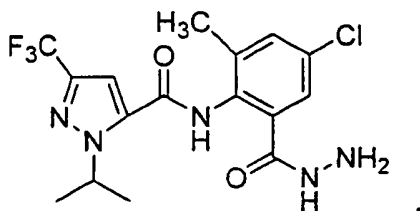


6-Cloro-2-(1-isopropil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,62 (6H, d, $J=7$ Hz), 2,59 (3H, s), 5,83-5,90 (1H, m), 7,31 (1H, s), 7,68 (1H, s), 8,07 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 64-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 6-cloro-2-(1-isopropil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-isopropil-3-trifluoro metil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

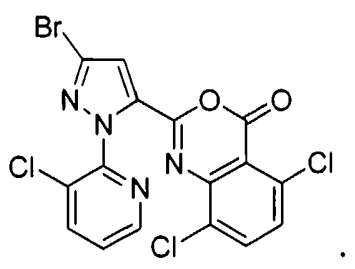


N-[4-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-isopropil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,44 (6H, d, $J=7$ Hz), 2,25 (3H, s), 4,36 (2H, s), 5,42-5,47 (1H, m), 7,34 (1H, s), 7,36 (1H, s), 7,50 (1H, s), 9,61 (1H, sl), 10,16 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 65

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3,6-diclorobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-5,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

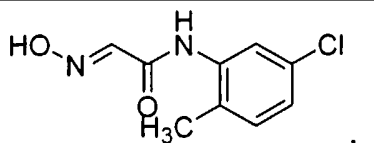


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-5,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,57 (1H, s), 7,62 (1H, d, $J=8$ Hz) 7,72 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,87 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,31 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,59 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 66-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 63-(1), foi utilizada 5-cloro-2-metilanilina em vez de 3-cloro-2-metilanilina para obter N-(5-cloro-2-metilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida da fórmula:

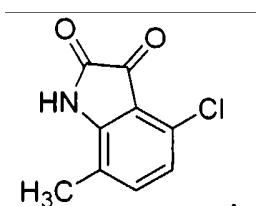


N-(5-Cloro-2-metilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,20 (3H, s), 7,17 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 7,27 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,64 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,70 (1H, d, $J=2$ Hz), 9,56 (1H, s), 12,27 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 66-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 63-(2), foi utilizada N-(5-cloro-2-metilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida em vez de N-(3-cloro-2-metilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida para obter 4-cloro-7-metil-1H-indole-2,3-diona da fórmula:

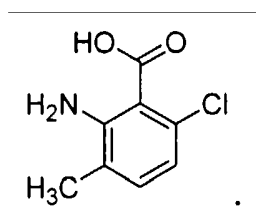


4-Cloro-7-metil-1H-indole-2,3-diona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 6,99 (1H, d, J=8 Hz) 7,40 (1H, d, J=8 Hz), 11,24 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 66-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 63-(3), foi utilizada 4-cloro-7-metil-1H-indole-2,3-diona em vez de 6-cloro-7-metil-1H-indole-2,3-diona para obter ácido 2-amino-6-cloro-3-metilbenzóico da fórmula:

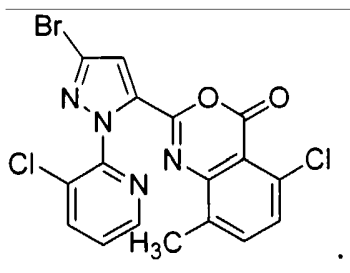


Ácido 2-amino-6-cloro-3-metilbenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,07 (3H, s), 6,57 (1H, d, J=8 Hz), 7,01 (1H, d, J=8 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 66-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-6-cloro-3-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-5-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

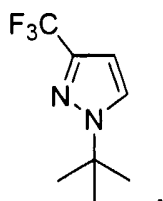


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-5-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,66 (3H, s), 7,52-7,56 (2H, m), 7,62 (1H, d, J=8 Hz), 7,76 (1H, dd, J=8 Hz, 4 Hz), 8,34 (1H, d, J=8 Hz), 8,63 (1H, d, J=4 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 67-(1)

A uma mistura de 5 g de 4-etoxi-1,1,1-trifluoro-3-buten-2-ona, 3 g de acetato de sódio e 15 mL de etanol foi adicionado 4,6 g de cloridrato de terc-butil-hidrazina e a mistura foi aquecida a refluxo durante 2 dias. Foi adicionada água à mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter dietílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 3,0 g de 1-terc-butil-3-trifluorometil-1H-pirazole da fórmula:

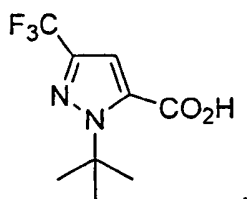


1-terc-Butil-3-trifluorometil-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,61 (9H, s), 6,48 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,54 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 67-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 18, foi utilizado 1-terc-butil-3-trifluorometil-1H-pirazole em vez de 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazole para obter ácido 1-terc-butil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

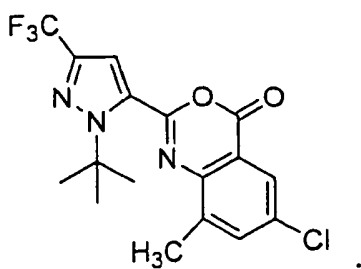


Ácido 1-terc-butil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,75 (9H, s), 7,28 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 67-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-terc-butil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-(1-terc-butil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

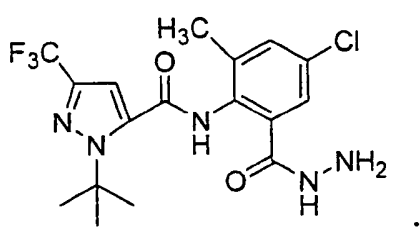


6-Cloro-2-(1-terc-butil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,86 (9H, s), 2,61 (3H, s), 7,32 (1H, s), 7,68 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,08 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 67-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 6-cloro-2-(1-terc-butil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-terc-butil)-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



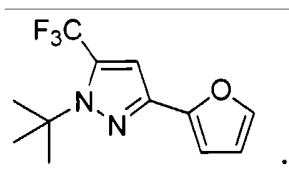
N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-terc-butil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 1,67 (9H, s), 2,27 (3H, s), 4,36 (2H, s), 7,11 (1H, s), 7,34 (1H, s), 7,48 (1H, s), 9,63 (1H, sl), 10,22 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 68-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 24, foi utilizado cloridrato de terc-butil-

hidrazina em vez de cloridrato de 2-clorofenil-hidrazina para obter 1-terc-butil-3-(2-furil)-5-trifluorometil-1H-pirazole da fórmula:

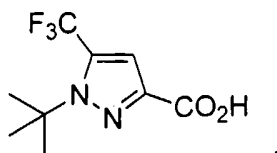


1-terc-Butil-3-(2-furil)-5-trifluorometil-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,53 (9H, s), 6,48-6,51 (2H, m) 6,59 (1H, s), 7,55 (1H, dd, $J=2$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 68-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 25, foi utilizado 1-terc-butil-3-(2-furil)-5-trifluorometil-1H-pirazole em vez de 1-(2-clorofenil)-5-(2-furil)-3-trifluorometil-1H-pirazole para obter ácido 1-terc-butil-5-trifluorometil-1H-pirazole-3-carboxílico da fórmula:

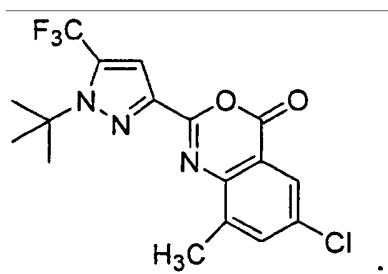


Ácido 1-terc-butil-5-trifluorometil-1H-pirazole-3-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,73 (9H, s), 7,90 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 68-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-terc-butil-5-trifluorometil-1H-pirazole-3-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-terc-butil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

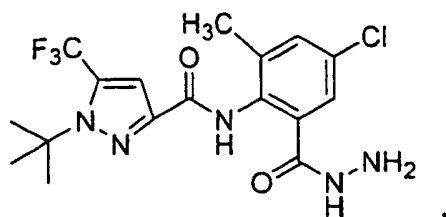


6-Cloro-2-[1-terc-butil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il]-
8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,76 (9H, s), 2,58 (3H, s), 7,57 (1H, s), 7,74 (1H, d, J=2 Hz), 8,12 (1H, d, J=2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 68-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 6-cloro-2-(1-terc-butil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-terc-butil-5-trifluorometil-1H-pirazole-3-carboxamida da fórmula:

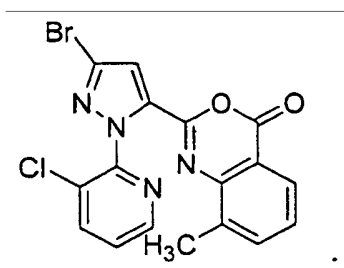


N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-terc-butil-5-trifluorometil-1H-pirazole-3-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,70 (9H, s), 2,26 (3H, s), 4,39 (2H, s), 7,37 (1H, s), 7,50 (1H, s), 7,85 (1H, s), 9,75 (1H, sl), 10,67 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 69

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

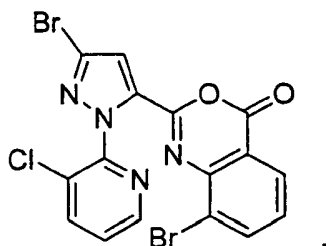


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,74 (3H, s), 7,46-7,51 (2H, m), 7,68 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,76 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,94 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,35 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,63 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 70

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-bromobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 8-bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



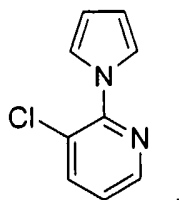
8-Bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,49 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,54 (1H, s), 7,72 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,08 (1H, s), 8,10 (1H, s), 8,32 (1H, t, $J=4$ Hz), 8,60 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 71-(1)

Uma mistura de 1,0 g de pirrole, 3,0 g de 3-cloro-2-metanossulfonilpiridina, 6,6 g de carbonato de césio e 10 mL de

N,N-dimetilformamida foi agitada a 60 °C durante 27 horas. Depois da mistura reaccional ter sido deixada arrefecer até à temperatura ambiente, foi ali vertida água e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 1,7 g de 3-cloro-2-(1H-pirrol-1-il)piridina da fórmula:



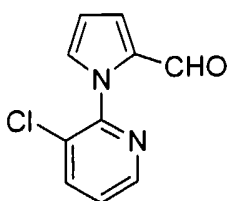
3-Cloro-2-(1H-pirrol-1-il)piridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,35 (2H, t, $J=2$ Hz), 7,15 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,42 (2H, t, $J=2$ Hz), 7,83 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,39 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 71-(2)

A 3,8 mL de N,N-dimetilformamida foram adicionados, gota a gota, 4,2 mL de oxicloreto de fósforo à temperatura ambiente e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos. Foi ali adicionado 1,6 g de 3-cloro-2-(1H-pirrol-1-il)piridina e a mistura resultante foi agitada a 60 °C durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura

ambiente e, em seguida, lentamente adicionada a água gelada. A mistura foi ajustada a pH 4 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N. Um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 1,7 g de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina da fórmula:

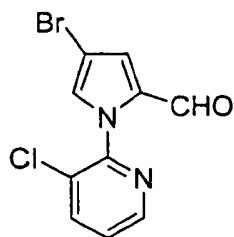


3-Cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,48 (1H, dd, $J=4$ Hz, 3 Hz), 7,14-7,15 (2H, m), 7,39 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,89 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,47 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,57 (1H, d, $J=1$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 71-(3)

A uma solução de 1,5 g de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina em 20 mL de N,N-dimetilformamida, foi adicionado 1,3 g de N-bromossuccinimida. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 1,9 g de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

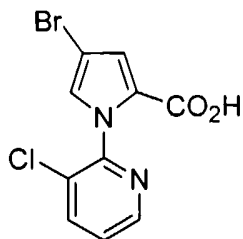


4-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,11 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,14 (1H, dd, $J=2$ Hz, 1 Hz), 7,41 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,89 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,46 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,51 (1H, d, $J=1$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 71-(4)

Uma solução aquosa de 1,2 g de permanganato de potássio em 10 mL de água foi adicionada, gota a gota, a uma mistura de 0,72 g de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído e 15 mL de acetona, enquanto a mistura era mantida a 40 °C. A mistura foi então agitada a 60 °C durante 8 horas. Os precipitados foram filtrados para obter um filtrado. O filtrado foi ajustado a pH 10-12 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, lavado duas vezes com clorofórmio. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N. Um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,56 g de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

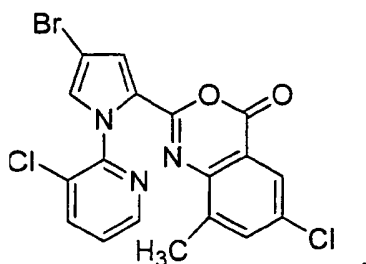


Ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,99 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,38 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,56 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,10 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,48 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 71-(5)

Uma mistura de 0,56 g de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e 0,40 mL de cloreto de tionilo foi aquecida a refluxo em acetonitrilo durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi dissolvido em 10 mL de acetonitrilo. Foi ali adicionado 0,35 g de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico e a mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 10 minutos. À mistura, foram adicionados 0,53 mL de piridina e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 6 horas., em seguida, foram adicionados 0,19 mL de cloreto de metanossulfonilo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,29 g de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

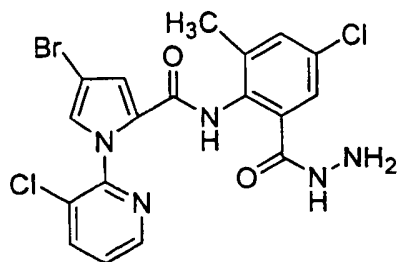


2-[4-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,73 (3H, s), 7,07 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,32 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,42-7,44 (2H, m), 7,91 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 7,93 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 71-(6)

Uma mistura de 0,29 g de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,10 g de mono-hidrato de hidrazina e 10 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi adicionada água à mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,30 g de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

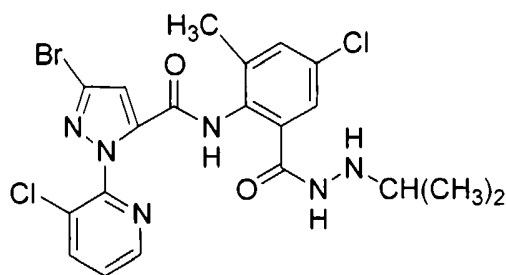


4-Bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,20 (3H, s), 4,04 (2H, sl), 7,02 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,04 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,21 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,28 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,31 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,34 (1H, sl), 7,80 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,41 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,27 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 72

Uma mistura de 0,60 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,29 g de cloridrato de isopropil-hidrazina, 0,27 g de trietilamina e 6 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. A camada orgânica reunida foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,35 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N'-isopropil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

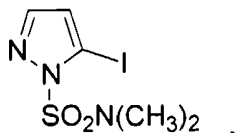


3-Bromo-N-[4-cloro-2-(N'-isopropil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,08 (6H, d, $J=6$ Hz), 2,11 (3H, s), 3,12 (1H, hept., $J=6$ Hz), 4,60 (1H, sl), 7,11 (1H, s), 7,14 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,20 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,37 (1H, dd, $J_1=8$ Hz, $J_2=4$ Hz), 7,79 (1H, sl), 7,84 (1H, dd, $J_1=8$ Hz, $J_2=1$ Hz), 8,44 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,93 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 73-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 20, foi utilizada N-iodossuccinimida em vez de 1,2-dibromo-1,1,2,2-tetracloroetano para obter N,N-dimetil-5-iodo-1H-pirazole-1-sulfonamida da fórmula:

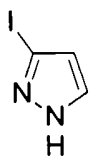


N,N-dimetil-5-iodo-1H-pirazole-1-sulfonamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,07 (6H, s), 6,60 (1H, d, $J=1$ Hz), 7,62 (1H, d, $J=1$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 73-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 21, foi utilizada N,N-dimetil-5-iodo-1H-pirazole-1-sulfonamida em vez de 5-bromo-N,N-dimetil-1H-pirazole-1-sulfonamida para obter 3-iodo-1H-pirazole da fórmula:

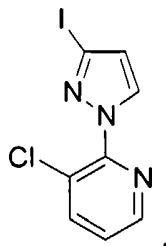


3-Iodo-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,74 (1H, d, $J=3$ Hz), 8,10 (1H, d, $J=3$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 73-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 22, foi utilizado 3-iodo-1H-pirazole em vez de 3-bromo-1H-pirazole para obter 3-cloro-2-(3-iodo-1H-pirazol-1-il)piridina da fórmula:

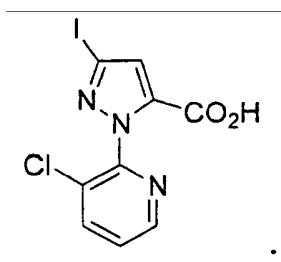


3-Cloro-2-(3-iodo-1H-pirazol-1-il)piridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,65 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,31 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,91 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 7,95 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,46 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 73-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 23, foi utilizada 3-cloro-2-(3-iodo-1H-pirazol-1-il)piridina em vez de 2-(3-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina para obter ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-iodo-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

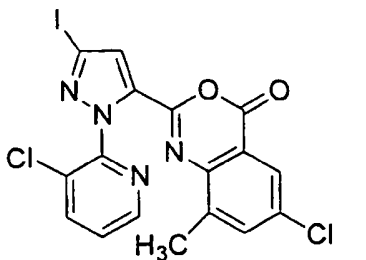


Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-iodo-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,20 (1H, s), 7,44 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,91 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,50 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 73-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-iodo-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-iodo-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



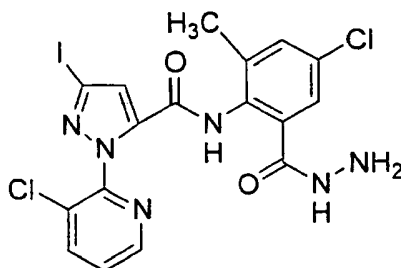
6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-iodo-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,82 (3H, s), 7,39 (1H, s), 7,47-7,50 (2H, m), 7,95-7,98 (2H, m), 8,56 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 73-(6)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 7, foi utilizada 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-iodo-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-

(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-iodo-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

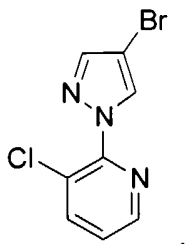


N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-iodo-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 4,36 (2H, sl), 7,31 (1H, sl), 7,42 (1H, sl), 7,46 (1H, sl), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,15 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz), 9,54 (1H, sl), 10,20 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 74-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 22, foi utilizado 4-bromo-1H-pirazole em vez de 3-bromo-1H-pirazole para obter 2-(4-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina da fórmula:

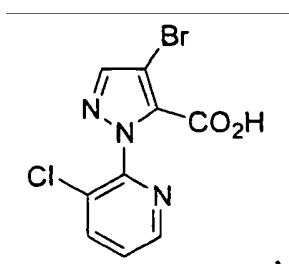


2-(4-Bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,31 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,77 (1H, s), 7,92 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,19 (1H, s), 8,45 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 74-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 23, foi utilizada 2-(4-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina em vez de 2-(3-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina para obter ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

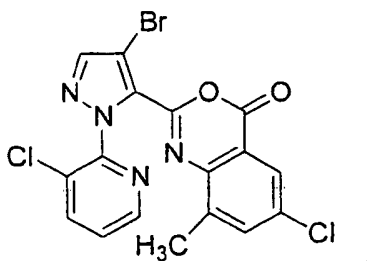


Ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 7,66 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,06 (1H, s), 8,23 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,54 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 74-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



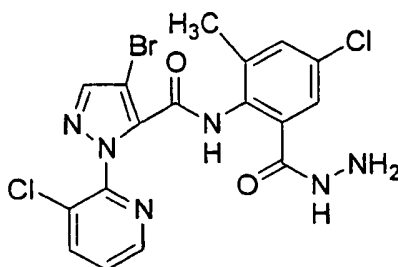
2-[4-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,00 (3H, s), 7,46 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,53 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,87 (1H, s), 7,95 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 7,98 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,51 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 74-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 7, foi utilizada 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4-bromo-N-[4-

cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

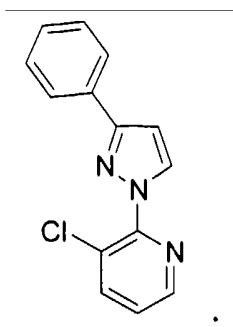


4-Bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 4,47 (2H, sl), 7,37 (1H, s), 7,48 (1H, s), 7,62 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,12 (1H, s), 8,19 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,69 (1H, sl), 10,24 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 75-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 22, foi utilizado 3-fenil-1H-pirazole em vez de 3-bromo-1H-pirazole para obter 3-cloro-2-(3-fenil-1H-pirazol-1-il)piridina da fórmula:

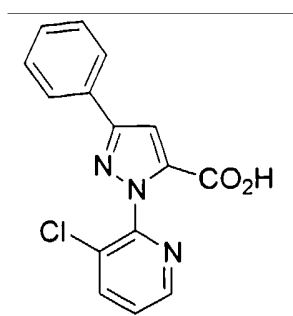


3-Cloro-2-(3-fenil-1H-pirazol-1-il)piridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,82 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,27 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,35 (1H, m), 7,43 (2H, m), 7,93 (3H, m), 8,20 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,48 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 75-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 23, foi utilizada 3-cloro-2-(3-fenil-1H-pirazol-1-il)piridina em vez de 2-(3-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina para obter ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-fenil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

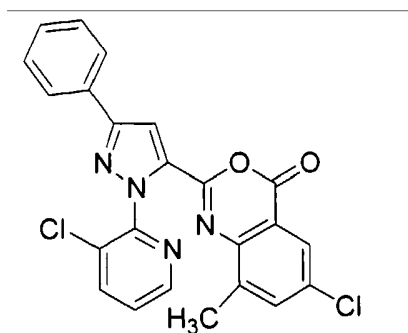


Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-fenil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 7,36-7,45 (3H, m), 7,57 (1H, s), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,90-7,92 (2H, m), 8,24 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,57 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 75-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-fenil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-fenil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



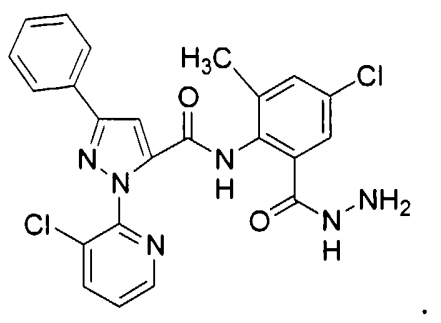
6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-fenil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,83 (3H, s), 7,39-7,52 (5H, m), 7,59 (1H, s), 7,92-8,00 (4H, m), 8,59 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 75-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 7, foi utilizada 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-fenil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-

(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-fenil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



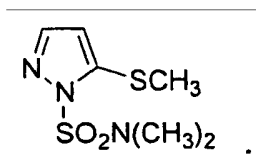
N-[4-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-fenil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,19 (3H, s), 4,40 (2H, sl), 7,33 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,42-7,92 (4H, m), 7,60 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,70 (1H, s), 7,88 (2H, d, $J=7$ Hz), 8,17 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,58 (1H, sl), 10,27 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 76-(1)

A uma mistura de 4,0 g de N,N-dimetil-1H-pirazole-1-sulfonamida e 45 mL de tetra-hidrofurano foram adicionados, gota a gota, 15,7 mL de uma solução de n-butil-lítio 1,6M em hexano a -78°C e a mistura foi agitada a -78°C durante 10 minutos. Depois de terem sido adicionados 2,3 mL de dissulfureto de dimetilo à mistura, a mistura foi agitada durante 4 horas, enquanto a temperatura de reacção era gradualmente aumentada até à temperatura ambiente. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter t-butil-metílico. A camada orgânica reunida foi lavada sucessivamente

com uma solução aquosa de hidróxido de sódio 1 N e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 4,87 g de N,N-dimetil-5-metiltio-1H-pirazole-1-sulfonamida da fórmula:

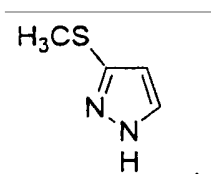


N,N-dimetil-5-metiltio-1H-pirazole-1-sulfonamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,49 (3H, s), 3,01 (6H, s), 6,10 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,63 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 76-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 21, foi utilizada N,N-dimetil-5-metiltio-1H-pirazole-1-sulfonamida em vez de 5-bromo-N,N-dimetil-1H-pirazole-1-sulfonamida para obter 3-metiltio-1H-pirazole da fórmula:

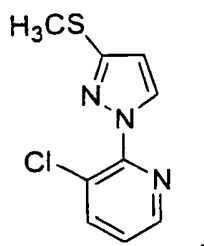


3-Metiltio-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,61 (3H, s), 6,45 (1H, d, $J=3$ Hz), 8,19 (1H, d, $J=3$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 76-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 22, foi utilizado 3-metiltio-1H-pirazole em vez de 3-bromo-1H-pirazole para obter 3-cloro-2-(3-metiltio-1H-pirazol-1-il)piridina da fórmula:

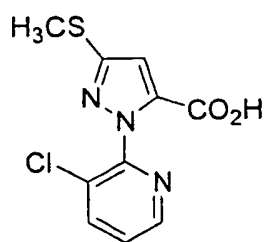


3-Cloro-2-(3-metiltio-1H-pirazol-1-il)piridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,61 (3H, s), 6,40 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,25 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,89 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,12 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,43 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 76-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 23, foi utilizada 3-cloro-2-(3-metiltio-1H-pirazol-1-il)piridina em vez de 2-(3-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina para obter ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metiltio-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

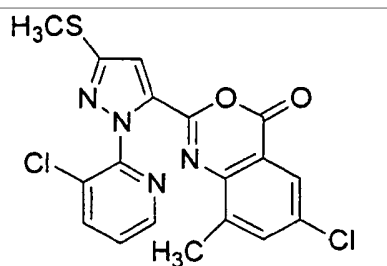


Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metiltio-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 2,49 (3H, s), 7,02 (1H, s), 7,62 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,19 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 76-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metiltio-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metiltio-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

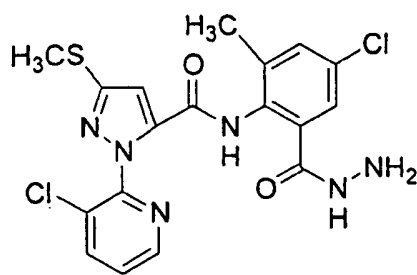


6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metiltio-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,81 (3H, s), 2,61 (3H, s), 7,15 (1H, s), 7,45-7,48 (2H, m), 7,94-7,98 (2H, m), 8,56 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 76-(6)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 7, foi utilizada 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metiltio-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metiltio-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

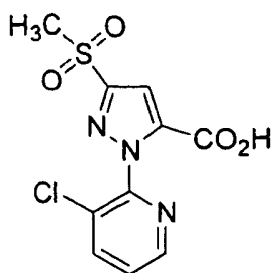


N-[4-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metiltio-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,14 (3H, s), 2,53 (3H, s), 4,37 (2H, sl), 7,20 (1H, s), 7,30 (1H, s), 7,46 (1H, s), 7,56 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,12 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,47 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,54 (1H, sl), 10,16 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 77-(1)

A uma mistura de 0,50 g de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metiltio-1H-pirazole-5-carboxílico e 5 mL de ácido trifluoroacético foram adicionados 0,4 mL de peróxido de hidrogénio aquoso a 30% e a mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 4 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com éter t-butil-metílico. A camada orgânica reunida foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida para obter 0,44 g de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metilsulfonil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

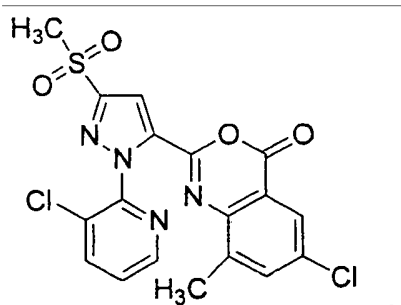


Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metilsulfonil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,39 (3H, s), 7,57 (1H, s), 7,75 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,31 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,61 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 77-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metilsulfonil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metilsulfonil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



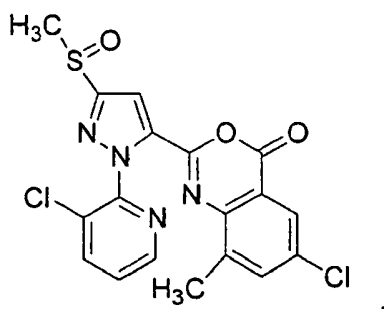
6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metilsulfonil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,85 (3H, s), 3,30 (3H, s), 7,52-7,57 (2H, m), 7,72 (1H, s), 7,99-8,03 (2H, m), 8,58 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 78

A uma mistura de 0,20 g de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metiltio-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 5 mL de diclorometano e 0,5 mL de água foi adicionado 0,18 g de hexa-hidrato de bis(monoperoxoftalato) de magnésio (MMPP) e a mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 22 horas. Foi adicionada água à mistura

reaccional e a mistura foi extraída com éter t-butil-metílico. A camada orgânica foi lavada com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida para obter 0,20 g de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metilsulfinil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



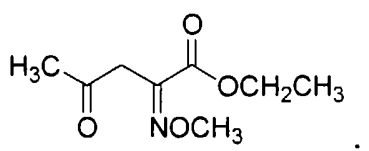
6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metilsulfinil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,85 (3H, s), 3,04 (3H, s), 7,52-7,55 (2H, m), 7,74 (1H, s), 7,99-8,01 (2H, m), 8,58 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 79-(1)

Uma mistura de 2,5 g de 2,4-dioxovalerato de etilo, 1,45 g de cloridrato de O-metil-hidroxilamina e 10 mL de etanol foi aquecida a refluxo durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e partilhada entre água e acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O

resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 1,34 g de 2-metoxiimin-4-oxopentanoato de etilo da fórmula:

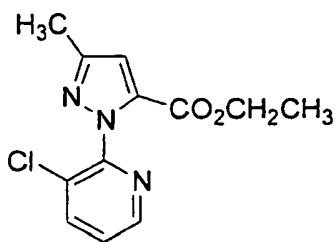


2-Metoxiimin-4-oxopentanoato de etilo

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,35 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,21 (3H, s), 3,71 (2H, s), 4,07 (3H, s), 4,34 (2H, q, $J=7$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 79-(2)

Uma mistura de 1,34 g de 2-metoxiimin-4-oxopentanoato de etilo, 1,23 g de 3-cloro-2-hidrazinopiridina, 25 mL de tetra-hidrofurano e 50 mL de ácido acético foi aquecida a refluxo durante 8 horas. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida. Foi vertida água para o resíduo e a mistura foi extraída duas vezes com éter t-butil-metílico. A camada orgânica reunida foi lavada sucessivamente com uma solução aquosa de hidróxido de sódio 1 N, água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,30 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metil-1H-pirazole-5-carboxilato de etilo da fórmula:

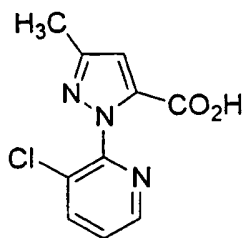


1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-metil-1H-pirazole-5-carboxilato de etilo

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,20 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,40 (3H, s), 4,20 (2H, q, $J=7$ Hz), 6,84 (1H, s), 7,40 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,88 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,51 (1H, d, $J=4$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 79-(3)

Uma mistura de 0,30 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metil-1H-pirazole-5-carboxilato de etilo, 5 mL de metanol e 5 mL de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N foi aquecida a refluxo durante 3 horas. Depois da mistura reaccional ter sido deixada arrefecer, foi vertida água na mistura e a camada aquosa foi lavada duas vezes com éter t-butil-metílico. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e, em seguida, extraída três vezes com éter t-butil-metílico. As camadas orgânicas reunidas foram lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida para obter 0,24 g de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

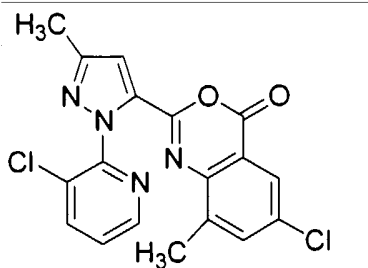


Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,40 (3H, s), 6,89 (1H, s), 7,40 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,89 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,49 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 79-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

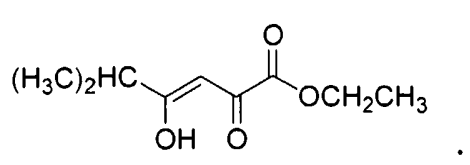


6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,81 (3H, s), 2,45 (3H, s), 7,07 (1H, s), 7,43-7,47 (2H, m), 7,92-7,98 (2H, m), 8,56 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 80-(1)

A uma mistura de 17,2 g de 3-metil-2-butanona, 27,1 g de oxalato de dietilo e 130 mL de etanol foram adicionados 95 mL de etóxido de sódio (solução em etanol a 20%) e a mistura resultante foi agitada a 60 °C durante 5 horas. Depois de deixar arrefecer até à temperatura ambiente, um precipitado depositado foi recolhido por filtração e lavado com etanol. O bolo de filtração foi partilhado entre ácido clorídrico 2 N e éter t-butil-metílico. A camada orgânica foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida para obter 28,8 g de 4-hidroxi-5-metil-2-oxo-3-hexenoato de etilo da fórmula:

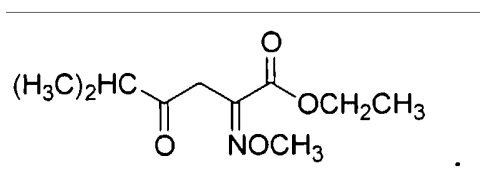


4-Hidroxi-5-metil-2-oxo-3-hexenoato de etilo

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,19 (6H, d, $J=7$ Hz), 1,38 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,66 (1H, hept., $J=7$ Hz), 4,36 (2H, q, $J=7$ Hz), 6,41 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 80-(2)

Uma mistura de 5,0 g de 4-hidroxi-5-metil-2-oxo-3-hexenoato de etilo, 2,46 g de cloridrato O-metil-hidroxilamina e 10 mL de etanol foi agitada à temperatura ambiente durante 6 horas. Depois de ter sido vertido acetato de etilo para a mistura reaccional, a camada orgânica foi lavada com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida para obter 5,32 g de 2-metoxiimino-5-metil-4-oxo-hexanoato de etilo da fórmula:



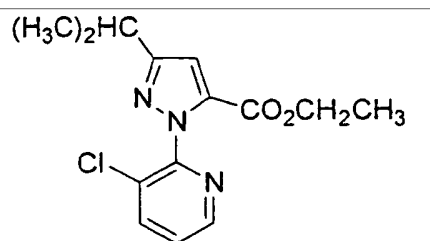
2-Metoxiimino-5-metil-4-oxo-hexanoato de etilo

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,15 (6H, d, $J=7$ Hz), 1,34 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,68 (1H, hept., $J=7$ Hz), 3,76 (2H, s), 4,05 (3H, s), 4,33 (2H, q, $J=7$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 80-(3)

Uma mistura de 3,0 g de 2-metoxiimino-5-metil-4-oxohexanoato de etilo, 2,4 g de 3-cloro-2-hidrazinopiridina, 50 mL de tetra-hidrofurano e 100 mL de ácido acético foi agitada à temperatura ambiente durante 20 horas e, em seguida, aquecida a refluxo durante 4 horas. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida. Foi vertida água para o resíduo e a

mistura foi extraída duas vezes com éter t-butil-metílico. A camada orgânica reunida foi lavada sucessivamente com uma solução aquosa de hidróxido de sódio 1 N, água e uma solução aquosa saturada de cloreto, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 1,07 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazole-5-carboxilato de etilo da fórmula:



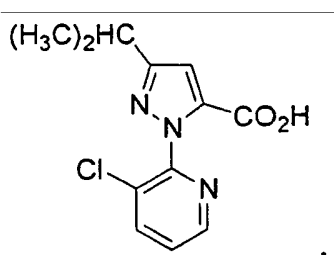
1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazole-5-carboxilato de etilo

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,20 (3H, t, $J=7$ Hz), 1,34 (6H, d, $J=7$ Hz), 3,11 (1H, hept., $J=7$ Hz), 4,20 (2H, q, $J=7$ Hz), 6,88 (1H, s), 7,40 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,88 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,52 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 80-(4)

Uma mistura de 1,07 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazole-5-carboxilato de etilo, 15 mL de metanol e 15 mL de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N foi aquecida a refluxo durante 1,5 horas. Depois da mistura reaccional ter sido deixada arrefecer, foi vertida água na mistura e a mistura foi lavada duas vezes com éter t-butil-

metílico. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e, em seguida, extraída três vezes com éter t-butil-metílico. A camada orgânica reunida foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida para obter 0,97 g de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

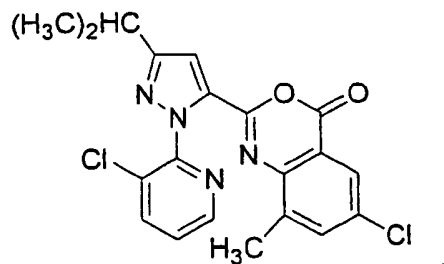


Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,33 (6H, d, $J=7$ Hz), 3,10 (1H, hept., $J=7$ Hz), 6,93 (1H, s), 7,39 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,88 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, d, $J=4$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 80-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

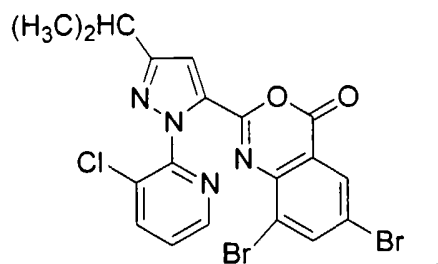


6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,37 (6H, d, $J=7$ Hz), 1,81 (3H, s), 3,15 (1H, hept., $J=7$ Hz), 7,12 (1H, s), 7,45 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,47 (1H, d, $J=1$ Hz), 7,93 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 7,98 (1H, d, $J=1$ Hz), 8,56 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 81

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46, foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

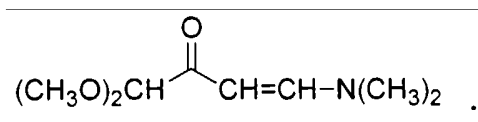


2-[1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-isopropil-1H-pirazol-5-il]-
6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,35 (6H, d, $J=7$ Hz), 3,16 (1H, hept., $J=7$ Hz), 7,16 (1H, s), 7,43 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,94 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,03 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,25 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,56 (1H, dd, $J=4$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 82-(1)

Uma mistura de 23,6 g de dimetilacetal de aldeído pirúvico e 23,8 g de dimetilacetal de N,N-dimetilformamida foi agitada a 80 °C durante 4 horas, enquanto o metanol produzido era eliminado por destilação, para obter 38,8 g (pureza: cerca de 80%) de 4-dimetilamino-1,1-dimetoxi-3-buten-2-ona da fórmula:



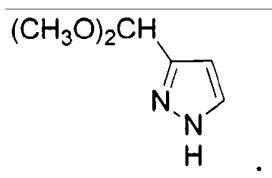
4-Dimetilamino-1,1-dimetoxi-3-buten-2-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,87 (3H, s), 3,11 (3H, s), 3,41 (6H, s), 4,58 (1H, s), 5,35 (1H, d, $J=12$ Hz), 7,74 (1H, d, $J=12$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 82-(2)

Uma mistura de 5 g de 4-dimetilamino-1,1-dimetoxi-3-buten-2-ona, 1,7 mL de mono-hidrato de hidrazina e 15 mL de metanol

foi agitada durante 8 horas sob aquecimento a refluxo. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida para obter 4,07 g de 3-(dimetoximetil)-1H-pirazole da fórmula:

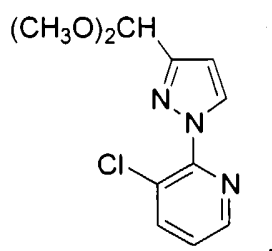


3-(Dimetoximetil)-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,37 (6H, s), 5,58 (1H, s), 6,35 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,58 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 82-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 22, foi utilizado 3-(dimetoximetil)-1H-pirazole em vez de 3-bromo-1H-pirazole para obter 3-cloro-2-[3-(dimetoximetil)-1H-pirazol-1-il]piridina da fórmula:

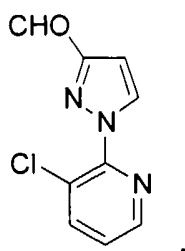


3-Cloro-2-[3-(dimetoximetil)-1H-pirazol-1-il]piridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,44 (6H, s), 5,58 (1H, s), 6,57 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,29 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,90 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,07 (1H, d, 2 Hz), 8,47 (1H, dd, 5 Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 82-(4)

Uma mistura de 3,35 g de 3-cloro-2-[3-(dimetoximetil)-1H-pirazol-1-il]piridina, 24 mL de ácido fórmico e 6 mL de água foi agitada a 60 °C durante 1 hora. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida. Foi vertida água gelada para o resíduo e um sólido precipitado foi recolhido por filtração para obter 2,38 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-3-carbaldeído da fórmula:

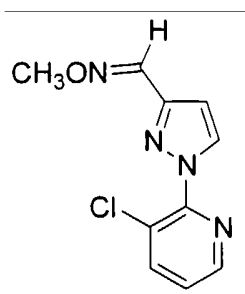


1-(3-Cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-3-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,01 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,40 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,98 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,18 (1H, dd, $J=3$ Hz, 2 Hz), 8,52 (1H, dd, 5 Hz, 2 Hz), 10,14 (1H, d, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 82-(5)

Uma mistura de 2,00 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-3-carbaldeído, 1,21 g de cloridrato de O-metil-hidroxilamina e 8 mL de piridina foi aquecida a refluxo durante 1 hora. Depois da mistura reaccional ter sido concentrada sob pressão reduzida, uma solução aquosa saturada de hidrogenocarbonato de sódio foi vertida para o resíduo e a mistura foi extraída três vezes com éter t-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 2,23 g de O-metiloxima de 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-3-carbaldeído da fórmula:



como uma mistura de um isômero E e isômero Z (isômero E: isômero Z =3:1).

O-Metiloxima de 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-3-carbaldeído

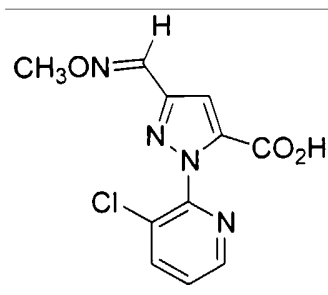
RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm):

isómero E: 3,99 (3H, s), 6,84 (1H, d, J=3 Hz), 7,30 (1H, dd, J=8 Hz, 5 Hz), 7,92 (1H, dd, J=8 Hz, 2 Hz), 8,12 (1H, dd, J=3 Hz, 1 Hz), 8,25 (1H, s), 8,48 (1H, dd, J=5 Hz, 2 Hz).

isómero Z: 4,07 (3H, s), 7,18 (1H, d, J=3 Hz), 7,33 (1H, dd, J=8 Hz, 5 Hz), 7,67 (1H, s), 7,93 (1H, dd, J=8 Hz, 2 Hz), 8,14 (1H, dd, J=3 Hz, 1 Hz), 8,49 (1H, dd, J=5 Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 82-(6)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 23, foi utilizada O-metiloxima de 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-3-carbaldeído em vez de 2-(3-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina para obter ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metoxiiminometil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:



como uma mistura de um isómero E e um isómero Z (isómero E: isómero Z=3:1).

Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metoxiiminometil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm):

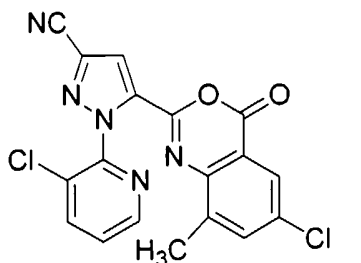
isómero E: 4,00 (3H, s), 7,39 (1H, s), 7,45 (1H, dd, J=8 Hz, 5 Hz), 7,92 (1H, dd, J=8 Hz, 2 Hz), 8,15 (1H, s), 8,51 (1H, dd, J=5 Hz, 2 Hz).

isómero Z: 4,08 (3H, s), 7,38 (1H, s), 7,51 (1H, dd, J=8 Hz, 5 Hz), 7,60 (1H, s), 7,94 (1H, dd, J=8 Hz, 2 Hz), 8,51 (1H, dd, J=5 Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 82-(7)

Uma mistura de 0,70 g de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-metoxiiminometil-1H-pirazole-5-carboxílico e 0,55 mL de cloreto de tionilo foi aquecida a refluxo durante 1 hora. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. Depois de o resíduo resultante ter sido dissolvido em 10 mL de acetonitrilo, foi adicionado 0,46 g de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 10 minutos. À mistura foram adicionados 0,35 mL de trietilamina e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos. Foram adicionados mais 70 mL de trietilamina e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 20 minutos., em seguida, foram adicionados 0,21 mL de cloreto de metanossulfonilo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 17 horas. Foi adicionada água à mistura reaccional e a mistura foi extraída com clorofórmio três vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,16 g de 6-cloro-2-[1-(3-

cloro-2-piridinil)-3-ciano-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-ciano-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,83 (3H, s), 7,52 (1H, dd, $J=2$ Hz, 1 Hz), 7,56 (1H, dd, 8 Hz, 5 Hz), 7,58 (1H, s), 7,99-8,03 (2H, m), 8,58 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 83

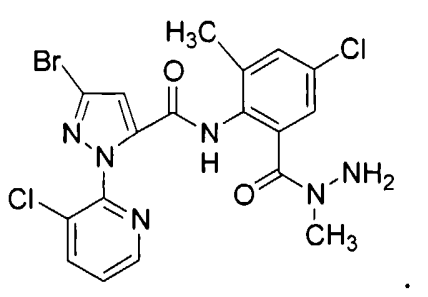
A uma mistura de 10,6 mL de metil-hidrazina, 50 mL de metanol e 8,0 g de hidróxido de sódio foram adicionados, gota a gota, 15,4 mL de cloroformato de metilo sob arrefecimento com gelo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. A mistura reaccional foi filtrada e o filtrado foi concentrado. O resíduo foi destilado sob pressão reduzida (50 a 80 °C/15 mmHg) para obter 13,4 g de N-metil-N-metoxycarbonil-hidrazina.

N-metil-N-metoxycarbonil-hidrazina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,11 (3H, s), 3,73 (3H, s), 4,13 (2H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 84

Uma mistura de 1,0 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,35 mL de metil-hidrazina e 20 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 24 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. A camada orgânica reunida foi lavada com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,85 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



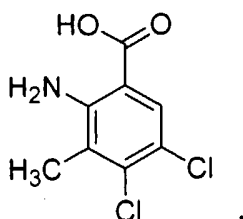
3-Bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,20 (3H, s), 3,21 (3H, s), 3,74 (3H, sl), 7,05 (1H, s), 7,26-7,38 (3H, m), 7,86 (1H, dd,

J=8 Hz, 2 Hz), 8,03 (1H, s), 8,42 (1H, dd, J=5 Hz, 2 Hz), 9,47 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 85-(1)

A uma mistura de 0,34 g de ácido 2-amino-4-cloro-3-metilbenzóico e 10 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 0,26 g de N-clorossuccinimida à temperatura ambiente e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 5 horas. Depois de terem sido vertidos 30 mL de água para a mistura reaccional, a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,22 g de ácido 2-amino-4,5-dicloro-3-metilbenzóico da fórmula:



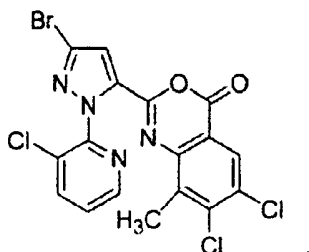
Ácido 2-amino-4,5-dicloro-3-metilbenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 2,25 (3H, s), 7,76 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 85-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-4,5-dicloro-3-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para

obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,7-dicloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

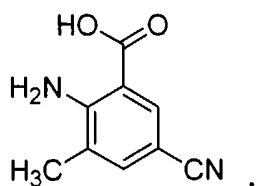


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,7-dicloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 1,82 (3H, s), 7,57 (1H, s), 7,77 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,14 (1H, s), 8,36 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,64 (1H, d, $J=5$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 86-(1)

Uma mistura de 1,0 g de ácido 2-amino-5-iodo-3-metilbenzóico, 0,45 g de cobre cianeto e 10 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada a 150 °C durante 9 horas. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida. No resíduo, foram vertidos 20 mL de água e 2 mL de etilenodiamina, e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Depois da mistura reaccional ter sido filtrada, o filtrado foi ajustada a cerca de pH 5 por adição de ácido clorídrico concentrado e, em seguida, extraído três vezes com acetato de etilo. A camada orgânica reunida foi seca sobre sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida para obter 0,40 g de ácido 2-amino-5-ciano-3-metilbenzóico da fórmula:

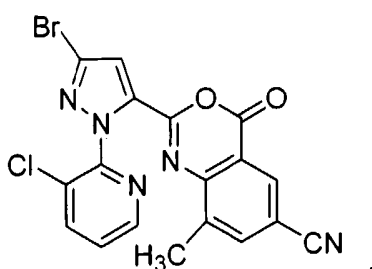


Ácido 2-amino-5-ciano-3-metilbenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 2,13 (3H, s), 7,34 (2H, sl), 7,51 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,97 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 86-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-5-ciano-3-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-6-ciano-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

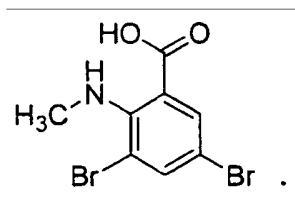


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-6-ciano-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 1,73 (3H, s), 7,60 (1H, s), 7,77 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,10 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,34-8,39 (2H, m), 8,63 (1H, d, $J=5$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 87-(1)

A uma mistura de 15,1 g de ácido N-metil-antranílico e 300 mL de ácido acético foi adicionado, gota a gota, 3,2 g de bromo ao longo de 15 minutos. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 5 horas. Foi ali adicionado mais 1,6 g de bromo, gota a gota, ao longo de 15 minutos e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. A mistura reaccional foi filtrada e o sólido resultante foi lavado sucessivamente com ácido acético, acetato de etilo e acetona para obter 23 g de ácido 3,5-dibromo-2-metilaminobenzóico da fórmula:

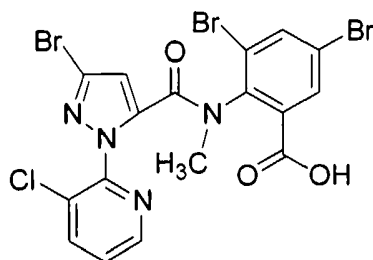


Ácido 3,5-dibromo-2-metilaminobenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 2,89-2,92 (3H, m), 7,76-7,79 (1H, m), 7,83-7,86 (1H, m).

Exemplo de Preparação de Referência 87-(2)

Uma mistura de 1,0 g de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico, 2 mL de cloreto de tionilo e uma gota de N,N-dimetilformamida foi agitada a 80 °C durante 1 hora. Depois da mistura reaccional ter sido concentrada sob pressão reduzida, foram adicionados 10 mL de hexano e a mistura foi novamente concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi misturado com 20 mL de acetonitrilo e 0,93 g de ácido 3,5-dibromo-2-metilaminobenzóico. Depois da mistura ter sido agitada à temperatura ambiente durante 1 hora, foi adicionado 0,6 g de trietilamina e a mistura foi ainda agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. A mistura reaccional foi vertida para 30 mL de água e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi lavado com éter t-butil-metílico para obter 1,3 g de ácido 3,5-dibromo-2-{N-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carbonil]-N-metilamino}benzóico da fórmula:

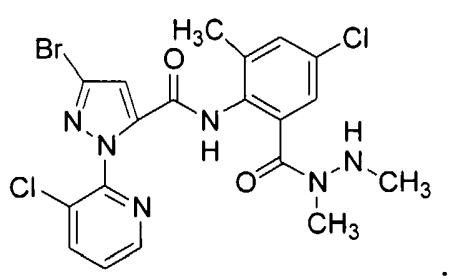


Ácido 3,5-dibromo-2-{N-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carbonil]-N-metilamino}benzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 2,98-3,34 (3H, m), 5,95 (1H, s), 7,62 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,70 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,89 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,18 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, d, $J=5$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 88

A uma mistura de 0,13 g de dicloridrato de N,N'-dimetil-hidrazina, 1 mL de água, 0,14 g de carbonato de potássio e 10 mL de tetra-hidrofurano foi adicionado 0,23 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona e a mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. A mistura reaccional foi vertida para 30 mL de água e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi lavado com acetato de etilo para obter 0,35 g de 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

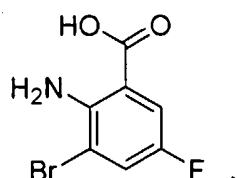


3-Bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 1,99-2,40 (6H, m), 2,98-3,09 (3H, m), 4,61 (0,7H, sl), 5,68 (0,3H, sl), 7,14-7,51 (3H, m), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,18 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=2$ Hz), 10,03 (0,6H, sl), 10,39 (0,4H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 89-(1)

A uma mistura de 0,78 g de ácido 2-amino-5-fluorobenzóico e 100 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 1,1 g de N-bromossuccinimida à temperatura ambiente e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 5 horas. Depois de ter sido adicionada água à mistura reaccional, um precipitado depositado foi recolhido por filtração e, em seguida, lavado com acetona para obter 0,43 g de ácido 2-amino-3-bromo-5-fluorobenzóico da fórmula:



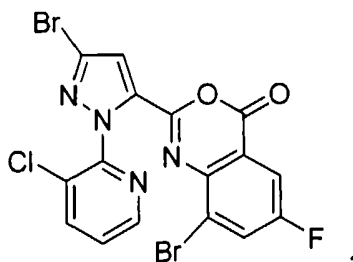
Ácido 2-amino-3-bromo-5-fluorobenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 7,55 (1H, dd, $J=8$ Hz, 3 Hz), 7,71 (1H, dd, $J=8$ Hz, 3 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 89-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-bromo-5-

fluorobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-bromo-6-fluoro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

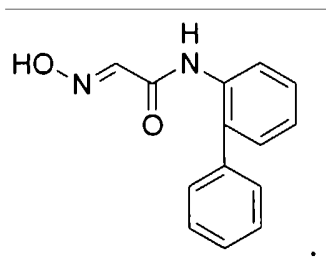


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-bromo-6-fluoro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 7,54 (1H, s), 7,72 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,92 (1H, dd, $J=8$ Hz, 3 Hz), 8,15 (1H, dd, $J=8$ Hz, 3 Hz), 8,32 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,59 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 90-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 63-(1), foi utilizada 2-fenilanilina em vez de 3-cloro-2-metilanilina para obter N-(bifenil-2-il)-2-(hidroxiimino)acetamida da fórmula:

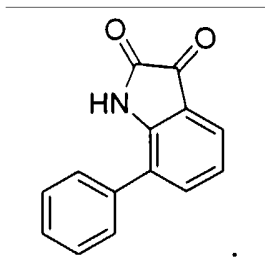


N-(bifenil-2-il)-2-(hidroxiimino)acetamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 7,27-7,48 (9H, m), 7,83 (1H, d, J=8 Hz), 9,18 (1H, s), 12,14 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 90-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 63-(2), foi utilizada N-(bifenil-2-il)-2-(hidroxiimino)acetamida em vez de N-(3-cloro-2-metilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida para obter 7-fenil-1H-indole-2,3-diona da fórmula:



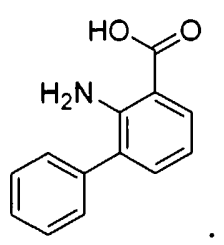
7-Fenil-1H-indole-2,3-diona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 7,18 (1H, t, J=8 Hz), 7,40-7,63 (7H, m), 10,91 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 90-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 63-(3), foi utilizada 7-fenil-1H-indole-2,3-diona

em vez de 6-cloro-7-metil-1H-indole-2,3-diona para obter ácido 2-amino-3-fenilbenzóico da fórmula:

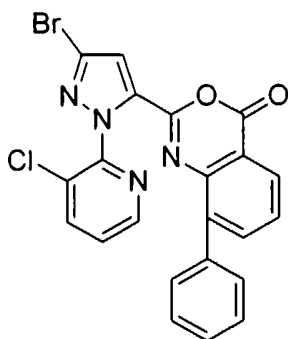


Ácido 2-amino-3-fenilbenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 6,65 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,17 (1H, d, $J=7$ Hz), 7,35-7,55 (5H, m), 7,78 (1H, d, $J=8$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 90-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-fenilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzoico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-fenil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

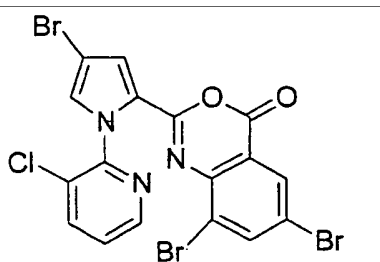


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-fenil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 7,05-7,48 (7H, m), 7,61-7,89 (3H, m), 8,09-8,28 (2H, m)

Exemplo de Preparação de Referência 91

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico em vez de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico para obter 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

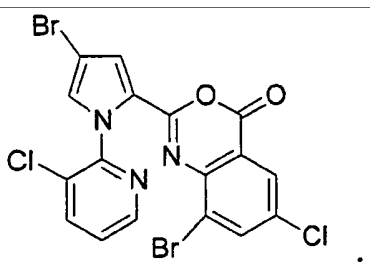


6,8-Dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,11 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,37 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,41 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,92 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 7,97 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,20 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 92

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 2-amino-3-bromo-5-clorobenzóico em vez de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico para obter 8-bromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

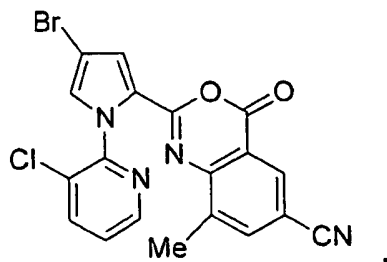


8-Bromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,11 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,37 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,41 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,82 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,92 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,05 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 93

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 2-amino-5-ciano-3-metilbenzóico em vez de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico para obter 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-ciano-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

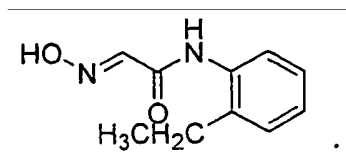


2-[4-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-ciano-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,68 (3H, s), 7,35 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,70 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,97 (1H, s), 8,23 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,28 (1H, s), 8,57 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 94-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 63-(1), foi utilizada 2-etilanilina em vez de 3-cloro-2-metilanilina para obter N-(2-etilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida da fórmula:

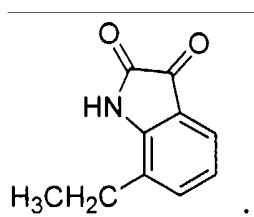


N-(2-etilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 1,12 (3H, t, $J=8$ Hz), 2,59 (2H, q, $J=8$ Hz), 7,15-7,27 (3H, m), 7,43 (1H, dd, $J=6$ Hz, 4 Hz), 7,67 (1H, s), 9,49 (1H, s), 12,17 (1H, s).

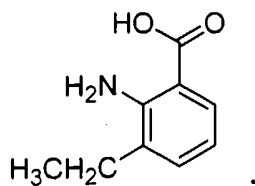
Exemplo de Preparação de Referência 94-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 63-(2), foi utilizada N-(2-etilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida em vez de N-(3-cloro-2-metilfenil)-2-(hidroxiimino)acetamida para obter em bruto 7-etil-1H-indole-2,3-diona da fórmula:



Exemplo de Preparação de Referência 94-(3)

Uma mistura de 1,0 g de 7-etil-1H-indole-2,3-diona em bruto e 3 mL de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N foi adicionada, gota a gota, a 2 g de peróxido de hidrogénio aquoso (30%) à temperatura ambiente e a mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. A mistura reaccional foi ajustada a pH 4 por adição de ácido clorídrico 2 N e um precipitado depositado foi recolhido por filtração. O bolo de filtração resultante foi partilhado entre acetato de etilo e uma solução saturada de hidrogenocarbonato de sódio. A camada aquosa foi ajustada a pH 4 por adição de ácido clorídrico 2 N e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,42 g de ácido 2-amino-3-etilbenzóico da fórmula:

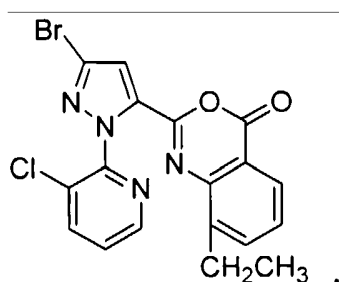


Ácido 2-amino-3-etilbenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 1,15 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,44-2,53 (2H, m), 6,50 (1H, dd, $J=8$ Hz, 7 Hz), 7,15 (1H, d, $J=7$ Hz), 7,62 (1H, d, $J=8$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 94-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-etilbenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-etil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



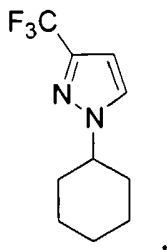
2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-etil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ : 0,81 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,07 (2H, q, $J=7$ Hz), 7,47-7,57 (2H, m), 7,70 (1H, d, $J=7$ Hz), 7,79 (1H,

dd, J=8,5 Hz), 7,95 (1H, d, J=7 Hz), 8,37 (1H, d, J=8 Hz), 8,64 (1H, d, J=5 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 95-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 67-(1), foi utilizado cloridrato de ciclo-hexil-hidrazina em vez de cloridrato terc-butil-hidrazina para obter 1-ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazole da fórmula:

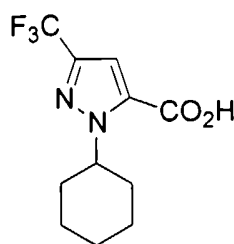


1-Ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,19-1,33 (3H, m), 1,67-1,77 (2H, m), 1,93-1,99 (4H, m), 2,16-2,19 (1H, m), 4,13-4,20 (1H, m), 6,49 (1H, s), 7,45 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 95-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 15, foi utilizado 1-ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazole em vez de 3-cloro-2-(3-trifluorometil-1H-pirazole-1-il)piridina para obter ácido 1-ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

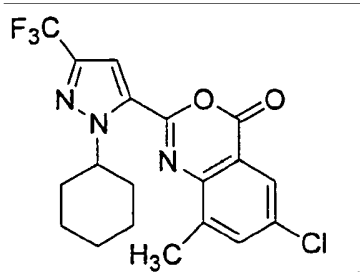


Ácido 1-ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,26-2,00 (10H, m), 5,10-5,18 (1H, m), 7,15 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 95-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-(1-ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

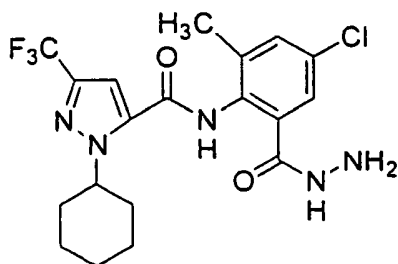


6-Cloro-2-(1-ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,26-1,54 (4H, m), 1,77 (1H, d, $J=2$ Hz), 1,96-2,62 (5H, m), 2,62 (3H, s), 5,51-5,58 (1H, m), 7,31 (1H, s), 7,69 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,07 (1H, d, $J=2$ Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 95-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 6-cloro-2-(1-ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il)-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

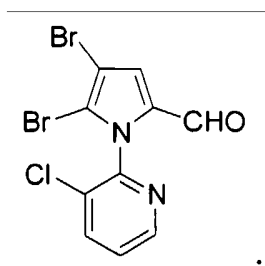


N-[4-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-ciclo-hexil-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 1,20-1,39 (3H, m), 1,66 (1H, d, $J=12$ Hz), 1,75-1,84 (4H, m), 1,98 (2H, d, $J=10$ Hz), 2,25 (3H, s), 4,36 (2H, sl), 5,03-5,09 (1H, m), 7,35 (2H, s), 7,52 (1H, s), 9,62 (1H, sl), 10,17 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 96-(1)

A uma solução de 1,0 g de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina em 15 mL de N,N-dimetilformamida, foi adicionado 1,9 g de N-bromossuccinimida. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 1,2 g de 4,5-dibromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



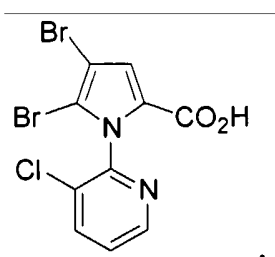
4,5-Dibromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,14 (1H, s), 7,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,93 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,53 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,33 (1H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 96-(2)

A uma mistura de 1,0 g de 4,5-dibromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído, 15 mL de acetona e 7 mL de

água foi lentamente adicionado 1,3 g de permanganato de potássio a 40 °C. A mistura resultante foi agitada a 60 °C durante 2 horas. Os precipitados na mistura reaccional foram removidos por filtração. O filtrado resultante foi lavado duas vezes com clorofórmio. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e, em seguida, extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e, em seguida, concentradas sob pressão reduzida para obter 0,69 g de ácido 4,5-dibromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:



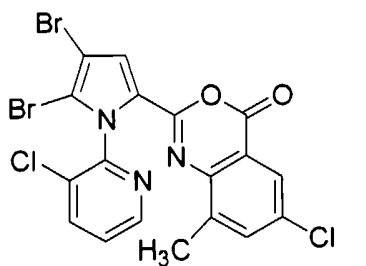
Ácido 4,5-dibromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,15 (1H, m), 7,64 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,19 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,56 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 96-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 4,5-dibromo-1-(3-

cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 2-[4,5-dibromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

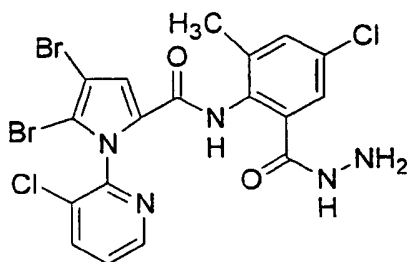


2-[4,5-Dibromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,72 (3H, s), 7,40 (2H, s), 7,48 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,92 (1H, s), 7,98 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,58 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 96-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[4,5-dibromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4,5-dibromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

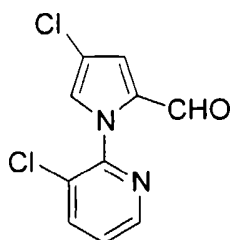


4,5-Dibromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

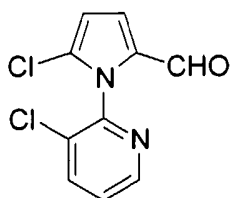
RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 4,03 (2H, sl), 7,15 (1H, s), 7,22 (1H, d, $J=3$ Hz), 7,25 (1H, d, $J=3$ Hz), 7,37 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,70 (1H, sl), 7,86 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,47 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,50 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 97-(1)

A uma solução de 1,0 g de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina em 15 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 0,68 g de N-clorossuccinimida. A mistura resultante foi agitada a 50 °C durante 2 dias. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,35 g de 4-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



e 0,31 g de 5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



4-Cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

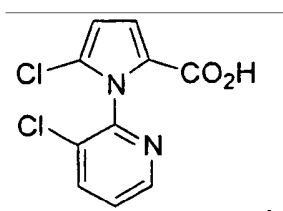
RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,04 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,10 (1H, dd, $J=2$ Hz, 1 Hz), 7,41 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,89 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,46 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,50 (1H, d, $J=1$ Hz)

5-Cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,41 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,08 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,45 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,92 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,54 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,41 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 97-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

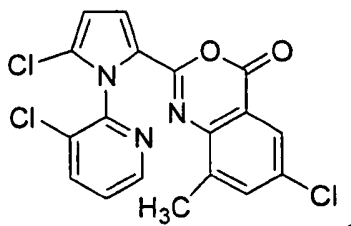


Ácido 5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,39 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,01 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,62 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,13 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,54 (1H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 97-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 2-[5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

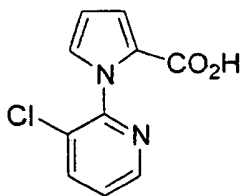


2-[5-Cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,71 (3H, s), 6,43 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,32 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,38 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,92 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,97 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,59 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 98-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

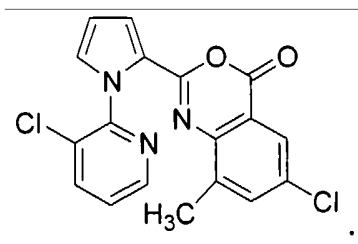


Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 6,33-6,34 (1H, m), 6,97 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,18 (1H, sl), 7,54 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,10 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,47-8,49 (1H, m)

Exemplo de Preparação de Referência 98-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

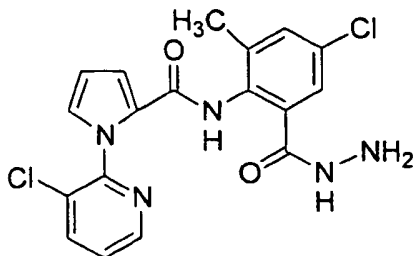


2-[1-(3-Cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,73 (3H, s), 6,50 (1H, dd, $J=4$ Hz, 3 Hz), 7,09 (1H, dd, $J=3$ Hz, 2 Hz), 7,36 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz), 7,39 (1H, s), 7,41 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,90 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 7,93 (1H, s), 8,52 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 98-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:



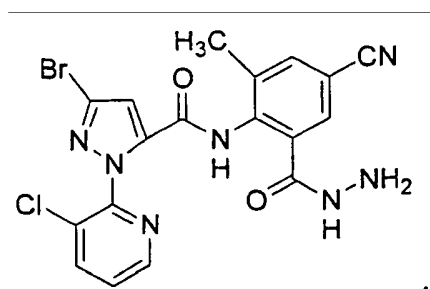
N-[4-Cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 4,40 (2H, sl), 6,37 (1H, dd, $J=4$ Hz, 3 Hz), 7,13-7,16 (2H, m), 7,31 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,41 (1H, sl), 7,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,02 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,42 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,56 (1H, sl), 9,84 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 99

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-ciano-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-

ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



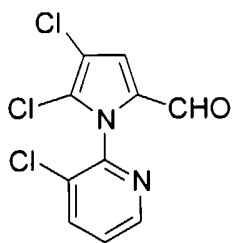
3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO-d_6) δ : 2,19 (3H, s), 4,41 (2H, sl), 7,41 (1H, s), 7,61 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,72 (1H, s), 7,88 (1H, s), 8,17 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,65 (1H, sl), 10,52 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 100-(1)

A uma solução de 3,0 g de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina em 10 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 4,5 g de N-clorossuccinimida. A mistura resultante foi agitada a 50 °C durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas

sob pressão reduzida para obter 3,6 g de 4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

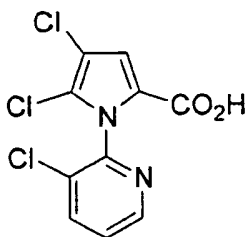


4,5-Dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,06 (1H, s), 7,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,93 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,53 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,37 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 100-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

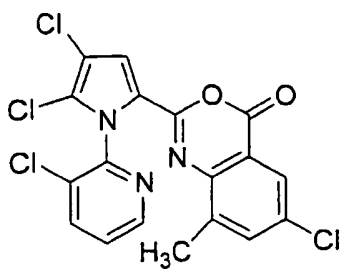


Ácido 4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,18 (1H, s), 7,68 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,25 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,59 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 100-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 2-[4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

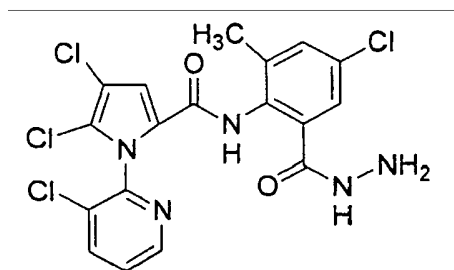


2-[4,5-Dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,71 (3H, s), 7,31 (1H, s), 7,40 (1H, s), 7,49 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,92 (1H, s), 7,98 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,58 (1H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 100-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4,5-dicloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:



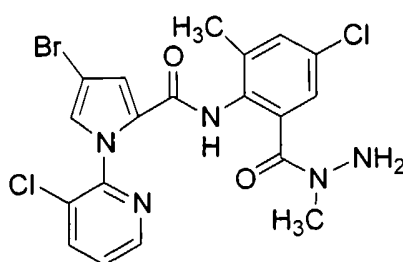
4,5-Dicloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,01 (3H, s), 4,03 (2H, sl), 7,07 (1H, s), 7,16 (1H, d, J=2 Hz), 7,22 (1H, d, J=2 Hz), 7,37 (1H, dd, J=8 Hz, 5 Hz), 7,47 (1H, sl), 7,86 (1H, dd, J=8 Hz, 2 Hz), 8,47 (1H, dd, J=5 Hz, 2 Hz), 9,41 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 101

Uma mistura de 0,86 g de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,11 g de metil-hidrazina e 15 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água

para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 0,17 g de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

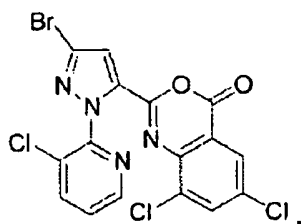


4-Bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,14-2,16 (3H, m), 3,02-3,23 (3H, m), 4,04 (0,7H, sl), 4,60 (1,3H, sl), 7,03 (2H, s), 7,11 (0,5H, s), 7,19 (0,5H, s), 7,31 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,80 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,41 (1H, d, $J=4$ Hz), 8,56 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 102

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3,5-diclorobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

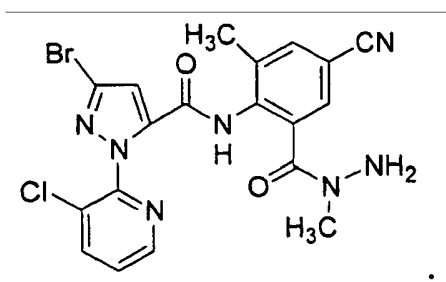


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,57 (1H, s), 7,73 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,03 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,12 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,32 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,60 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 103

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 84, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-ciano-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

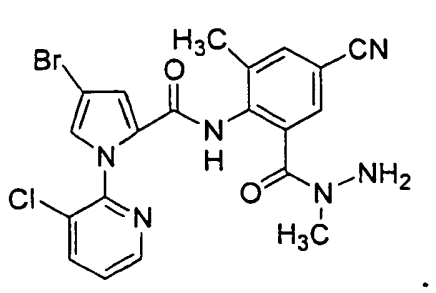


3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 2,75-3,10 (3H, m), 4,51-5,03 (2H, m), 7,36 (1H, s), 7,60-7,71 (2H, m), 7,74-7,88 (1H, m), 8,20 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,51 (1H, d, $J=4$ Hz), 10,27-10,63 (1H, m)

Exemplo de Preparação de Referência 104

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 101, foi utilizada 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-ciano-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:



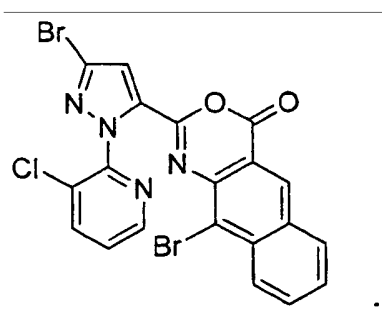
4-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,21 (3H, s), 2,74-3,10 (3H, m), 4,51-4,99 (2H, m), 7,22-7,28 (1H, m), 7,46-7,56 (2H,

m), 7,56-7,65 (1H, m), 7,70-7,84 (1H, m), 8,09 (1H, d, J=8 Hz), 8,44 (1H, d, J=4 Hz), 9,76-10,04 (1H, m)

Exemplo de Preparação de Referência 105-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 3-amino-4-bromo-2-naftóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzoico para obter 10-bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona da fórmula:



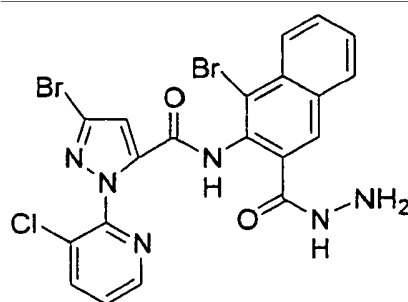
10-Bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,55 (1H, s), 7,72-7,79 (2H, m), 7,89 (1H, t, J=8 Hz), 8,23 (1H, d, J=8 Hz), 8,32 (1H, d, J=8 Hz), 8,37 (1H, dd, J=8 Hz, 1 Hz), 8,63 (1H, dd, J=5 Hz, 1 Hz), 8,93 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 105-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 10-bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-

piridinil)-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 3-bromo-N-[1-bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

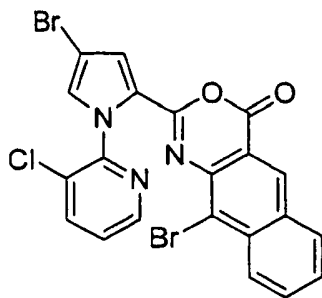


3-Bromo-N-[1-bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 4,37 (2H, sl), 7,52 (1H, s), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,69 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,77 (1H, t, $J=8$ Hz), 8,04-8,09 (2H, m), 8,15 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,50 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,63 (1H, sl), 10,65 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 106-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 3-amino-4-bromo-2-naftóico em vez de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico para obter 10-bromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona da fórmula:

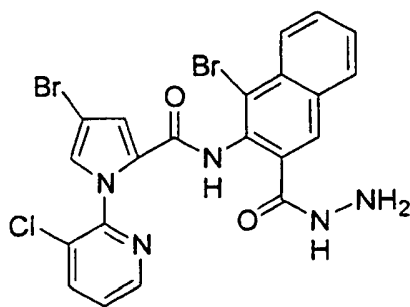


10-Bromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,33 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,65-7,75 (3H, m), 7,84 (1H, t, $J=8$ Hz), 8,17 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,28 (2H, d, $J=8$ Hz), 8,57-8,61 (1H, m), 8,87 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 106-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 10-bromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4-bromo-N-[1-bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

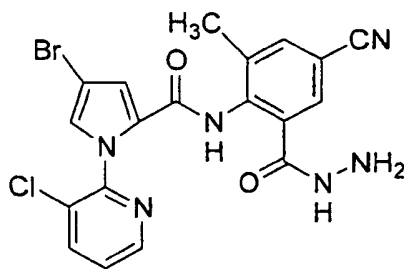


4-Bromo-N-[1-bromo-3-(hidrazinocarbonil)-2-naftil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 4,37 (2H, sl), 7,40 (1H, s), 7,43-7,52 (2H, m), 7,66 (1H, t, $J=7$ Hz), 7,75 (1H, t, $J=7$ Hz), 8,01-8,08 (3H, m), 8,20 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,43 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,55 (1H, sl), 10,12 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 107

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-ciano-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:



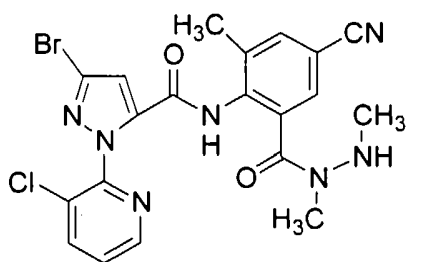
4-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,18 (3H, s), 4,42 (2H, sl), 7,28 (1H, s), 7,45-7,55 (2H, m), 7,71 (1H, s), 7,84 (1H,

s), 8,07 (1H, d, J=8 Hz), 8,44 (1H, d, J=4 Hz), 9,68 (1H, sl), 10,16 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 108

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 88, foi utilizada 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-ciano-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

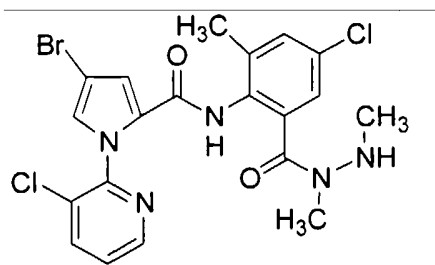


3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,14-2,33 (6H, m), 2,70-3,09 (3H, m), 4,55-6,05 (1H, m), 7,37 (1H, s), 7,58-7,66 (2H, m), 7,71-7,90 (1H, m), 8,15-8,21 (1H, m), 8,48-8,52 (1H, m), 10,25-10,62 (1H, m)

Exemplo de Preparação de Referência 109

A uma mistura de 0,29 g de dicloridrato de N,N'-dimetil-hidrazina, 1 mL de água, 0,31 g de carbonato de potássio e 10 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 1,0 g de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 6 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 0,26 g de 4-bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

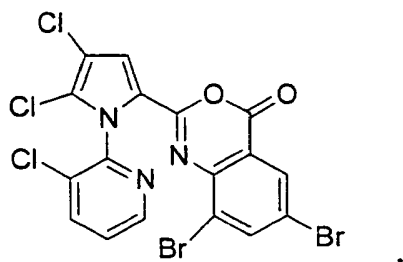


4-Bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 2,43 (1H, d, $J=6$ Hz), 2,61 (2H, d, $J=6$ Hz), 2,95 (2H, s), 3,19 (1H, s), 3,54 (0,3H, d, $J=6$ Hz), 5,62 (0,7H, d, $J=6$ Hz), 7,01-7,07 (3H, m), 7,14-7,18 (1H, m), 7,30 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,79 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,40 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,56 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 110-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foram utilizados ácido 4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico respectivamente para obter 6,8-dibromo-2-[4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



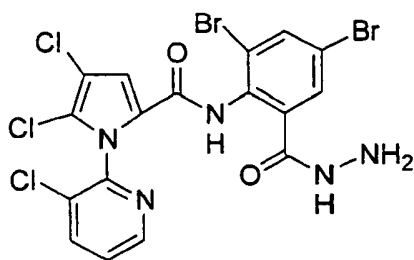
6,8-Dibromo-2-[4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,36 (1H, s), 7,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,95 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,99 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,19 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,57 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 110-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 6,8-dibromo-2-[4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-

cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

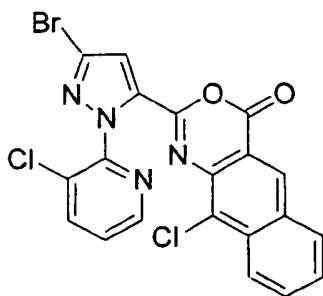


N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 4,40 (2H, sl), 6,47 (1H, s), 7,65 (1H, s), 7,75-7,76 (1H, m), 7,89 (1H, s), 8,05-8,06 (1H, m), 8,27-8,28 (1H, m), 9,64 (1H, sl), 10,20 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 111

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 3-amino-4-cloro-2-naftóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona da fórmula:

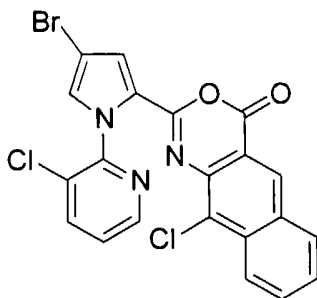


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,56 (1H, s), 7,73-7,81 (2H, m), 7,89 (1H, t, $J=8$ Hz), 8,23 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,34 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,37 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,64 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 8,89 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 112

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 3-amino-4-cloro-2-naftóico em vez de ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico para obter 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona da fórmula:

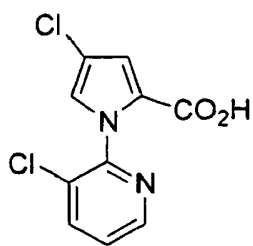


2-[4-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,33 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,67-7,73 (2H, m), 7,74 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,82-7,87 (1H, m), 8,17 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,26-8,31 (2H, m), 8,59 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz), 8,84 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 113-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizada 4-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 4-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

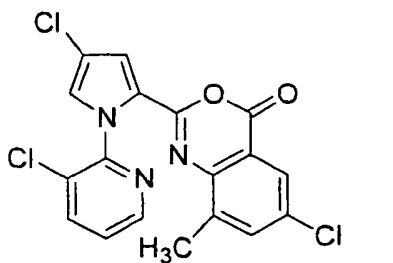


Ácido 4-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,97 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,48 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,16 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,50 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 113-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 4-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 2-[4-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



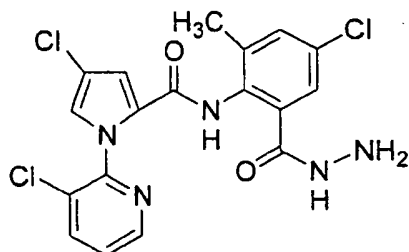
2-[4-Cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,73 (3H, s), 7,03 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,26 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,41 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,43 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,91 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 7,94 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 113-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[4-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4-cloro-

N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

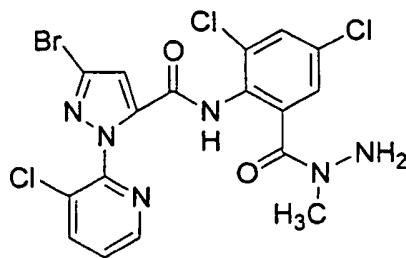


4-Cloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,19 (3H, s), 6,97 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,00 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,26 (1H, s), 7,30 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,48 (1H, s), 7,79 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,40 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,29 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 114

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 84, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 3-bromo-N-[4,6-dicloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

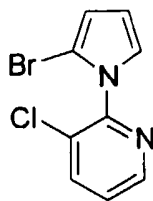


3-Bromo-N-[4,6-dicloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-
1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,76 (0,6H, s), 3,06 (2,4H, s), 4,55 (1,6H, s), 5,02 (0,4H, s), 7,38-7,46 (2,0H, m), 7,60-7,64 (1,0H, m), 7,71 (0,8H, d, $J=2$ Hz), 7,83 (0,2H, d, $J=2$ Hz), 8,17-8,20 (1,0H, m), 8,51 (1,0H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 10,38 (0,8H, s), 10,64 (0,2H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 115-(1)

A uma solução de 3,0 g de 3-cloro-2-(1H-pirrol-1-il)piridina em 30 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 3,1 g de N-bromossuccinimida. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 6 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 1,1 g de 2-(2-bromo-1H-pirrol-1-il)-3-cloropiridina da fórmula:

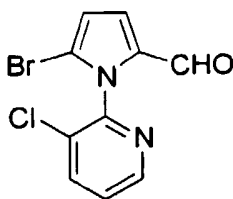


2-(2-Bromo-1H-pirrol-1-il)-3-cloropiridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,37-6,41 (2H, m), 6,93 (1H, dd, $J=3$ Hz, 2 Hz), 7,38 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,91 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,52 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 115-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(2), foi utilizada 2-(2-bromo-1H-pirrol-1-il)-3-cloropiridina em vez de 3-cloro-2-(1H-pirrol-1-il)piridina para obter 5-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

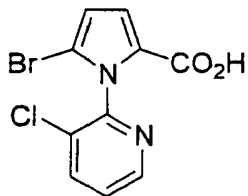


5-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,53 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,07 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,45 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,92 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,54 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,36 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 115-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 5-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 5-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

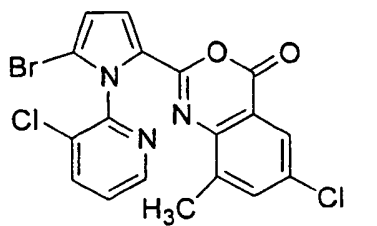


Ácido 5-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,54 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,02 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,63 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,21 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,56 (1H, d, $J=5$ Hz), 12,54 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 115-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 5-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 2-[5-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

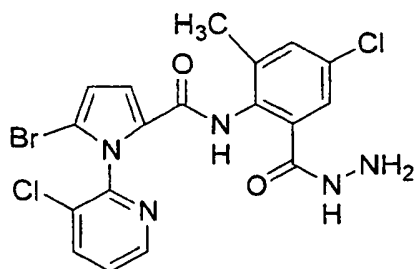


2-[5-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,57 (3H, s), 6,55 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,33 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,38 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,92 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,97 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,59 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 115-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[5-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 5-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

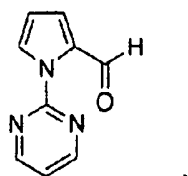


5-Bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,17 (3H, s), 4,02 (2H, sl), 6,47 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,03 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,20 (1H, s), 7,27 (1H, s), 7,36 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,86 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,40 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,22 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 116-(1)

Uma mistura de 1,9 g de 2-pirrolecarbaldeído, 2,3 g de 2-cloropirimidina, 7,8 g de carbonato de cézio e 20 mL de N-metilpirrolidona foi agitada a 130 °C durante 13 horas e, em seguida, deixada arrefecer até à temperatura ambiente. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 0,94 g de 1-(2-pirimidinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

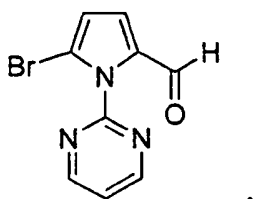


1-(2-Pirimidinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,40-6,41 (1H, m), 7,22 (1H, t, $J=5$ Hz), 7,29 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz), 7,96 (1H, dd, $J=3$ Hz, 2 Hz), 8,73 (2H, d, $J=5$ Hz), 10,61 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 116-(2)

A uma solução de 0,5 g de 1-(2-pirimidinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em 10 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 0,6 g de N-bromossuccinimida. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 0,43 g de 5-bromo-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

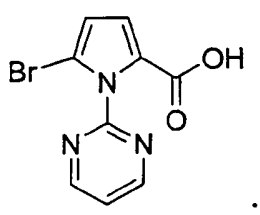


5-Bromo-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 6,67 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,28 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,75 (1H, t, $J=5$ Hz), 9,02 (2H, d, $J=5$ Hz), 9,39 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 116-(3)

Uma solução de 2,0 g de permanganato de potássio em 10 mL de água foi adicionada, gota a gota, a uma mistura de 0,76 g de 5-bromo-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído e 18 mL de acetona, enquanto a mistura era mantida a 40 °C. A mistura resultante foi agitada a 40 °C durante 4 horas. Um precipitado foi eliminado por filtração para obter um filtrado. O filtrado foi ajustado a pH 10-12 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, lavado duas vezes com clorofórmio. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e, em seguida, extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,28 g de ácido 5-bromo-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

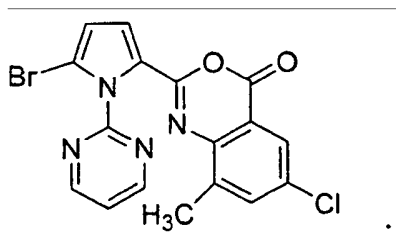


Ácido 5-bromo-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,40-6,51 (1H, m), 6,89-7,16 (1H, m), 7,66-7,75 (1H, m), 8,99 (2H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 116-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 5-bromo-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 2-[5-bromo-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

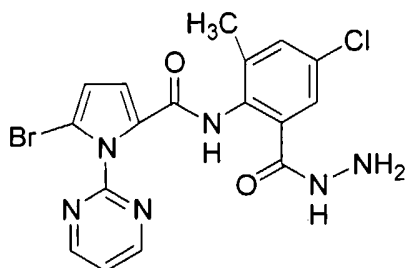


2-[5-Bromo-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,67 (3H, s), 6,62 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,20-7,30 (1H, m), 7,67-7,72 (1H, m), 7,77-7,88 (2H, m), 9,06-9,12 (2H, m)

Exemplo de Preparação de Referência 116-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[5-bromo-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 5-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

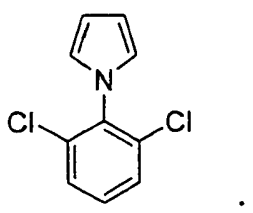


5-Bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-pirimidinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 6,45 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,12 (1H, sl), 7,30 (1H, sl), 7,44 (1H, sl), 7,59-7,66 (1H, m), 8,90-8,95 (2H, m), 9,51 (1H, sl), 9,92 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 117-(1)

Uma mistura de 5 g de 2,6-dicloroanilina, 4,5 g de 2,5-dimetoxitetra-hidrofurano e 30 mL de ácido acético foi aquecida a refluxo durante 10 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer, vertida para água e extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 5,45 g de 1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole da fórmula:

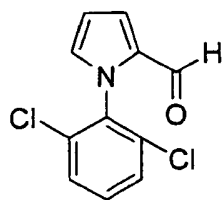


1-(2,6-Diclorofenil)-1H-pirrole

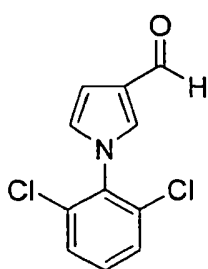
RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,26 (2H, t, $J=2$ Hz), 6,82 (2H, t, $J=2$ Hz), 7,50 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,66 (2H, d, $J=8$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 117-(2)

Sob arrefecimento com gelo, foi adicionado 7,67 g de oxicloreto de fósforo, gota a gota, a 4 g de N,N-dimetilformamida. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos e foi ali adicionado 2,1 g de 1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole. A mistura resultante foi agitada a 60 °C durante 2 horas, deixada arrefecer até à temperatura ambiente e, em seguida, vertida para água gelada. A mistura foi ajustada a pH 4 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 0,80 g de 1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



e 1,00 g de 1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-3-carbaldeído da fórmula:



1-(2,6-Diclorofenil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

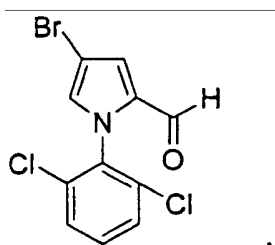
RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,54 (1H, dd, $J=4$ Hz, 3 Hz), 7,29 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz), 7,35 (1H, ddd, $J=3$ Hz, 2 Hz, 1 Hz), 7,53 (1H, dd, $J=9$ Hz, 7 Hz), 7,63-7,67 (2H, m), 9,50 (1H, d, $J=1$ Hz)

1-(2,6-Diclorofenil)-1H-pirrole-3-carbaldeído

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,69 (1H, dd, $J=3$ Hz, 2 Hz), 7,07 (1H, ddd, $J=3$ Hz, 2 Hz, 1 Hz), 7,58 (1H, dd, $J=9$ Hz, 8 Hz), 7,71-7,75 (2H, m), 7,85 (1H, sl), 9,78 (1H, d, $J=1$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 117-(3)

Em 10 mL de N,N-dimetilformamida foi dissolvido 0,65 g de 1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-2-carbaldeído e, em seguida, foi ali adicionado 0,53 g de N-bromossuccinimida. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Foi vertida água para a mistura reaccional, um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,85 g de 4-bromo-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



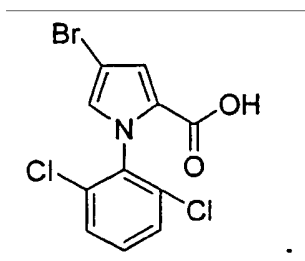
4-Bromo-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,43 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,56 (1H, dd, $J=9$ Hz, 7 Hz), 7,65-7,69 (3H, m), 9,46 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 117-(4)

Uma solução de 2,0 g de permanganato de potássio em 10 mL de água foi adicionada gota a gota a uma mistura de 0,85 g de 4-bromo-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-2-carbaldeído e 18 mL de acetona, enquanto a mistura era mantida a 40 °C. A mistura resultante foi agitada a 40 °C durante 2 horas. Um precipitado foi eliminado por filtração para obter um filtrado. O filtrado foi ajustado a pH 10-12 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, extraído duas vezes com

clorofórmio. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e, em seguida, extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,66 g de ácido 4-bromo-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

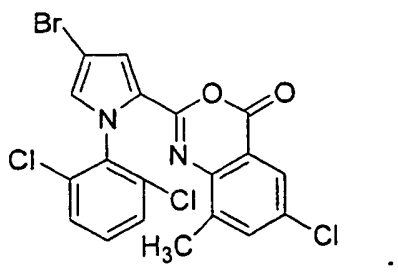


Ácido 4-bromo-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,05 (1H, sl), 7,40 (1H, sl), 7,51 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,60-7,67 (2H, m), 12,65 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 117-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 4-bromo-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 2-[4-bromo-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

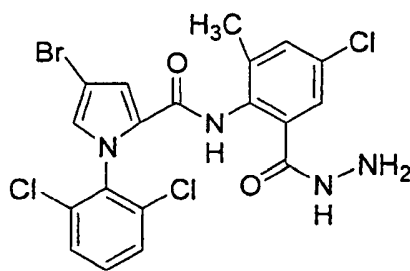


2-[4-Bromo-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,68 (3H, s), 7,32 (1H, d, J=1 Hz), 7,54-7,64 (2H, m), 7,67-7,77 (3H, m), 7,83 (1H, d, J=2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 117-(6)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[4-bromo-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

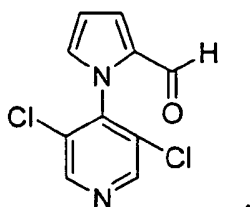


4-Bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,11 (3H, s), 4,38 (2H, sl), 7,27-7,30 (2H, m), 7,34 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,40-7,46 (2H, m), 7,56 (2H, d, $J=8$ Hz), 9,51 (1H, sl), 9,81 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 118-(1)

Uma mistura de 2,6 g de 2-pirrolecarbaldeído, 5,0 g de 3,4,5-tricloropiridina, 10,7 g de carbonato de césio e 30 mL de N-metilpirrolidona foi agitada a 100 °C durante 2 horas e, em seguida, deixada arrefecer até à temperatura ambiente. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 2,14 g de 1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

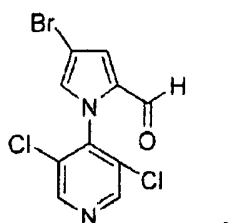


1-(3,5-Dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,61 (1H, dd, $J=4$ Hz, 3 Hz), 7,37 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz), 7,46 (1H, ddd, $J=3$ Hz, 2 Hz, 1 Hz), 8,85 (2H, s), 9,54 (1H, d, $J=1$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 118-(2)

A uma solução de 2,14 g de 1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em 10 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 1,7 g de N-bromossuccinimida. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 2,9 g de 4-bromo-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



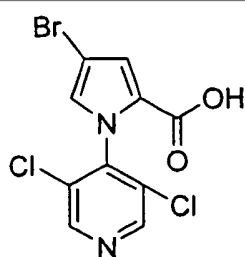
4-Bromo-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,52 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,74 (1H, dd, $J=2$ Hz, 1 Hz), 8,88 (2H, s), 9,51 (1H, d, $J=1$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 118-(3)

Uma solução de 2,9 g de permanganato de potássio em 15 mL de água foi adicionada, gota a gota, a uma mistura de 2,86 g de

4-bromo-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído e 30 mL de acetona, enquanto a mistura era mantida a 40 °C. A mistura foi agitada a 40 °C durante 2 horas. Um precipitado foi eliminado por filtração para obter um filtrado. O filtrado foi ajustado a pH 10-12 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, lavado duas vezes com clorofórmio. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N. Um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 2,08 g de ácido 4-bromo-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:



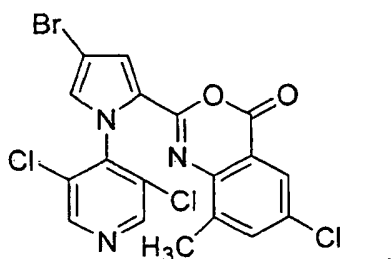
Ácido 4-bromo-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,12 (1H, d, J=2 Hz), 7,51 (1H, d, J=2 Hz), 8,85 (2H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 118-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 4-bromo-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para

obter 2-[4-bromo-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

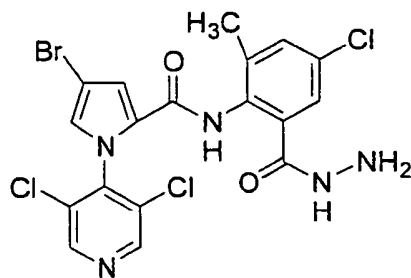


2-[4-Bromo-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,64 (3H, s), 7,39 (1H, sl), 7,72 (2H, s), 7,85 (1H, sl), 8,95 (2H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 118-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[4-bromo-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

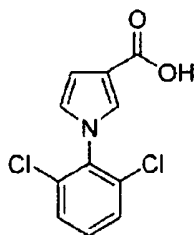


4-Bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3,5-dicloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 4,35 (2H, sl), 7,28 (1H, d, J=2 Hz), 7,37 (1H, d, J=2 Hz), 7,43-7,47 (2H, m), 8,76 (2H, s), 9,52 (1H, sl), 9,89 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 119-(1)

Uma solução de 0,9 g de permanganato de potássio em 10 mL de água foi adicionada, gota a gota, a uma mistura de 0,58 g de 1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-3-carbaldeído e 20 mL de acetona, enquanto a mistura era mantida a 40 °C. A mistura resultante foi agitada a 40 °C durante 2 horas. Um precipitado depositado foi eliminado por filtração para obter um filtrado. O filtrado foi ajustado a pH 10-12 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, lavado duas vezes com clorofórmio. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e, em seguida, extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,34 g de ácido 1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-3-carboxílico da fórmula:

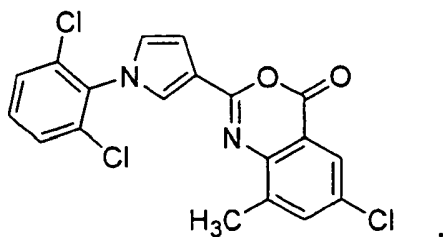


Ácido 1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-3-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,60 (1H, dd, $J=3$ Hz, 2 Hz), 6,92 (1H, dd, $J=3$ Hz, 1 Hz), 7,48 (1H, dd, $J=2$ Hz, 1 Hz), 7,55 (1H, dd, $J=8$ Hz, 7 Hz), 7,67-7,72 (2H, m), 12,05 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 119-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-3-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrol-3-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

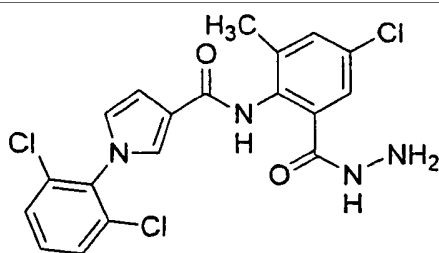


6-Cloro-2-[1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrol-3-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,53 (3H, s), 6,89 (1H, s), 7,10 (1H, s), 7,43-7,64 (2H, m), 7,67-7,77 (2H, m), 7,82-7,91 (2H, m)

Exemplo de Preparação de Referência 119-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 6-cloro-2-[1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrol-3-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-3-carboxamida da fórmula:

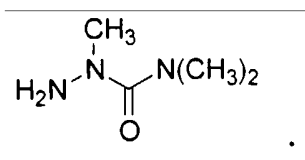


N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2,6-diclorofenil)-1H-pirrole-3-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 4,59 (2H, sl), 6,79 (1H, sl), 6,97 (1H, sl), 7,37 (1H, sl), 7,47-7,59 (3H, m), 7,71 (2H, d, $J=8$ Hz), 9,66 (1H, sl), 9,70 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 120

A uma mistura de 4,61 g de metil-hidrazina, 25 mL de metanol e 4,0 g de hidróxido de sódio foi adicionado, gota a gota, 10,8 g de cloreto de N,N-dimetilcarbamoílo sob arrefecimento com gelo. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. A mistura reaccional foi filtrada e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida. O resíduo foi destilado sob pressão reduzida (90 a 99 °C/22 mmHg) para obter 5,70 g de 2,4,4-trimetilsemicarbazida da fórmula:

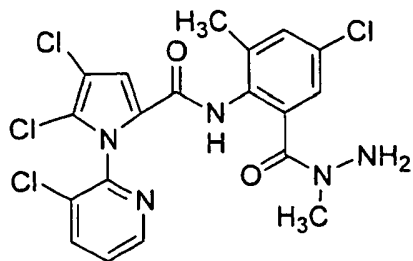


2,4,4-Trimetilsemicarbazida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,90 (6H, s), 2,95 (3H, s), 3,94 (2H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 121

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 101, foi utilizada 2-[4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4,5-dicloro-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

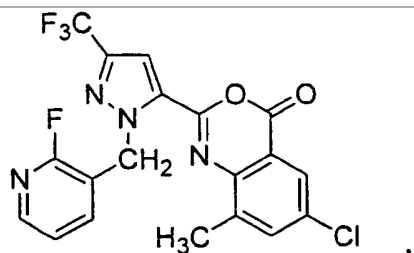


4,5-Dicloro-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,01-2,05 (3H, m), 2,92 (2H, s), 3,21 (1H, s), 4,05 (0,7H, sl), 4,59 (1,3H, sl), 6,95-7,10 (2H, m), 7,19 (0,6H, s), 7,29 (0,4H, s), 7,37 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,86 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,48 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,11 (0,6H, sl), 9,42 (0,4H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 122-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-[(2-fluoro-3-piridinil)metil]-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-[(2-fluoro-3-piridinil)metil]-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

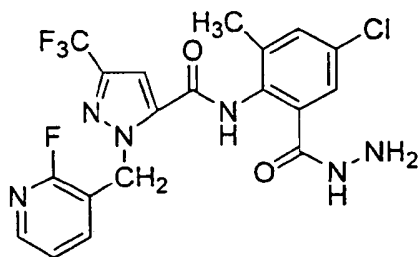


6-Cloro-2-[1-[(2-fluoro-3-piridinil)metil]-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,25 (3H, s), 6,16 (2H, s), 7,30-7,36 (1H, m), 7,39-7,46 (1H, m), 7,69 (1H, s), 7,90 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,98 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,20 (1H, d, $J=4$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 122-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 6-cloro-2-[1-[(2-fluoro-3-piridinil)metil]-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-[(2-fluoro-3-piridinil)metil]-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

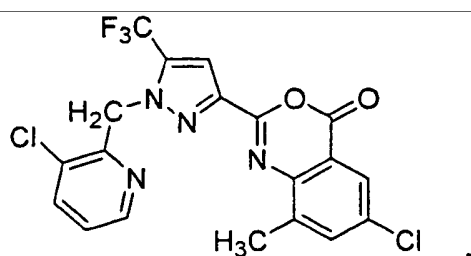


N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-[(2-fluoro-3-piridinil)metil]-3-trifluorometil-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 4,37 (2H, sl), 5,86 (2H, s), 7,32-7,38 (2H, m), 7,50-7,57 (2H, m), 7,57-7,64 (1H, m), 8,16-8,21 (1H, m), 9,62 (1H, sl), 10,28 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 123-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-[(3-cloro-2-piridinil)metil]-5-trifluorometil-1H-pirazole-3-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 2-[1-[(3-cloro-2-piridinil)metil]-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

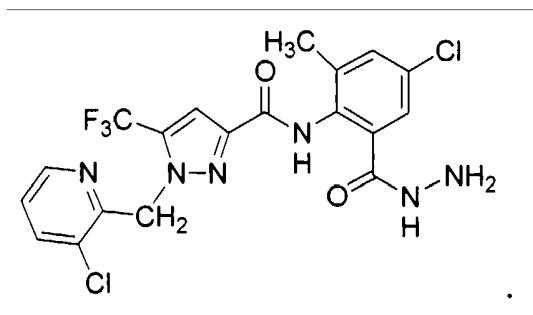


2-[1-[(3-Cloro-2-piridinil)metil]-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,56 (3H, s), 5,92 (2H, s), 7,44 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,67 (1H, s), 7,89-7,95 (2H, m), 8,04 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,42 (1H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 123-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 1, foi utilizada 2-[1-[(3-cloro-2-piridinil)metil]-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-trifluorometil-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-[(3-cloro-2-piridinil)metil]-5-trifluorometil-1H-pirazole-3-carboxamida da fórmula:



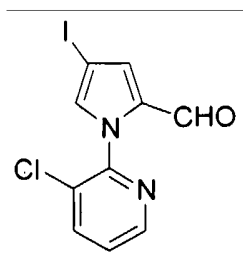
N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-[(3-cloro-2-piridinil)metil]-5-trifluorometil-1H-pirazole-3-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,19 (3H, s), 4,45 (2H, sl), 5,87 (2H, s), 7,37 (1H, sl), 7,41-7,50 (2H, m), 7,52 (1H, sl), 8,04 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,45 (1H, d, $J=4$ Hz), 9,71 (1H, sl), 10,12 (1H, sl)

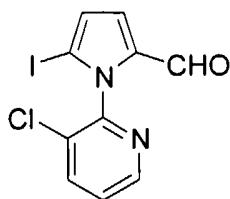
Exemplo de Preparação de Referência 124-(1)

A uma solução de 5,0 g de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina em 50 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado

5,4 g de N-iodossuccinimida. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 1 dia. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 3,2 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-4-iodo-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



e 0,90 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



1-(3-Cloro-2-piridinil)-4-iodo-1H-pirrole-2-carbaldeído

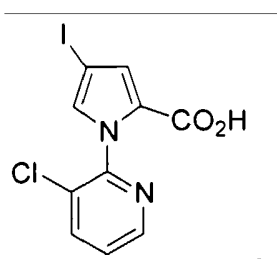
RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,19-7,20 (2H, m), 7,38-7,42 (1H, m), 7,89 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,45-8,47 (1H, m), 9,51 (1H, s)

1-(3-Cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,72 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,04 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,93 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,55 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,26 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 124-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 1-(3-cloro-2-piridinil)-4-iodo-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-4-iodo-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:



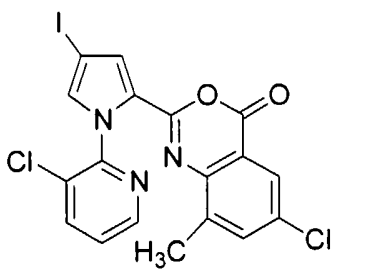
Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-4-iodo-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 7,05 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,45 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,57 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,15 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,49 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 12,65 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 124-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-

piridinil)-4-iodo-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-4-iodo-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

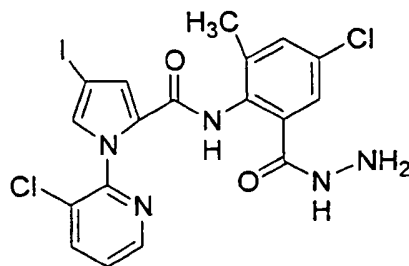


6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-4-iodo-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,67 (3H, s), 7,30 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,61 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,63-7,67 (2H, m), 7,82 (1H, d, $J=3$ Hz), 8,22 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,56 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 124-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-4-iodo-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-4-iodo-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

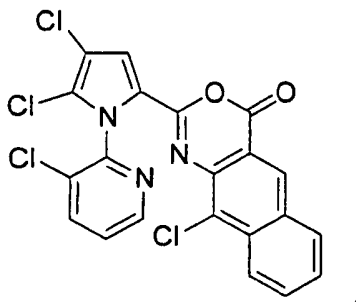


N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-4-iodo-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 4,39 (2H, sl), 7,26 (1H, s), 7,30 (1H, s), 7,39 (1H, s), 7,42 (1H, s), 7,49 (1H, dd, J=8 Hz, 5 Hz), 8,05 (1H, dd, J=8 Hz, 2 Hz), 8,43 (1H, dd, J=5 Hz, 2 Hz), 9,52 (1H, sl), 9,84 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 125

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foram utilizados ácido 4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 3-amino-7-bromo-4-cloro-2-naftóico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico, respectivamente, para obter 10-cloro-2-[4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona da fórmula:

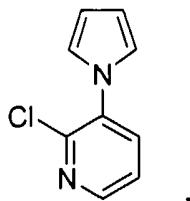


10-Cloro-2-[4,5-dicloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,51 (1H, s), 7,70 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,78 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,84 (1H, t, $J=8$ Hz), 8,16 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,28 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,40 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,68 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 8,82 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 126-(1)

A 30 mL de ácido acético foram adicionados 5,0 g de 2-cloro-3-piridinilamina e 5,6 g de 2,5-dimetoxitetra-hidrofurano, e a mistura foi aquecida a refluxo durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente, vertida para água e, em seguida, extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 6,5 g de 1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole da fórmula:

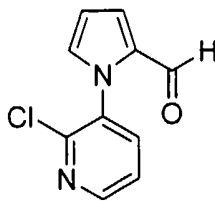


1-(2-Cloro-3-piridinil)-1H-pirrole

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,29 (2H, t, $J=2$ Hz), 7,09 (2H, t, $J=2$ Hz), 7,58 (1H, dd, $J=8\text{H}$, 5 Hz), 7,95 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,45 (1H, dd, $J=5\text{H}$, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 126-(2)

A 14,6 g de N,N-dimetilformamida foi adicionado, gota a gota, 8,3 g de oxicloreto de fósforo sob arrefecimento com gelo. A mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 30 minutos. Foi ali adicionado 6,5 g de 1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole e a mistura resultante foi agitada a 60 °C durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e adicionada a água gelada. A mistura foi ajustada a pH 4 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 6,05 g de 1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

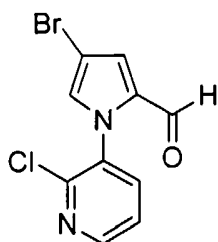


1-(2-Cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,53 (1H, t, $J=2$ Hz), 7,30 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,43 (1H, sl), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,00 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,52 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,51 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 126-(3)

A uma solução de 6,05 g de 1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em 20 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionado 5,72 g de N-bromossuccinimida. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 4,22 g de 4-bromo-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

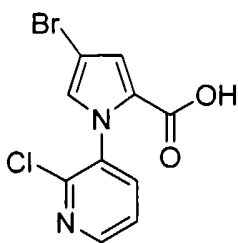


4-Bromo-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,42 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,60 (1H, dd, $J=8\text{H}$, 5 Hz), 7,70 (1H, dd, $J=2\text{H}$, 1 Hz), 8,06 (1H, dd, $J=8\text{H}$, 2 Hz), 8,54 (1H, dd, $J=5\text{H}$, 2 Hz), 9,47 (1H, d, $J=1$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 126-(4)

Uma solução de 4,43 g de permanganato de potássio em 15 mL de água foi adicionada, gota a gota, a uma mistura de 4,22 g de 4-bromo-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído e 30 mL de acetona, enquanto a mistura era mantida a 40 °C. A mistura resultante foi agitada a 40 °C durante 2 horas. Um precipitado foi eliminado por filtração para obter um filtrado. O filtrado foi ajustado a pH 10-12 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, lavado duas vezes com clorofórmio. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e, em seguida, extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 3,02 g de ácido 4-bromo-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

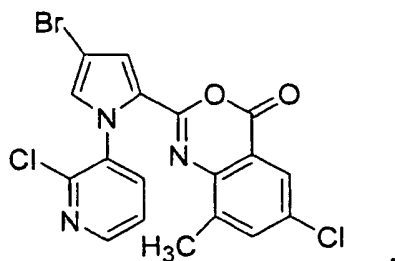


Ácido 4-bromo-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,05 (1H, s), 7,46 (1H, s), 7,57 (1H, dd, $J=8\text{H}$, 4 Hz), 8,02 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, d, $J=4$ Hz), 12,70 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 126-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 4-bromo-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 2-[4-bromo-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

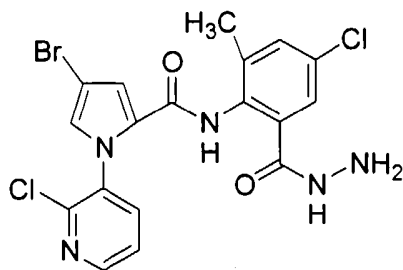


2-[4-Bromo-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,65 (3H, s), 7,31 (1H, s), 7,62-7,73 (3H, m), 7,84 (1H, s), 8,10 (1H, d, $J=6$ Hz), 8,57 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 126-(6)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[4-bromo-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:



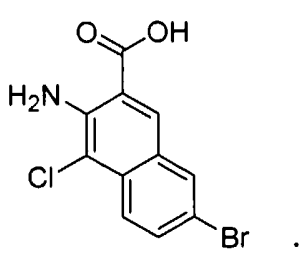
4-Bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-cloro-3-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,14 (3H, s), 4,37 (2H, sl), 7,28 (2H, s), 7,40-7,46 (2H, m), 7,52 (1H, dd, J=8 Hz, 4 Hz), 7,95 (1H, d, J=8Hz), 8,42 (1H, d, J=4 Hz), 9,51 (1H, sl), 9,82 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 127-(1)

A uma mistura de 0,56 g de ácido 3-amino-4-cloro-2-naftóico e 20 mL de ácido acético foi adicionado, gota a gota, 0,4 g de bromo à temperatura ambiente. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Um precipitado depositado

foi recolhido por filtração e o sólido resultante foi lavado sucessivamente com ácido acético e acetato de etilo para obter 0,36 g de ácido 3-amino-7-bromo-4-cloro-2-naftóico da fórmula:

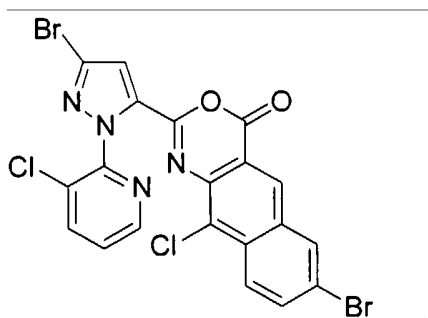


Ácido 3-amino-7-bromo-4-cloro-2-naftóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,70 (1H, d, $J=9$ Hz), 7,81 (1H, d, $J=9$ Hz), 8,24 (1H, s), 8,53 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 127-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 3-amino-7-bromo-4-cloro-2-naftóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 7-bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona da fórmula:

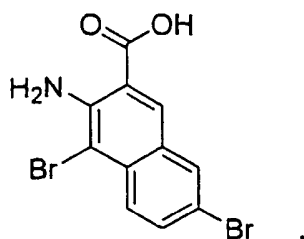


7-Bromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-10-cloro-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,56 (1H, s), 7,75-7,81 (1H, m), 7,99 (1H, d, $J=10$ Hz), 8,14 (1H, d, $J=10$ Hz), 8,37 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,61-8,68 (2H, m), 8,85 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 128-(1)

A uma mistura de 0,47 g de ácido 3-amino-2-naftóico e 20 mL de ácido acético foi adicionado, gota a gota, 0,8 g de bromo à temperatura ambiente. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Um precipitado depositado foi recolhido por filtração e o sólido resultante foi lavado sucessivamente com ácido acético e acetato de etilo para obter 0,61 g de ácido 3-amino-4,7-dibromo-2-naftóico da fórmula:

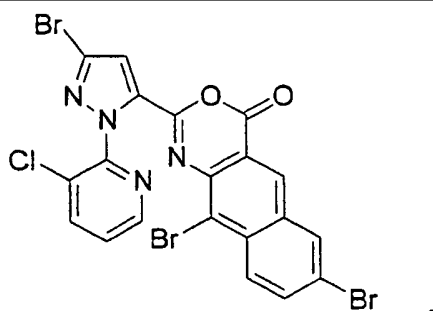


Ácido 3-amino-4,7-dibromo-2-naftóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,70 (1H, dd, $J=9$ Hz, 2 Hz), 7,80 (1H, d, $J=9$ Hz), 8,22 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,57 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 128-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 3-amino-4,7-dibromo-2-naftóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 7,10-dibromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona da fórmula:



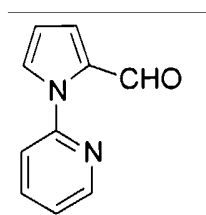
7,10-Dibromo-2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-4H-nafto[2,3-d][1,3]oxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,56 (1H, s), 7,76 (1H, dd, J=8 Hz, 5 Hz), 7,99 (1H, d, J=9 Hz), 8,14 (1H, d, J=9 Hz), 8,37 (1H, d, J=8 Hz), 8,61-8,67 (2H, m), 8,90 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 129-(1)

Uma mistura de 10 g de 2-pirrolecarbaldeído, 10 g de 2-fluoropiridina, 24 g de carbonato de cézio e 100 mL de N-metilpirrolidona foi agitada a 120 °C durante 1 dia. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente. Foi vertida água para a mistura e a mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas,

lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 7,7 g de 1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

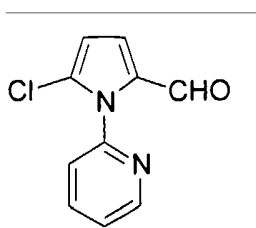


1-(2-Piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,44 (1H, dd, $J=4$ Hz, 3 Hz), 7,21 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz), 7,30-7,33 (1H, m), 7,44-7,47 (2H, m), 7,81-7,86 (1H, m), 8,53 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,77 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 129-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 97-(1), foi utilizado 1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrole-1-il)piridina para obter 5-cloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

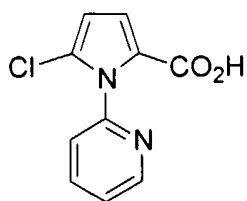


5-Cloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,36 (1H, d, J=4 Hz), 7,07 (1H, d, J=4 Hz), 7,38 (1H, d, J=8 Hz), 7,44 (1H, dd, J=8 Hz, 5 Hz), 7,87-7,91 (1H, m), 8,6,1 (1H, d, J=5 Hz), 9,41 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 129-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 5-cloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 5-cloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:



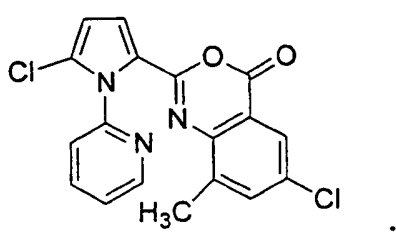
Ácido 5-cloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 6,36 (1H, d, J=4 Hz), 6,98 (1H, d, J=4 Hz), 7,45 (1H, d, J=8 Hz), 7,50-7,53 (1H, m), 7,97-8,00 (1H, m), 8,56 (1H, d, J=5 Hz), 12,34 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 129-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 5-cloro-1-(2-

piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 2-[5-cloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

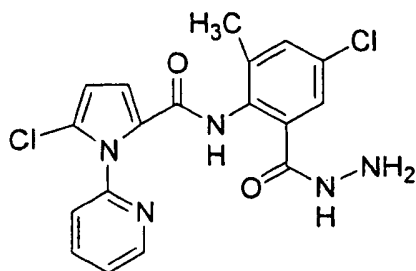


2-[5-Cloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,70 (3H, s), 6,38 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,29 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,38 (1H, s), 7,41-7,49 (2H, m), 7,91-7,94 (2H, m), 8,66 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 129-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[5-cloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 5-cloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

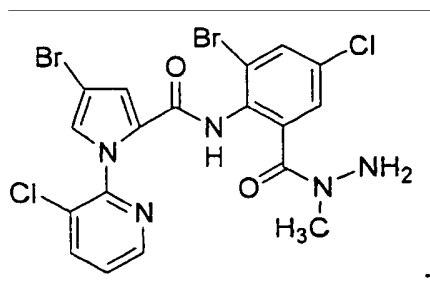


5-Cloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,13 (3H, s), 4,43 (2H, sl), 6,40 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,11 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,30 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,40-7,47 (3H, m), 7,94 (1H, td, $J=7$ Hz, 2 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,51 (1H, sl), 9,85 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 130

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 101, foi utilizada 8-bromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4-bromo-N-[6-bromo-4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

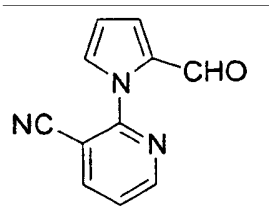


4-Bromo-N-[6-bromo-4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)
fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,96 (1,5H, s), 3,15 (1,5H, s), 4,05 (1H, sl), 4,49 (1H, sl), 7,03 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,16 (1H, dd, $J=7$ Hz, 4 Hz), 7,20 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,29-7,34 (1H, m), 7,47 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,53 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,83-7,79 (1H, m), 8,40-8,43 (1H, m), 8,67 (0,5H, sl), 8,77 (0,5H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 131-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 129-(1), foi utilizada 2-cloro-3-cianopiridina em vez de 2-fluoropiridina para obter 2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)-3-cianopiridina da fórmula:

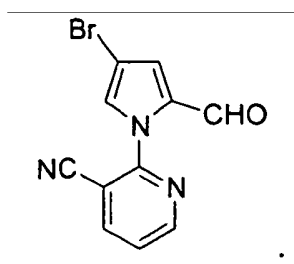


2-(2-Formil-1H-pirrol-1-il)-3-cianopiridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,53 (1H, dd, $J=4$ Hz, 3 Hz), 7,22 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz), 7,29-7,31 (1H, m), 7,51 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,12 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,74 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz) 9,65 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 131-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(3), foi utilizada 2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)-3-cianopiridina em vez de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina para obter 2-(4-bromo-2-formil-1H-pirrol-1-il)-3-cianopiridina da fórmula:

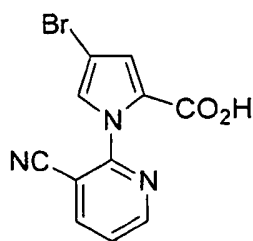


2-(4-Bromo-2-formil-1H-pirrol-1-il)-3-cianopiridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,18 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,29 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,54 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,13 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,74 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,59 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 131-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizada 2-(4-bromo-2-formil-1H-pirrol-1-il)-3-cianopiridina em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 4-bromo-1-(3-ciano-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

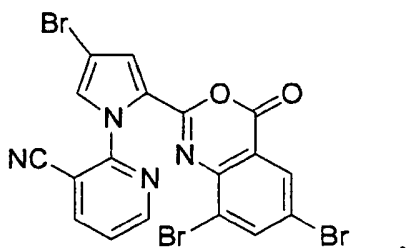


Ácido 4-bromo-1-(3-ciano-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,10 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,65 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,75 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,55 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,82 (1H, dd, $J=5\text{Hz}$, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 131-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foram utilizados ácido 4-bromo-1-(3-ciano-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico, respectivamente, para obter 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-ciano-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

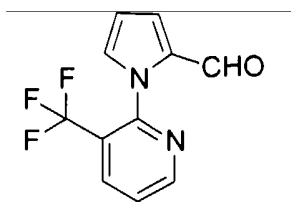


6,8-Dibromo-2-[4-bromo-1-(3-ciano-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,39 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,77 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,81 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,14 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,21 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,58 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,83 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 132-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 129-(1), foi utilizada 2-cloro-3-trifluorometilpiridina em vez de 2-fluoropiridina para obter 1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

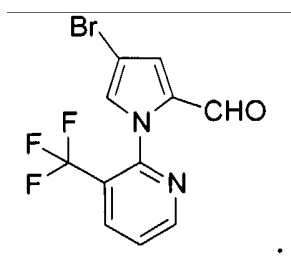


1-(3-Trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 6,47 (1H, dd, $J=4$ Hz, 3 Hz), 7,12-7,14 (2H, m), 7,59 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,18 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,75 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,54 (1H, d, $J=1$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 132-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(3), foi utilizado 1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina para obter 4-bromo-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

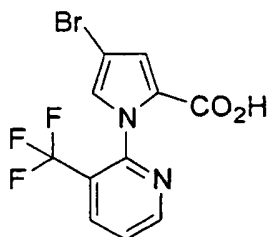


4-Bromo-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,11 (2H, s), 7,62 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,18 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,74 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,47 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 132-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 4-bromo-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 4-bromo-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

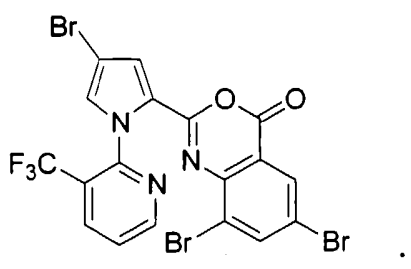


Ácido 4-bromo-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,02 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,56 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,80 (1H, dd, $J=7$ Hz, 5 Hz), 8,42 (1H, d, $J=7$ Hz), 8,82 (1H, d, $J=5$ Hz), 12,66 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 132-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foram utilizados ácido 4-bromo-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico respectivamente para obter 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

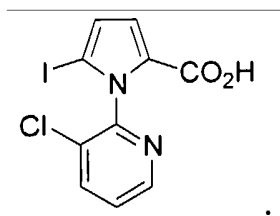


6,8-Dibromo-2-[4-bromo-1-(3-trifluorometil-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,34 (1H, s), 7,71 (1H, s), 7,83 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,10 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,19 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,48 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,84 (1H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 133-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

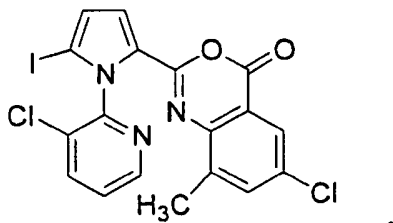


Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,63 (1H, d, $J=4$ Hz), 6,97 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,62 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,20 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,56 (1H, d, $J=5$ Hz), 12,43 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 133-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



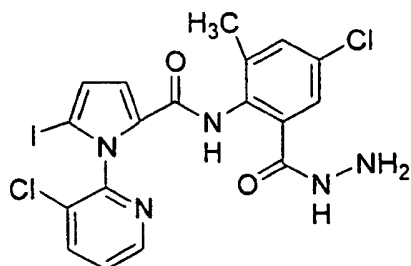
6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,65 (3H, s), 6,82 (1H, d, $J=3$ Hz), 7,23 (1H, d, $J=3$ Hz), 7,67 (1H, s), 7,71 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,81 (1H, s), 8,32 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,65 (1H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 133-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter

N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

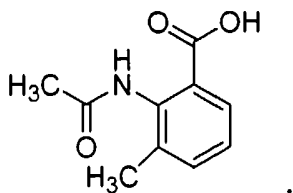


N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-5-iodo-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 4,02 (2H, sl), 6,66 (1H, s), 7,05 (1H, s), 7,19 (1H, s), 7,24 (1H, s), 7,37 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,50 (1H, sl), 7,86 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,49 (1H, d, $J=5$ Hz), 9,28 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 134-(1)

Uma mistura de 1,51 g de ácido 2-amino-3-metilbenzóico, 1,0 g de anidrido acético e 20 mL de tetra-hidrofurano foi agitada a 80 °C durante 13 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente, vertida para água e extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi lavado com acetato de etilo para obter 0,72 g de ácido 2-acetilamino-3-metilbenzóico da fórmula:

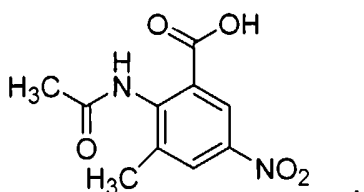


Ácido 2-acetilamino-3-metilbenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,00 (3H, s), 2,19 (3H, s), 7,21 (1H, t, $J=8$ Hz), 7,41 (1H, d, $J=8$ Hz), 7,58 (1H, d, $J=8$ Hz), 9,47 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 134-(2)

A uma mistura de 0,72 g de ácido 2-acetilamino-3-metilbenzóico e 8 mL de ácido sulfúrico concentrado foi adicionado, gota a gota, 1,6 g de ácido nítrico fumante à temperatura ambiente. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. A mistura reaccional foi vertida para água gelada. Um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,45 g de ácido 2-acetilamino-3-metil-5-nitrobenzóico da fórmula:

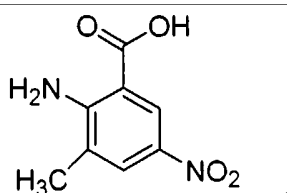


Ácido 2-acetilamino-3-metil-5-nitrobenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,06 (3H, s), 2,34 (3H, s), 8,31 (2H, s), 9,93 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 134-(3)

Uma mistura de 0,45 g de ácido 2-acetilamino-3-metil-5-nitrobenzóico, 0,45 g de hidróxido de potássio, 5 mL de metanol e 20 mL de água foi aquecida a refluxo a 80 °C durante 2 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e foi vertida água para a mistura. A mistura foi ajustada a pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N. Um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 0,28 g de ácido 2-amino-3-metil-5-nitrobenzóico da fórmula:



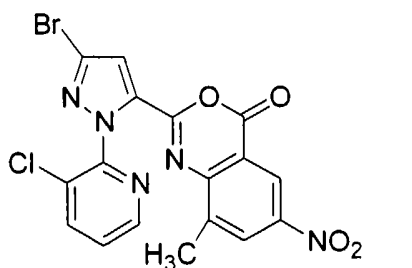
Ácido 2-amino-3-metil-5-nitrobenzóico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,19 (3H, s), 7,99 (1H, s), 8,56 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 134-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-3-metil-5-nitrobenzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para

obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-6-nitro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

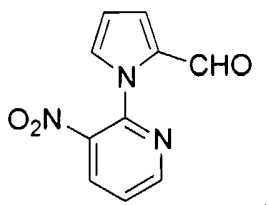


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-6-nitro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,81 (3H, s), 7,64 (1H, s), 7,79 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 8,38 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,48 (1H, s), 8,55 (1H, s), 8,64 (1H, d, $J=4$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 135-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 129-(1), foi utilizada 2-cloro-3-nitropiridina em vez de 2-fluoropiridina para obter 1-(3-nitro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

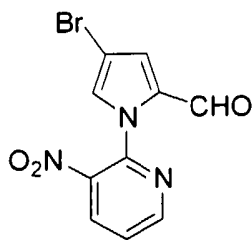


1-(3-Nitro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,54 (1H, dd, $J=4$ Hz, 3 Hz), 7,18 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz), 7,34-7,35 (1H, m), 7,60 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,75 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,48 (1H, d, $J=1$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 135-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(3), foi utilizado 1-(3-nitro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina para obter 4-bromo-1-(3-nitro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



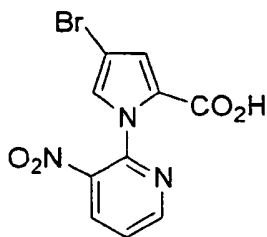
4-Bromo-1-(3-nitro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,14 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,33 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,63 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,53 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,75 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,42 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 135-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 4-bromo-1-(3-nitro-2-

piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 4-bromo-1-(3-nitro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

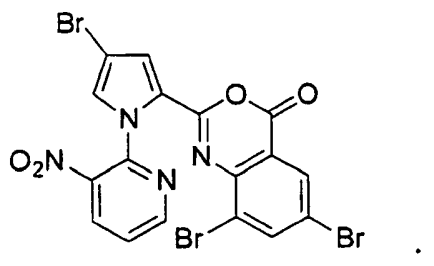


Ácido 4-bromo-1-(3-nitro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,05 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,60 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,84 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,68 (1H, d, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,84 (1H, d, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 135-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foram utilizados ácido 4-bromo-1-(3-nitro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico, respectivamente, para obter 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-nitro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

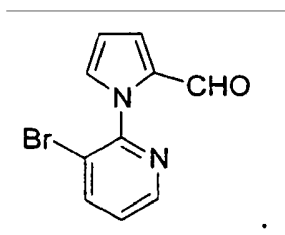


6,8-Dibromo-2-[4-bromo-1-(3-nitro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,38 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,80 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,92 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,11 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,26 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,84 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,65 (1H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 136-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 129-(1), foi utilizada 3-bromo-2-cloropiridina em vez de 2-fluoropiridina para obter 1-(3-bromo-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

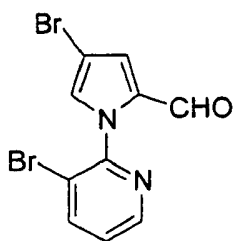


1-(3-Bromo-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,48 (1H, dd, $J=4$ Hz, 3 Hz), 7,10-7,17 (2H, m), 7,31 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,05 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,57 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 136-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(3), foi utilizado 1-(3-bromo-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina para obter 4-bromo-1-(3-bromo-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



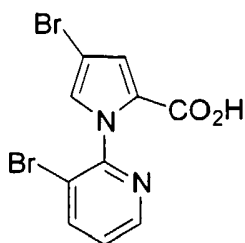
4-Bromo-1-(3-bromo-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,11-7,14 (2H, m), 7,33 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,06 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,50 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,50 (1H, d, $J=1$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 136-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 4-bromo-1-(3-bromo-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido

4-bromo-1-(3-bromo-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

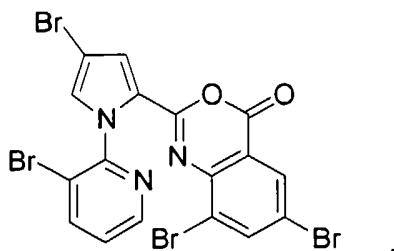


Ácido 4-bromo-1-(3-bromo-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,01 (1H, s), 7,48-7,51 (2H, m), 8,28 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,52 (1H, d, $J=5$ Hz), 12,67 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 136-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foram utilizados ácido 4-bromo-1-(3-bromo-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico, respectivamente, para obter 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-bromo-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

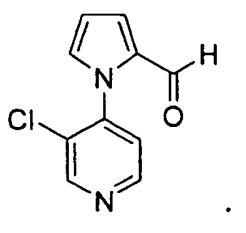


6,8-Dibromo-2-[4-bromo-1-(3-bromo-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,33 (1H, s), 7,53 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,72 (1H, s), 8,12 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,27 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,36 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,57 (1H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 137-(1)

Uma mistura de 2,0 g de 2-pirrole carbaldeído, 3,0 g de 3,4-dicloropiridina, 8,0 g de carbonato de césio e 30 mL de N-metilpirrolidona foi agitada a 120 °C durante 25 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e foi vertida água para a mistura. A mistura foi extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 2,95 g de 1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

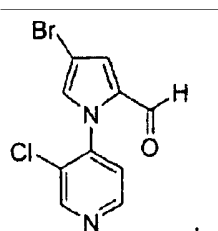


1-(3-Cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,55 (1H, dd, $J=4$ Hz, 3 Hz), 7,33 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz), 7,44 (1H, ddd, $J=3$ Hz, 2 Hz, 1 Hz), 7,60 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,66 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,83 (1H, s), 9,52 (1H, d, $J=1$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 137-(2)

A uma solução de 2,95 g de 1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em 20 mL de N,N-dimetilformamida foi adicionada 2,66 g de N-bromossuccinimida. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 10 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 1,2 g de 4-bromo-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

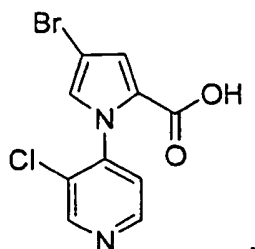


4-Bromo-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (DMSO-d_6 , TMS) δ (ppm): 7,44-7,46 (1H, m), 7,66 (1H, d, $J=5$ Hz), 7,69-7,72 (1H, m), 8,68 (1H, d, $J=5$ Hz), 8,85 (1H, s), 9,47 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 137-(3)

Uma solução de 2,0 g de permanganato de potássio em 10 mL de água foi adicionada, gota a gota, a uma mistura de 1,2 g de 4-bromo-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído e 30 mL de acetona, enquanto a mistura era mantida a 40 °C. A mistura resultante foi agitada a 60 °C durante 1 hora. Um precipitado foi eliminado por filtração para obter um filtrado. O filtrado foi ajustado a pH 10-12 por adição de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N e, em seguida, lavado duas vezes com clorofórmio. A camada aquosa foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N e, em seguida, extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de sódio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 0,43 g de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

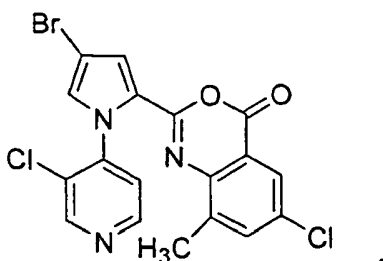


Ácido 4-bromo-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,07 (1H, d, J=2 Hz), 7,47 (1H, d, J=2 Hz), 7,63 (1H, d, J=5 Hz), 8,65 (1H, d, J=5 Hz), 8,81 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 137-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 4-bromo-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 2-[4-bromo-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

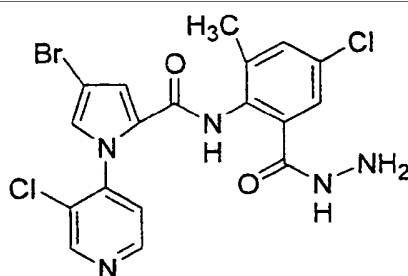


2-[4-Bromo-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,63 (3H, s), 7,33 (1H, d, J=2 Hz), 7,68-7,74 (3H, m), 7,85 (1H, d, J=2 Hz), 8,73 (1H, d, J=5 Hz), 8,91 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 137-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[4-bromo-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4-bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

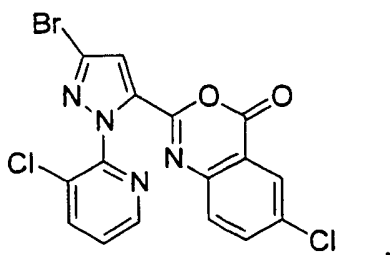


4-Bromo-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(3-cloro-4-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,15 (3H, s), 4,39 (2H, sl), 7,27-7,31 (2H, m), 7,42-7,46 (2H, m), 7,56 (1H, d, J=5 Hz), 8,60 (1H, d, J=5 Hz), 8,72 (1H, s), 9,54 (1H, sl), 9,87 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 138-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 46-(1), foi utilizado ácido 2-amino-5-cloro-benzóico em vez de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico para obter 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

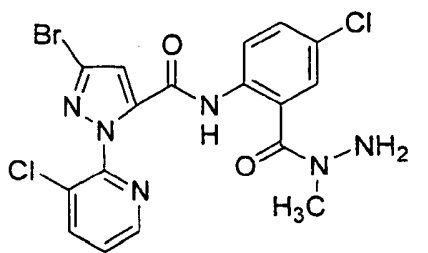


2-[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,01 (1H, d, $J=9$ Hz), 7,53 (1H, s), 7,78 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,88 (1H, dd, $J=9$ Hz, 3 Hz), 8,06 (1H, d, $J=3$ Hz), 8,32 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,60 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz).

Exemplo de Preparação de Referência 139

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 84, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

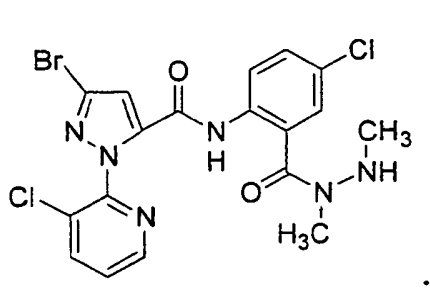


3-Bromo-N-[4-cloro-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,88 (0,6H, s), 3,10 (2,4H, s), 4,71 (1,6H, s), 5,01 (0,4H, s), 7,29-7,34 (1,0H, ml), 7,38-7,52 (3,0H, m), 7,65 (1,0H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,22 (1,0H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,52 (1,0H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 10,40-10,50 (1,0H, ml).

Exemplo de Preparação de Referência 140

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 88, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 3-bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

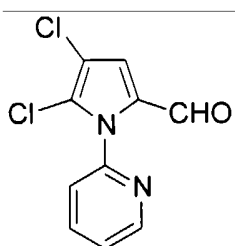


3-Bromo-N-[4-cloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

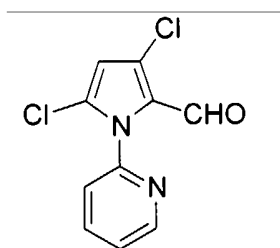
RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,69 (3H, sl), 3,28 (3H, s), 6,92 (1H, s), 7,30-7,46 (3H, m), 7,91 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,17 (1H, d, $J=9$ Hz), 8,49 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 10,29 (1H, sl).

Exemplo de Preparação de Referência 141-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência Exemplo de Preparação 100-(1), foi utilizada 2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina em vez de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina para obter 4,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



e 3,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



4,5-Dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

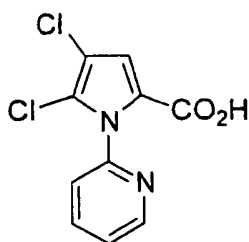
RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,08 (1H, s), 7,38-7,41 (1H, m), 7,47-7,50 (1H, m), 7,91-7,95 (1H, m), 8,63-8,65 (1H, m), 9,40 (1H, s)

3,5-Dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,35 (1H, s), 7,33-7,36 (1H, m), 7,45-7,48 (1H, m), 7,89-7,93 (1H, m), 8,61-8,62 (1H, m), 9,64 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 141-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 4,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 4,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

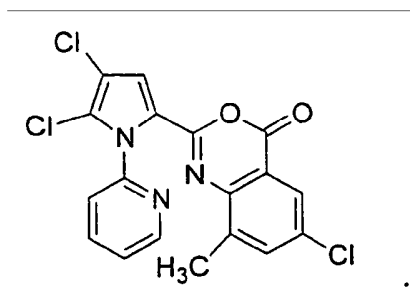


Ácido 4,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 7,11 (1H, s), 7,56-7,58 (2H, m), 8,03 (1H, td, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,58 (1H, dd, $J=4$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 141-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 4,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 6-cloro-2-[4,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



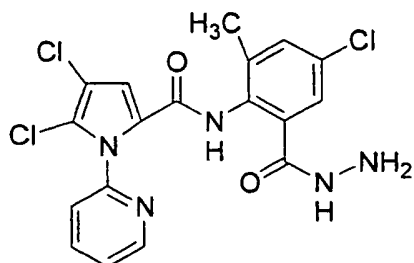
6-Cloro-2-[4,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,07 (3H, s), 7,35 (1H, s), 7,62-7,67 (3H, m), 7,81 (1H, s), 8,11 (1H, t, $J=8$ Hz), 8,65 (1H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 141-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 6-cloro-2-[4,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4,5-dicloro-N-

[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

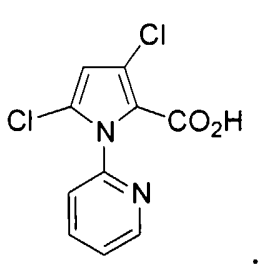


4,5-Dicloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,16 (3H, s), 7,01 (1H, s), 7,25 (2H, s), 7,36-7,41 (2H, m), 7,87 (1H, td, $J=8$ Hz, 2 Hz), 7,95 (1H, sl), 8,55-8,57 (1H, m), 9,42 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 142-(1)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 3,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 3,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

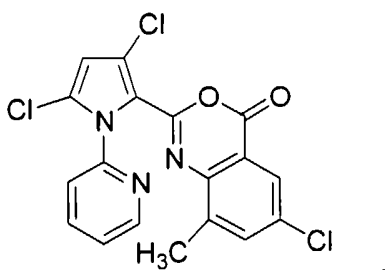


Ácido 3,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 6,64 (1H, s), 7,53-7,57 (2H, m), 8,02 (1H, td, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,55-8,57 (1H, m)

Exemplo de Preparação de Referência 142-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foi utilizado ácido 3,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico para obter 6-cloro-2-[3,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

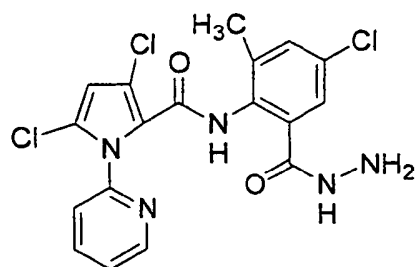


6-Cloro-2-[3,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,82 (3H, s), 6,97 (1H, s), 7,60-7,70 (3H, m), 7,81-7,83 (1H, m), 8,04-8,12 (1H, m), 8,58 (1H, d, $J=6$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 142-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 6-cloro-2-[3,5-dicloro-1-(2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 3,5-dicloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:



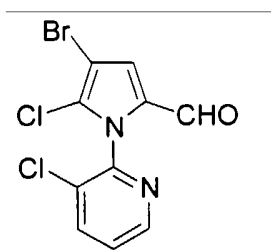
3,5-Dicloro-N-[4-cloro-2-(hidrazinocarbonil)-6-metilfenil]-1-(2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,14 (3H, s), 6,26 (1H, s), 7,20-7,23 (2H, s), 7,28-7,34 (2H, m), 7,61-7,65 (1H, m), 7,76-7,81 (1H, m), 8,49 (1H, sl), 8,79 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 143-(1)

A uma solução de 3,0 g de 3-cloro-2-(4-bromo-2-formil-1H-pirrol-1-il)-piridina em 30 mL de tetra-hidrofurano foi adicionado 1,5 g de N-clorossuccinimida. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 2 dias. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas

vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 2,5 g de 4-bromo-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:

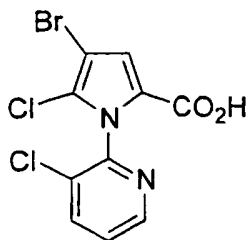


4-Bromo-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,12 (1H, s), 7,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,94 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,53 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,38 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 143-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 4-bromo-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 4-bromo-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:

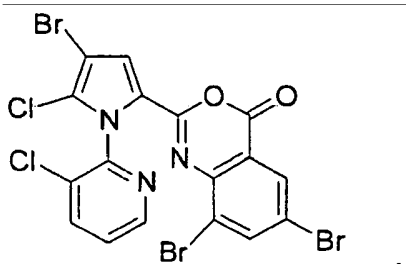


Ácido 4-bromo-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,20 (1H, s), 7,67 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,25 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,58 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 12,99 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 143-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foram utilizados ácido 4-bromo-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico, respectivamente, para obter 2-[4-bromo-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

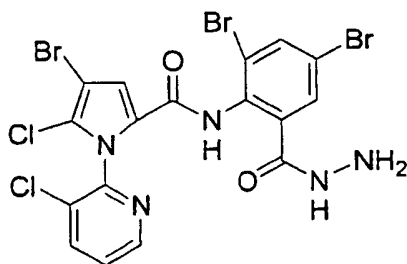


2-[4-Bromo-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-
6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,49 (1H, s), 7,71 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,11 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,26 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,34 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,63 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 143-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(6), foi utilizada 2-[4-bromo-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 4-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-5-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:



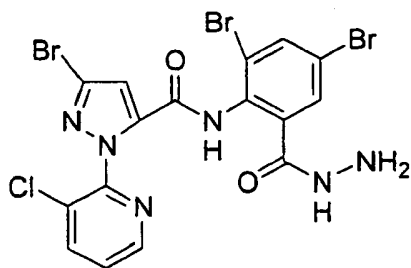
4-Bromo-N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-5-cloro-
1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,21 (1H, s), 7,39 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,42 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,70 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,88

(1H, dd, J=8 Hz, 2 Hz), 8,49 (1H, dd, J=5 Hz, 2 Hz), 8,71 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 144

Sob arrefecimento com gelo, 8,42 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 3,0 g de mono-hidrato de hidrazina e 60 mL de tetra-hidrofurano foram misturados e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Um precipitado depositado foi recolhido por filtração e lavado sucessivamente com tetra-hidrofurano e éter t-butil-metílico para obter 4,85 g de 3-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

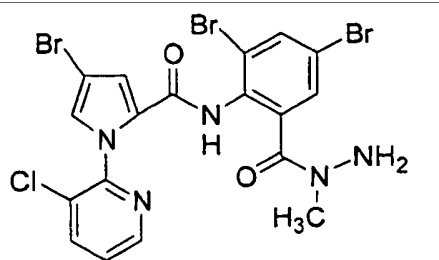


3-Bromo-N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 4,35 (2H, sl), 7,42 (1H, s), 7,58-7,62 (2H, m), 8,07 (1H, d, J=2 Hz), 8,16 (1H, dd, J=8 Hz, 2 Hz), 8,50 (1H, dd, J=5 Hz, 2 Hz), 9,61 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 145

Uma mistura de 0,50 g de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,15 mL de metil-hidrazina e 8 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 20 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 0,39 g de 4-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

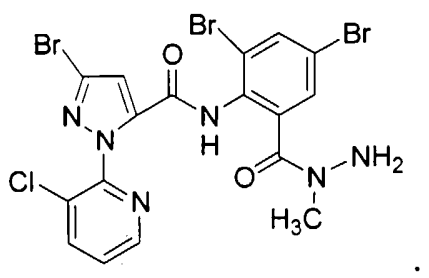


4-Bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,96 (1,5H, s), 3,15 (1,5H, s), 4,05 (1,0H, s), 4,48 (1,0H, s), 7,03 (1,0H, d, $J=2$ Hz), 7,18 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,21 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,29-7,34 (2,0H, m), 7,63 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,68 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,79-7,83 (1,0H, m), 8,40-8,44 (1,0H, m), 8,67 (0,5H, s), 8,77 (0,5H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 146

Uma mistura de 1,0 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,28 mL de metil-hidrazina e 16 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 19 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 0,97 g de 3-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:

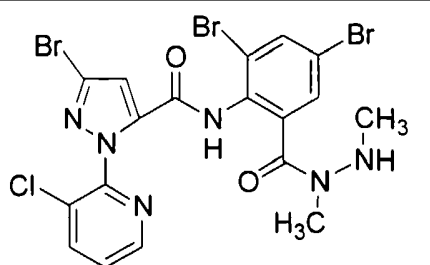


3-Bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N-metil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,97 (1,5H, s), 3,17 (1,5H, s), 3,99 (1,0H, s), 4,51 (1,0H, s), 7,31 (1,0H, d, $J=2$ Hz), 7,35-7,41 (2,0H, m), 7,61 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,67 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,84-7,89 (1,0H, m), 8,45-8,50 (1,0H, m), 9,32 (0,5H, s), 9,45 (0,5H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 147

A uma mistura de 0,42 g de dicloridrato de N,N'-dimetil-hidrazina, cinco gotas de água, 0,87 g de carbonato de potássio e 10 mL de tetra-hidrofurano foi adicionado 0,60 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 19 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 0,51 g de 3-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



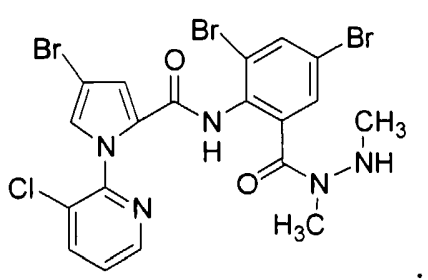
3-Bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,49 (1,5H, d, $J=6$ Hz), 2,58 (1,5H, d, $J=6$ Hz), 2,92 (1,5H, s), 3,11 (1,5H, s), 3,52 (0,5H, q, $J=6$ Hz), 5,43 (0,5H, q, $J=6$ Hz), 7,21 (0,5H, s), 7,24 (0,5H, s), 7,30 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,32 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,35-7,39

(1,0H, m), 7,61 (0,5H, d, J=2 Hz), 7,67 (0,5H, d, J=2 Hz), 7,83-7,87 (1,0H, m), 8,44-8,47 (1,0H, m), 9,24 (0,5H, s), 9,42 (0,5H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 148

A uma mistura de 0,42 g de dicloridrato de N,N'-dimetil-hidrazina, cinco gotas de água, 0,87 g de carbonato de potássio e 10 mL de tetra-hidrofurano foi adicionado 0,59 g de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, seca sobre sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 0,52 g de 4-bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:

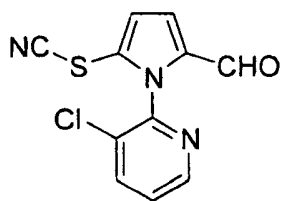


4-Bromo-N-[4,6-dibromo-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida

RMN de ^1H (CDCl_3) δ : 2,47 (1,5H, d, $J=6$ Hz), 2,55 (1,5H, sl), 2,91 (1,5H, s), 3,08 (1,5H, s), 3,54 (0,5H, q, $J=6$ Hz), 5,46 (0,5H, sl), 7,03 (1,0H, d, $J=2$ Hz), 7,10 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,15 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,28-7,32 (2,0H, m), 7,65 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,69 (0,5H, d, $J=2$ Hz), 7,77-7,81 (1,0H, m), 8,39-8,41 (1,5H, m), 8,62 (0,5H, s).

Exemplo de Preparação de Referência 149-(1)

A 10 mL de metanol foram adicionados 1,0 g de 3-cloro-2-(2-formil-1H-pirrol-1-il)piridina e 1,4 g de tiocianato de sódio. Foi ali adicionada, gota a gota, uma solução de 1,0 g de bromo em 5 mL de brometo de sódio saturado-metanol a -20 °C. A mistura resultante foi agitada à mesma temperatura durante 2 horas. A mistura reaccional foi adicionada a 100 mL de água gelada e extraída com clorofórmio duas vezes. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 1,6 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-tiocianato-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



1-(3-Cloro-2-piridinil)-5-tiocianato-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,95 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,16 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,52 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,97 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,57 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,58 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 149-(2)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(4), foi utilizado 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-tiocianato-1H-pirrole-2-carbaldeído em vez de 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carbaldeído para obter ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-tiocianato-1H-pirrole-2-carboxílico da fórmula:



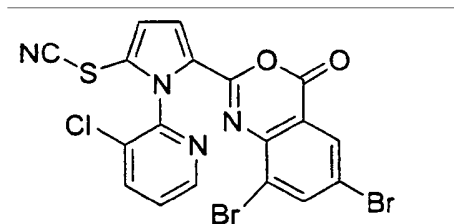
Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-tiocianato-1H-pirrole-2-carboxílico

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, TMS) δ (ppm): 7,07 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,11 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,69 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,27 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,62 (1H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 149-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 71-(5), foram utilizados ácido 1-(3-cloro-2-

piridinil)-5-tiocianato-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico em vez de ácido 4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 2-amino-5-cloro-3-metilbenzóico, respectivamente, para obter 6,8-dibromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-tiocianato-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



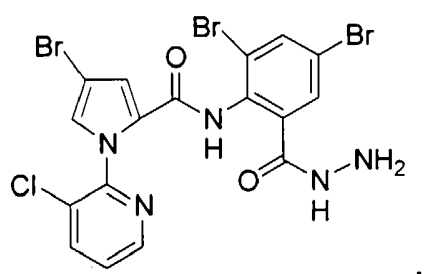
6,8-Dibromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-tiocianato-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,23 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,41 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,72 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,14 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,29 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,34 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,66 (1H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 150

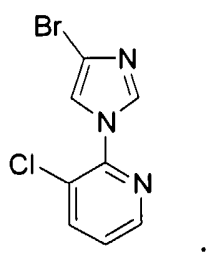
Sob arrefecimento com gelo, foram misturados 0,569 g de 6,8-dibromo-2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona, 0,20 g de mono-hidrato de hidrazina e 2 mL de tetra-hidrofurano, e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída com acetato de etilo. A camada orgânica foi lavada com água, seca sobre sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida para obter 0,53 g de 4-bromo-

N-[4,6-dibromo-2-(hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirrole-2-carboxamida da fórmula:



Exemplo de Preparação de Referência 151-(1)

Uma mistura de 1,0 g de 4-bromoimidazole, 1,3 g de 3-cloro-2-(metanossulfonil)piridina, 2,7 g de carbonato de célio e 10 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada a 100 °C durante 6 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e foi vertida água para a mistura. Um precipitado depositado foi recolhido por filtração para obter 1,7 g de 2-(4-bromo-1H-imidazol-1-il)-3-cloropiridina da fórmula:

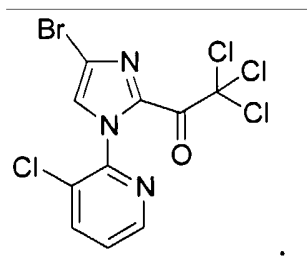


2-(4-Bromo-1H-imidazol-1-il)-3-cloropiridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,33 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,63 (1H, s), 7,93 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,13 (1H, s), 8,45-8,46 (1H, m)

Exemplo de Preparação de Referência 151-(2)

A uma solução de 1,0 g de 2-(4-bromo-1H-imidazol-1-il)-3-cloropiridina em 5 mL de diclorometano foi adicionada, gota a gota, uma solução de 0,45 mL de cloreto de tricloroacetilo em 5 mL de diclorometano à temperatura ambiente. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 1 dia. Foram ali adicionados 0,57 mL de trietilamina e a mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 2 horas. A mistura reaccional foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 1,0 g de 1-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-imidazol-2-il]-2,2,2-tricloroetanona da fórmula:

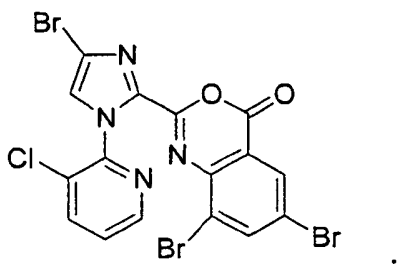


1-[4-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-imidazol-2-il]-2,2,2-tricloroetanona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,35 (1H, s), 7,49 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,95 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 151-(3)

A uma solução de 0,50 g de 1-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-imidazol-2-il]-2,2,2-tricloroetanona e ácido 0,37 g de 2-amino-3,5-dibromobenzóico em 10 mL de acetonitrilo foram adicionados 0,43 mL de trietilamina. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 1 dia. Foram ali adicionados 0,12 mL de cloreto de metanossulfonilo e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,29 g de 2-[4-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-imidazol-2-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

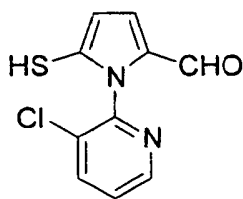


2-[4-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-imidazol-2-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 7,70 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,18 (1H, d, $J=3$ Hz), 8,18 (1H, s), 8,31 (1H, dd, $J=8$ Hz, 1 Hz), 8,33 (1H, d, $J=3$ Hz), 8,59 (1H, dd, $J=5$ Hz, 1 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 152-(1)

Uma mistura de 0,70 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-tiocianato-1H-pirrole-2-carbaldeído, 0,64 g de sulfureto de sódio nona-hidratado e 10 mL de água foi agitada durante 1 hora sob aquecimento a refluxo. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente, ajustada a pH 5 por adição de ácido acético e, em seguida, extraída duas vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi lavado com éter terc-butil-metílico para obter 0,50 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-mercapto-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



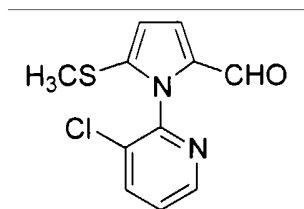
1-(3-Cloro-2-piridinil)-5-mercapto-1H-pirrole-2-carbaldeído

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,56 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,07 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,46 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,93 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,54 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,42 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 152-(2)

Uma mistura de 0,50 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-mercapto-1H-pirrole-2-carbaldeído, 0,36 g de iodeto de metilo,

0,43 g de carbonato de potássio e 50 mL de N,N-dimetilformamida foi agitada à temperatura ambiente durante 1 dia. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas sucessivamente com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,34 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-metiltio-1H-pirrole-2-carbaldeído da fórmula:



1-(3-Cloro-2-piridinil)-5-metiltio-1H-pirrole-2-carbaldeído

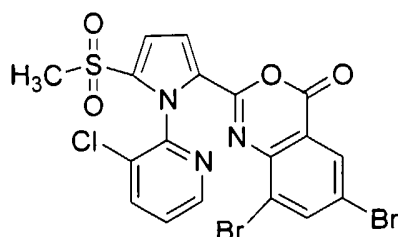
RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,39 (3H, s), 6,45 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,10 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,43 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,90 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,52 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz), 9,41 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 152-(3)

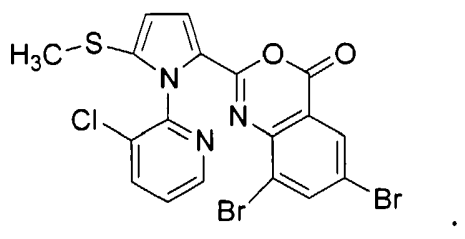
A uma mistura de 0,38 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-metiltio-1H-pirrole-2-carbaldeído, 5 mL de acetona e 3 mL de água foi adicionado 0,38 g de permanganato de potássio a 40 °C. A mistura resultante foi agitada a 50 °C durante 4 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura

ambiente e filtrada. O filtrado foi lavado duas vezes com clorofórmio e, em seguida, ajustado a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 2 N. Um cristal depositado foi recolhido por filtração para obter 0,38 g de uma mistura de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-metilsulfonyl-1H-pirrole-2-carboxílico e ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-5-metiltio-1H-pirrole-2-carboxílico.

Uma mistura da mistura resultante e 0,29 mL de cloreto de tionilo foi aquecida a refluxo em 10 mL de acetonitrilo durante 1 hora. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi dissolvido em 10 mL de acetonitrilo. Foram ali adicionados 0,39 g de ácido 2-amino-3,5-dibromobenzóico e 0,65 mL de trietilamina, e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 6 horas. Foram ali adicionados 0,13 mL de cloreto de metanossulfonyl e a mistura foi agitada à temperatura ambiente durante 1 hora. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido a cromatografia em coluna sobre sílica gel para obter 0,05 g de 6,8-dibromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-metilsulfonyl-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



e 0,05 g de 6,8-dibromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-metiltio-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



6,8-Dibromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-metilsulfonil-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,23 (3H, s), 7,21 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,41 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,50 (1H, dd, $J=8$ Hz, 4 Hz), 7,95 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,02 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,24 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,56 (1H, d, $J=4$ Hz)

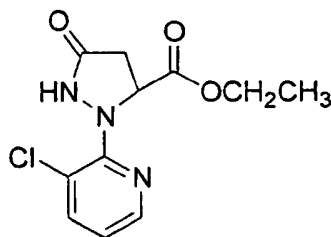
6,8-Dibromo-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-5-metiltio-1H-pirrol-2-il]-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,39 (3H, s), 6,63 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,35 (1H, d, $J=4$ Hz), 7,63 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 8,08 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,22 (1H, d, $J=2$ Hz), 8,25 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,58 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 153-(1)

A uma mistura de 20 g de 3-cloro-2-hidrazinopiridina, 56 mL de etóxido de sódio (uma solução a 21% em etanol) e 75 mL de etanol foram adicionados, gota a gota, 27 mL de maleato de dietilo. A mistura resultante foi aquecida a refluxo durante 10

minutos. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até 65 °C e foram vertidos 15 mL de ácido acético para a mistura. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente. Depois de terem sido vertidos 190 mL de água para a mistura reaccional, a mistura foi ajustada a pH 2 por adição de ácido clorídrico 6 N e, em seguida, extraída três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. Foi adicionado éter dietílico ao resíduo resultante e foi recolhido um sólido por filtração para obter 4,28 g de 2-(3-cloro-2-piridinil)-5-oxo-3-pirazolidinacarboxilato de etilo da fórmula:

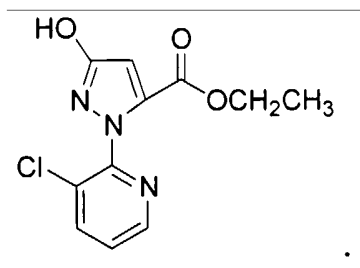


2-(3-Cloro-2-piridinil)-5-oxo-3-pirazolidinacarboxilato de etilo

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,22 (3H, t, $J=7$ Hz), 2,36 (1H, d, $J=17$ Hz), 2,92 (1H, dd, $J=17$ Hz, 10 Hz), 4,20 (2H, q, $J=7$ Hz), 4,83 (1H, d, $J=10$ Hz), 7,20 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,93 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,27 (1H, d, $J=5$ Hz), 10,17 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 153-(2)

A uma mistura de 12,0 g de 2-(3-cloro-2-piridinil)-5-oxo-3-pirazolidinacarboxilato de etilo, 90 mL de acetonitrilo e 4,8 mL de ácido sulfúrico foi adicionado 14,5 g de persulfato de potássio. A mistura resultante foi aquecida a refluxo durante 3,5 horas. A mistura reaccional foi deixada arrefecer até à temperatura ambiente e filtrada. Foi vertida água no filtrado e a mistura foi extraída três vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 7,23 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-hidroxi-1H-pirazole-5-carboxilato de etilo da fórmula:

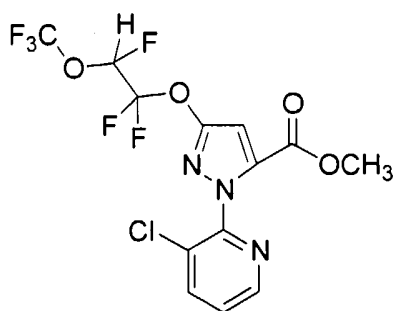


1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-hidroxi-1H-pirazole-5-carboxilato de etilo

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 1,06 (3H, t, $J=7$ Hz), 4,11 (2H, q, $J=7$ Hz), 6,34 (1H, s), 7,59-7,63 (1H, m), 8,17-8,23 (1H, m), 8,50-8,52 (1H, m), 10,65 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 153-(3)

Foi introduzida uma corrente gasosa de éter de trifluorometilo e trifluorovinilo numa mistura de 1,0 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-hidroxi-1H-pirazole-5-carboxilato de etilo, 0,042 g de hidróxido de potássio, 10 mL de metanol e 10 mL de dimetilsulfóxido sob arrefecimento com gelo. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 4 dias. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída duas vezes com éter dietílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com água e uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 1,32 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-[1,1,2-trifluoro-2-(trifluorometoxi)etoxi]-1H-pirazole-5-carboxilato de metilo da fórmula:

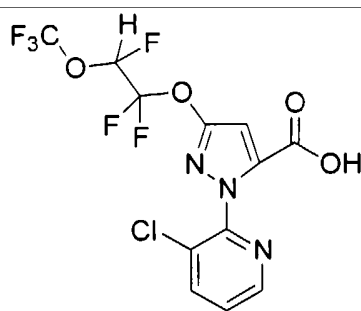


1-(3-Cloro-2-piridinil)-3-[1,1,2-trifluoro-2-(trifluorometoxi)etoxi]-1H-pirazole-5-carboxilato de metilo

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,80 (3H, s), 6,04 (1H, dt, $J=54$ Hz, 3 Hz), 6,80 (1H, s), 7,45 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,92 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,51 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 153-(4)

A uma mistura de 1,32 g de 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-[1,1,2-trifluoro-2-(trifluorometoxi)etoxi]-1H-pirazole-5-carboxilato de metilo e 15 mL de metanol foram adicionados 5 mL de uma solução aquosa de hidróxido de sódio 2 N. A mistura resultante foi agitada à temperatura ambiente durante 3 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi lavada com éter terc-butil-metílico. A camada aquosa foi ajustada a pH 2 por adição de ácido clorídrico 6 N e, em seguida, extraída duas vezes com éter terc-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio anidro e concentradas sob pressão reduzida para obter 1,18 g de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-[1,1,2-trifluoro-2-(trifluorometoxi)etoxi]-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

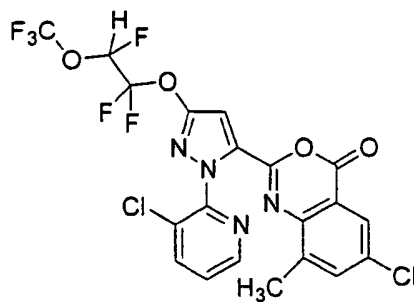


Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-[1,1,2-trifluoro-2-(trifluorometoxi)etoxi]-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,04 (1H, dt, $J=54$ Hz, 3 Hz), 6,84 (1H, s), 7,46 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,93 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,50 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 153-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-[1,1,2-trifluoro-2-(trifluorometoxi)etoxi]-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-{1-(3-cloro-2-piridinil)-3-[1,1,2-trifluoro-2-(trifluorometoxi)etoxi]-1H-pirazol-5-il}-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:



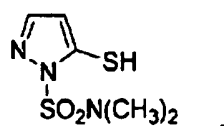
6-Cloro-2-{1-(3-cloro-2-piridinil)-3-[1,1,2-trifluoro-2-(trifluorometoxi)etoxi]-1H-pirazol-5-il}-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,83 (3H, s), 6,06 (1H, dt, $J=54$ Hz, 3 Hz), 7,04 (1H, s), 7,48-7,51 (2H, m), 7,96-8,00 (2H, m), 8,55 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 154-(1)

A uma mistura de 4,0 g de N,N-dimetil-1H-pirazole-1-sulfonamida e 50 mL de tetra-hidrofurano foram adicionados, gota a gota, 15,7 mL de uma solução 1,6 M de n-butil-lítio em hexano

a -78 °C. A mistura resultante foi agitada a -78 °C durante 10 minutos. Foi adicionada uma mistura de 1,46 g de enxofre e 20 mL de tetra-hidrofurano à mistura. A mistura foi agitada a -78 °C durante 1 hora e agitada durante mais 1,5 horas enquanto a temperatura de reacção era gradualmente aumentada até à temperatura ambiente. Um sólido depositado foi recolhido por filtração e lavado com éter dietílico. O sólido foi dissolvido em água. A solução aquosa resultante foi ajustada a cerca de pH 3 por adição de ácido clorídrico 6 N e, em seguida, extraída três vezes com éter t-butil-metílico. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida para obter 3,92 g de N,N-dimetil-5-mercapto-1H-pirazole-1-sulfonamida da fórmula:



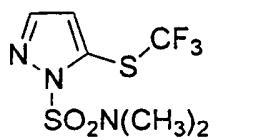
N,N-Dimetil-5-mercapto-1H-pirazole-1-sulfonamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,03 (6H, s), 4,39 (1H, s), 6,27 (1H, d, $J=2$ Hz), 7,59 (1H, d, $J=2$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 154-(2)

Uma mistura de 1,0 g de N,N-dimetil-5-mercapto-1H-pirazole-1-sulfonamida, 0,30 g de hidreto de sódio (50% em óleo) e 25 mL de tetra-hidrofurano foi agitada à temperatura ambiente durante 0,5 horas e, em seguida, arrefecida até -60 °C. Foi ali adicionado 1,94 g de trifluorometanossulfonato de

S-(trifluorometil)dibenzotiofénio. A mistura resultante foi agitada a -60 °C durante 0,5 horas e agitada à temperatura ambiente durante mais 2 horas. Foi vertida água para a mistura reaccional e a mistura foi extraída três vezes com acetato de etilo. As camadas orgânicas foram combinadas, lavadas com uma solução aquosa saturada de cloreto de sódio, secas sobre sulfato de magnésio e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi submetido a cromatografia sobre sílica gel para obter 1,30 g de N,N-dimetil-5-(trifluorometiltio)-1H-pirazole-1-sulfonamida da fórmula:

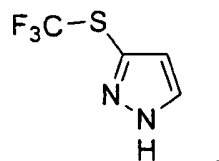


N,N-Dimetil-5-(trifluorometiltio)-1H-pirazole-1-sulfonamida

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 3,08 (6H, s), 6,73 (1H, s), 7,73 (1H, s)

Exemplo de Preparação de Referência 154-(3)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 21, foi utilizada N,N-dimetil-5-(trifluorometiltio)-1H-pirazole-1-sulfonamida em vez de 5-bromo-N,N-dimetil-1H-pirazole-1-sulfonamida para obter 3-(trifluorometiltio)-1H-pirazole da fórmula:

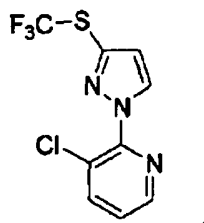


3-(Trifluorometiltio)-1H-pirazole

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,70 (1H, d, $J=3$ Hz), 7,74 (1H, d, $J=3$ Hz), 12,47 (1H, sl)

Exemplo de Preparação de Referência 154-(4)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 22, foi utilizado 3-(trifluorometiltio)-1H-pirazole em vez de 3-bromo-1H-pirazole para obter 3-cloro-2-[3-(trifluorometiltio)-1H-pirazol-1-il]piridina da fórmula:

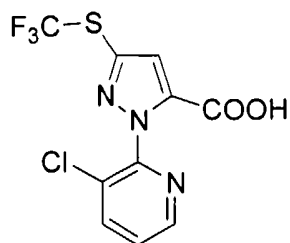


3-Cloro-2-[3-(trifluorometiltio)-1H-pirazol-1-il]piridina

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,78 (1H, d, $J=3$ Hz), 7,35 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,94 (1H, dd, $J=8$ Hz, 2 Hz), 8,17 (1H, d, $J=3$ Hz), 8,47 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 154-(5)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 23, foi utilizada 3-cloro-2-[3-(trifluorometiltio)-1H-pirazol-1-il]piridina em vez de 2-(3-bromo-1H-pirazol-1-il)-3-cloropiridina para obter ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometiltio)-1H-pirazole-5-carboxílico da fórmula:

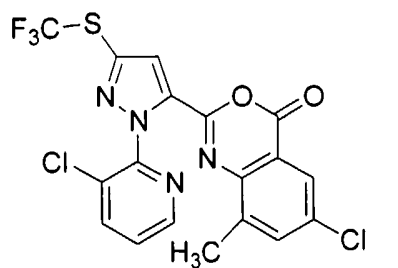


Ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometiltio)-1H-pirazole-5-carboxílico

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,35 (1H, s), 7,47 (1H, dd, $J=8$ Hz, 5 Hz), 7,94 (1H, d, $J=8$ Hz), 8,52 (1H, d, $J=5$ Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 154-(6)

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 13, foi utilizado ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometiltio)-1H-pirazole-5-carboxílico em vez de ácido 1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxílico para obter 6-cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometiltio)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona da fórmula:

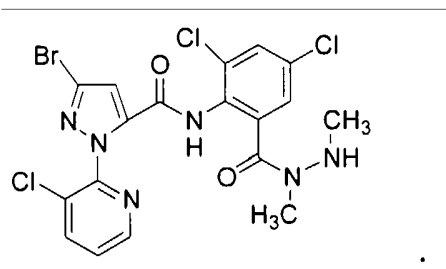


6-Cloro-2-[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometiltio)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona

RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,82 (3H, s), 7,50-7,54 (3H, m), 7,98-8,00 (2H, m), 8,57 (1H, dd, $J=5$ Hz, 2 Hz)

Exemplo de Preparação de Referência 155

De acordo com o mesmo modo que o do Exemplo de Preparação de Referência 147, foi utilizada 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dicloro-4H-3,1-benzoxazin-4-ona em vez de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]-6,8-dibromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona para obter 3-bromo-N-[4,6-dicloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida da fórmula:



3-Bromo-N-[4,6-dicloro-2-(N,N'-dimetil-hidrazinocarbonil)fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazole-5-carboxamida

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , TMS) δ (ppm): 2,20 (2,4H, d, J=5 Hz), 2,39 (0,6H, d, J=6 Hz), 2,72 (0,6H, s), 3,02 (2,4H, s), 4,59 (0,8H, q, J=5 Hz), 5,68 (0,2H, q, J=6 Hz), 7,38 (0,8H, d, J=2 Hz), 7,40 (1,0H, s), 7,53 (0,2H, d, J=2 Hz), 7,60-7,64 (1,0H, m), 7,70 (0,8H, d, J=2 Hz), 7,84 (0,2H, d, J=2 Hz), 8,16-8,19 (1,0H, m), 8,49-8,50 (1,0H, m), 10,34 (0,8H, s), 10,65 (0,2H, s)

Em seguida serão mostrados Exemplos de Formulação. Todas as partes são em massa.

Exemplo de Formulação 1

Numa mistura de 35 partes de xileno e 35 partes de N,N-dimetilformamida, são dissolvidas 10 partes de qualquer um dos presentes compostos (1) a (231) e, em seguida, são adicionadas 14 partes de éster de estirilfenilo e polioxietileno e 6 partes de dodecilbenzenossulfonato de cálcio. A mistura é agitada exaustivamente para obter uma emulsão a 10%.

Exemplo de Formulação 2

A uma mistura de 4 partes de laurilsulfato de sódio, 2 partes de lignossulfonato de cálcio, 20 partes de óxido de silício hidratado sintético em pó fino e 54 partes de terra de diatomáceas, são adicionadas 20 partes de qualquer um dos

presentes compostos (1) a (231). A mistura é agitada exaustivamente para obter um agente molhável a 20%.

Exemplo de Formulação 3

A 2 partes de qualquer um dos presentes compostos (1) a (231), são adicionadas 1 parte de óxido de silício hidratado sintético em pó fino, 2 partes de lignossulfonato de cálcio, 30 partes de bentonite e 65 partes de argila de caulino e, em seguida, agitadas exaustivamente. Em seguida, é adicionada uma quantidade apropriada de água à mistura. A mistura é posteriormente agitada, granulada num granulador e seca em ar forçado para obter um granulado a 2%.

Exemplo de Formulação 4

Numa quantidade apropriada de acetona, é dissolvida 1 parte de qualquer um dos presentes compostos (1) a (231) e, em seguida, são adicionadas 5 partes de óxido de silício hidratado sintético em pó fino, 0,3 partes de PAP e 93,7 partes de argila de fubasami. A mistura é agitada exaustivamente. Em seguida, a acetona é removida da mistura por evaporação para obter um pó a 1%.

Exemplo de Formulação 5

Uma mistura de 10 partes de qualquer um dos presentes compostos (1) a (231); 35 partes de carvão branco contendo 50 partes de sal de amónio de sulfato do éter de alquilo e

polioxietileno; e 55 partes de água é finamente triturada por um método de trituração por via húmida para obter um agente fluido a 10%.

Exemplo de Formulação 6

Em 5 partes de xileno e 5 partes de tricloroetano, é dissolvido 0,1 parte de qualquer um dos presentes compostos (1) a (231). A solução é misturada com 89,9 partes de queroseno desodorizado para obter um óleo a 0,1%.

Exemplo de Formulação 7

Em 0,5 mL de acetona é dissolvido 10 mg de qualquer um dos presentes compostos (1) a (231). A solução é misturada uniformemente com 5 g de um alimento composto sólido para animais em pó (alimento composto sólido em pó para criação e reprodução CE-2, fabricado por CLEA Japan, Inc.) e, em seguida, seca por evaporação da acetona para obter um isco envenenado.

Em seguida será demonstrado pelos Exemplos de Ensaio que o presente composto é eficaz no controlo de artrópodes nocivos.

Exemplo de Ensaio 1

Preparações dos presentes compostos (1), (4) a (53), (55) a (74), (76) a (83), (85) a (120), (122) a (156), (158) a (167), (170) a (171), (173), (175) a (176), (178), (181) a (184), (188) a (190), (195) a (197), (200) a (216), (218) a (219), (221) a

(223) e (231) obtidas no Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água para que a concentração de ingrediente activo se tornasse 500 ppm, para preparar soluções de ensaio para pulverização.

Ao mesmo tempo foi plantada couve num copo de polietileno e mantida em cultivo até se ter desenvolvido a terceira folha real ou quarta folha real. A solução de ensaio para pulverização como descrita acima foi pulverizada numa quantidade de 20 mL/copo sobre a couve.

Depois da solução de fármaco pulverizada sobre a couve ter secado, 10 larvas da terceira fase de traças de dorso de diamante foram colocadas na couve. Após 5 dias, o número de traças de dorso de diamante foi contado e calculado um valor de controlo através da equação seguinte:

$$\text{Valor de controlo(\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

em que,

Cb: o número de larvas numa secção não tratada antes do tratamento

Cai: o número de larvas numa secção não tratada em observação

Tb: o número de larvas numa secção tratada antes do tratamento

Tai: o número de larvas numa secção tratada em observação.

Como resultado, as soluções de ensaio para pulverização dos presentes compostos (1), (4) a (53), (55) a (74), (76) a (83), (85) a (120), (122) a (156), (158) a (167), (170) a (171),

(173), (175) a (176), (178), (181) a (184), (188) a (190), (195) a (197), (200) a (216), (218) a (219), (221) a (223) e (231) exibiram, cada, um valor de controlo de 80% ou mais.

Exemplo de Ensaio 2

Preparações dos presentes compostos (4) a (7), (9) a (12), (17) a (23), (27), (29), (32) a (44), (48) a (51), (56) a (61), (65) a (68), (70) a (72), (74) a (75), (78) a (81), (83) a (85), (87) a (88), (91) a (97), (99) a (102), (104) a (120), (122) a (125), (127) a (135), (137) a (144), (147) a (149), (151) a (161), (164), (166) a (168), (171) a (173), (175) a (184), (186) a (188), (191), (193) a (205), (208) a (209), (213) a (215), (218) a (224), (226) a (230) e (231) obtidas no Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água para que a concentração de ingrediente activo se tornasse 500 ppm, para preparar soluções de ensaio para pulverização.

Ao mesmo tempo foi plantado pepino num copo de polietileno e foi mantido em cultivo até se ter desenvolvido a primeira folha real. Cerca de 30 pulgões do algodoeiro foram colocados no pepino. Um dia depois, a solução de ensaio para pulverização como descrita acima foi pulverizada numa quantidade de 20 mL/copo sobre o pepino. Seis dias após a pulverização, o número de pulgões do algodoeiro foi contado e calculado um valor de controlo através da equação seguinte:

$$\text{Valor de controlo(\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$$

em que,

Cb: o número de insectos numa secção não tratada antes do tratamento

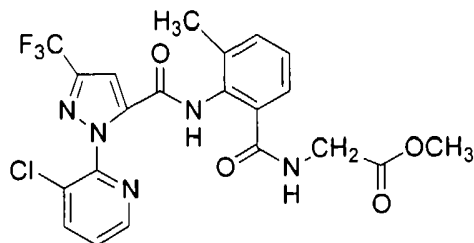
Cai: o número de insectos numa secção não tratada em observação

Tb: o número de insectos numa secção tratada antes do tratamento

Tai: o número de insectos numa secção tratada em observação.

Como resultado, as soluções de ensaio para pulverização dos presentes compostos (4) a (7), (9) a (12), (17) a (23), (27), (29) (32) a (44), (48) a (51), (56) a (61), (65) a (68), (70) a (72), (74) a (75), (78) a (81), (83) a (85), (87) a (88), (91) a (97), (99) a (102), (104) a (120), (122) a (125), (127) a (135), (137) a (144), (147) a (149), (151) a (161), (164), (166) a (168), (171) a (173), (175) a (184), (186) a (188), (191), (193) a (205), (208) a (209), (213) a (215), (218) a (224), (226) a (230) e (231) exibiram, cada, um valor de controlo de 90% ou mais.

Além disso, do mesmo modo que o Exemplo de Ensaio 2, a solução de ensaio para pulverização do composto comparativo da fórmula:



(divulgado no documento WO2003/015518A página 109, Composto 354) exibiu um valor de controlo inferior a 30%.

Exemplo de Ensaio 3

Preparações dos presentes compostos (4) a (13), (15) a (23), (25) a (44), (48) a (51), (56) a (58), (61), (65) a (74), (80) a (81), (85) a (97), (100), (102), (104) a (120), (122) a (125), (127) a (137), (139) a (156), (158) a (167), (170) a (171), (173), (175) a (176), (178), (181) a (184), (188) a (190), (195) a (197), (200) a (208), (210) a (216), (218) a (219), (221) a (224) e (231) obtidas no Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água para que a concentração de ingrediente activo se tornasse 500 ppm, para preparar soluções de ensaio para pulverização.

Ao mesmo tempo, foi plantada couve num copo de polietileno, e mantida em cultivo até se ter desenvolvido a terceira folha real ou quarta folha real. A solução de ensaio para pulverização como descrita acima foi pulverizada numa quantidade de 20 mL/copo sobre a couve. Depois da solução de fármaco pulverizada sobre a couve ter secado, foram colocadas 10 larvas de quarta fase de *Spodoptera litura* na couve. Após 4 dias, o número de *Spodoptera litura* sobreviventes nas folhas da couve foi contado e calculado um valor de controlo através da equação seguinte:

$$\text{Valor de controlo(\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$$

em que,

Cb: o número de larvas numa secção não tratada antes do tratamento

Cai: o número de larvas numa secção não tratada em observação

Tb: o número de larvas numa secção tratada antes do tratamento

Tai: o número de larvas numa secção tratada em observação.

Como resultado, as soluções de ensaio para pulverização dos presentes compostos (4) a (13), (15) a (23), (25) a (44), (48) a (51), (56) a (58), (61), (65) a (74), (80) a (81), (85) a (97), (100), (102), (104) a (120), (122) a (125), (127) a (137), (139) a (156), (158) a (167), (170) a (171), (173), (175) a (176), (178), (181) a (184), (188) a (190), (195) a (197), (200) a (208), (210) a (216), (218) a (219), (221) a (224) e (231) exibiram, cada, um valor de controlo de 80% ou mais.

Exemplo de Ensaio 4

Preparações dos presentes compostos (4) a (13), (15) a (23), (25) a (45), (47) a (51), (53), (55) a (61), (65) a (72), (74), (78) a (81), (83), (85) a (102), (104) a (105), (107) a (117), (119) a (120), (122) a (125), (127) a (156), (158) a (164), (166) a (167), (171), (173), (175) a (176), (178), (181) a (184), (188) a (190), (195) a (197), (200) a (211), (213) a (216), (218) a (219), (221) a (224) e (231) obtidas no Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água para que a concentração de ingrediente activo se tornasse 500 ppm, para preparar soluções de ensaio para pulverização.

Ao mesmo tempo, 20 mL da solução de ensaio para pulverização como descrita acima foi pulverizada numa plântula de macieira (plântula com 28 dias, altura da árvore: cerca de 15 cm) plantada num copo de plástico. A plântula de macieira foi seca ao ar até ao ponto em que a solução de fármaco pulverizada na plântula de macieira estava seca e foram aplicadas cerca de 30 larvas de primeira fase de *Adoxophyes orana fasciata*. Sete dias após a pulverização, o número de larvas sobreviventes na plântula de macieira foi contado e calculado um valor de controlo através da equação seguinte:

$$\text{Valor de controlo(\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$$

em que,

C_b : o número de larvas numa secção não tratada antes do tratamento

C_{ai} : o número de larvas numa secção não tratada em observação

T_b : o número de larvas numa secção tratada antes do tratamento

T_{ai} : o número de larvas numa secção tratada em observação.

Como resultado, as soluções de ensaio para pulverização dos presentes compostos (4) a (13), (15) a (23), (25) a (45), (47) a (51), (53), (55) a (61), (65) a (72), (74), (78) a (81), (83), (85) a (102), (104) a (105), (107) a (117), (119) a (120), (122) a (125), (127) a (156), (158) a (164), (166) a (167), (171), (173), (175) a (176), (178), (181) a (184), (188) a (190), (195) a (197), (200) a (211), (213) a (216), (218) a (219), (221) a (224) e (231) exibiram, cada, um valor de controlo de 90% ou mais.

Exemplo de Ensaio 5

Preparações dos presentes compostos (4) a (5), (9) a (10), (17), (19) a (22), (27), (29), (32) a (44), (48) a (51), (56) a (61), (66) a (68), (70) a (72), (74) a (75), (79), (81), (85), (88), (91) a (92), (94) a (95), (99), (101) a (102), (104) a (120), (122) a (124), (127) a (129), (131) a (132), (135) a (136), (140), (142) a (145), (147) a (151), (153) a (157), (159), (163) a (164), (167), (171) a (172), (175) a (176), (183), (187), (193) a (194), (196) a (204), (206), (208) a (209), (213) a (221), (226), (227) e (231) obtidas no Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água para que a concentração de ingrediente activo se tornasse 500 ppm, para preparar soluções de ensaio para pulverização.

Ao mesmo tempo, foi plantado pepino num copo de polietileno e foi mantido em cultivo até se ter desenvolvido a primeira folha real. A solução de ensaio para pulverização como descrita acima foi pulverizada numa quantidade de 20 mL/copo sobre o pepino. Depois de a solução de fármaco pulverizada no pepino estar seca, a primeira folha real foi cortada e, em seguida, colocada num papel de filtro (diâmetro: 70 mm) contendo água num copo de polietileno (diâmetro: 110 mm). Na folha do pepino foram libertadas 20 larvas de *Frankliniella occidentalis* e o copo de polietileno foi tapado. Sete dias após a pulverização, o número de insectos sobreviventes na folha de pepino foi contado e calculado um valor de controlo através da equação seguinte:

$$\text{Valor de controlo(\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$$

em que,

Cb: o número de insectos numa secção não tratada antes do tratamento

Cai: o número de insectos numa secção não tratada em observação

Tb: o número de insectos numa secção tratada antes do tratamento

Tai: o número de insectos numa secção tratada em observação.

Como resultado, as soluções de ensaio para pulverização dos presentes compostos (4) a (5), (9) a (10), (17), (19) a (22), (27), (29), (32) a (44), (48) a (51), (56) a (61), (66) a (68), (70) a (72), (74) a (75), (79), (81), (85), (88), (91) a (92), (94) a (95), (99), (101) a (102), (104) a (120), (122) a (124), (127) a (129), (131) a (132), (135) a (136), (140), (142) a (145), (147) a (151), (153) a (157), (159), (163) a (164), (167), (171) a (172), (175) a (176), (183), (187), (193) a (194), (196) a (204), (206), (208) a (209), (213) a (221), (226), (227) e (231) exibiram, cada, um valor de controlo de 90% ou mais.

Exemplo de Ensaio 6

Preparações dos presentes compostos (5), (32), (34), (43) a (44), (49) a (50), (56), (59), (93), (95) a (96), (107), (111) a (112), (114), (119), (127), (129), (132) a (133), (144), (147) a (148), (153), (158), (167) a (168), (171) a (172), (177) a (178), (182) a (184), (186) a (187), (193) a (194), (197) a (199), (201), (204), (209), (213), (215), (219) a (220), (221), (223), (226) e (231) obtidas no Exemplo de Formulação 5 foram diluídas com água para que a concentração de ingrediente activo

se tornasse 500 ppm, para preparar soluções de ensaio para pulverização.

Ao mesmo tempo, foi plantada couve num copo de polietileno e mantida em cultivo até se ter desenvolvido a primeira folha real. Todas as folhas, excluindo a primeira folha real, foram cortadas. Na primeira folha real, foram libertados imagos da mosca branca de folha de prata e deixados depositar ovos durante cerca de 24 horas. A couve foi mantida numa estufa durante 8 dias. Quando as larvas eclodiram dos ovos, a solução de ensaio para pulverização como descrita acima foi pulverizada numa quantidade de 20 mL/copo na couve. Sete dias após a pulverização, o número de larvas sobreviventes na couve foi contado e calculado um valor de controlo através da equação seguinte:

$$\text{Valor de controlo(\%)} = \{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$$

em que,

Cb: o número de larvas numa secção não tratada antes do tratamento

Cai: o número de larvas numa secção não tratada em observação

Tb: o número de larvas numa secção tratada antes do tratamento

Tai: o número de larvas numa secção tratada em observação.

Como resultado, as soluções de ensaio para pulverização dos presentes compostos (5), (32), (34), (43) a (44), (49) a (50), (56) (59), (93), (95) a (96), (107), (111) a (112), (114), (119), (127), (129), (132) a (133), (144), (147) a (148), (153),

(158), (167) a (168), (171) a (172), (177) a (178), (182) a (184), (186) a (187), (193) a (194), (197) a (199), (201), (204), (209), (213), (215), (219) a (220), (221), (223), (226) e (231) exibiram, cada, um valor de controlo de 90% ou mais.

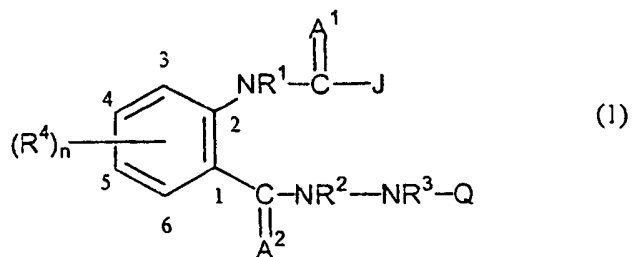
Aplicabilidade industrial

De acordo com a presente invenção, uma vez que o composto de hidrazida da presente invenção tem uma eficácia excelente no controlo de pragas, ele é útil como um ingrediente activo de um pesticida.

Lisboa, 29 de Junho de 2011

REIVINDICAÇÕES

1. Composto de hidrazida representado pela fórmula (1):



em que,

R¹ representa um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cianoalquilo C2-C6; um grupo alcoxialquilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcóxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 e R^3 representam, independentemente, um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo acilo C1-C6; um grupo alcoxycarbonilo C2-C6; um grupo N,N-dialquilcarbamoílo C3-C7; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro e (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^4 representa um átomo de halogéneo; um grupo ciano, um grupo nitro; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcóxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou dois grupos R^4 que estão ligados aos átomos de carbono adjacentes são ligados um ao outro nas suas extremidades para formar um grupo T1 ou T2

T1: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

T2: $-(CR^{45}R^{46})_n-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam, independentemente, um átomo de hidrogénio; um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo nitro; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente

substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{45} e R^{46} representam, independentemente, um átomo de hidrogénio; ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

h representa um número inteiro de 3 ou 4),

n representa um número inteiro de 0 a 4 (desde que, quando n é um número inteiro de 2 ou mais, os R^4 podem ser iguais ou diferentes),

Q representa um grupo seleccionado de Q1 a Q6:

Q1: $-C(=A^{31})-R^5$

Q2: $-C(=A^{32})-OR^6$

Q3: $-C(=A^{33})-SR^7$

Q4: $-C(=A^{34})-NR^8R^9$

Q5: $-S(O)_2-R^{10}$

Q6: $-S(O)_2-NR^{11}R^{12}$

(em que A^{31} , A^{32} , A^{33} e A^{34} representam um átomo de oxigénio ou um átomo de enxofre,

R⁵ representa um átomo de hidrogénio; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alcoxilo C1-C6, (3) um grupo alquiltio C1-C6, (4) um grupo alquilsulfinilo C1-C6, (5) um grupo alquilsulfonilo C1-C6, (6) um grupo dialquilamino C2-C6 e (7) um grupo cicloalquilo C3-C6; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo naftilo opcionalmente substituído com 1 a 9 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de

halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenoxialquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R⁶ e R⁷ representam um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcoxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxicarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente

substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcóxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R⁸ e R⁹ representam, independentemente, um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcóxialquilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcóxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo

C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcóxicarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou R⁸ e R⁹ são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros, o grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros pode conter, no anel, um ou mais grupos independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de oxigénio, (2) um grupo de enxofre e (3) um grupo -NR^a- (em que R^a representa um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcóxicarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo

ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo), ou o átomo ou átomos de carbono no anel podem estar substituídos com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (3) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

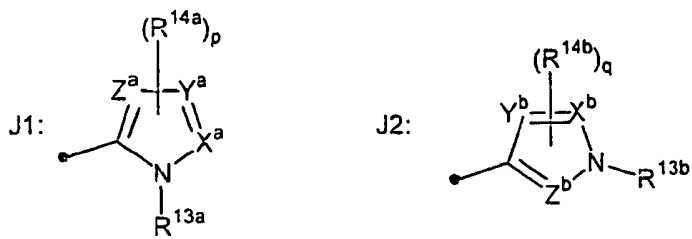
R¹⁰ representa um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

R¹¹ e R¹² representam, independentemente, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um

átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou R^{11} e R^{12} são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros, o grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros pode conter, no anel, um ou mais grupos independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de oxigénio, (2) um átomo de enxofre e (3) um grupo $-NR^b-$ (em que R^b representa um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo), e átomo ou átomos de carbono no anel podem estar substituídos com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (3) um grupo alcoxycarbonilo

C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

J representa um grupo representado por J1 ou J2:



(em que X^a , Y^a , Z^a , X^b , Y^b e Z^b representam, independentemente, CH ou um átomo de azoto,

R^{13a} e R^{13b} representam um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cianoalquilo C2-C6; um grupo alcóxialquilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcóxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6

opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo fenilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de benzeno pode estar substituída com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo piridinilalquilo C7-C9 cuja unidade de anel de piridina pode estar substituída com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14a} e R^{14b} representam um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo nitro; um grupo isocianato; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente

substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cianoalquilo C2-C6; um grupo alcoxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenoxilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6

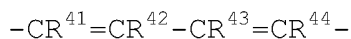
opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

p representa um número inteiro de 0 a 3, e

q representa um número inteiro de 0 a 3 (desde que, quando p é um número inteiro de 2 ou 3, dois ou mais R^{14a} podem ser iguais ou diferentes e quando q é um número inteiro de 2 ou 3, dois ou mais R^{14b} podem ser iguais ou diferentes), e

A¹ e A² representam, independentemente, um átomo de oxigénio ou um átomo de enxofre.

2. Composto de acordo com a reivindicação 1, em que n é um número inteiro de 0 a 3.
3. Composto de acordo com a reivindicação 2, em que R⁴ é um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou dois grupos R⁴ que estão ligados aos átomos de carbono adjacentes são ligados nas suas extremidades para formar um grupo T1:



(em que R⁴¹, R⁴², R⁴³ e R⁴⁴ representam um átomo de hidrogénio).

4. Composto de acordo com a reivindicação 3, em que R^4 é um átomo de flúor; um átomo de cloro; um átomo de bromo; um átomo de iodo; um grupo ciano; um grupo metilo; um grupo etilo; um grupo trifluorometilo; um grupo metoxilo; um grupo fenilo, ou dois grupos R^4 que estão ligados aos átomos de carbono adjacentes são ligados nas suas extremidades para formar um grupo T1: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$ (em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam um átomo de hidrogénio).

5. Composto de acordo com a reivindicação 1, em que

J é J1,

Y^a é CH,

R^{13a} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquilídeo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (8) um grupo

alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14a} é um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

p é um número inteiro de 0 a 2.

6. Composto de acordo com a reivindicação 1, em que

J é J^2 , Y^b é CH ,

R^{13b} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14b} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

q é 1.

7. Composto de acordo com a reivindicação 1, em que A^1 e A^2 são um átomo de oxigénio e R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo.

8. Composto de acordo com a reivindicação 1, em que

Q é Q^1 ,

A^{31} é um átomo de oxigénio, e

R^5 é um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alcoxilo C1-C6, (3) um grupo alquiltio C1-C6, (4) um grupo alquilsulfinilo C1-C6, (5) um grupo alquilsulfonilo C1-C6, (6) um grupo dialquilamino C2-C6 e (7) um grupo cicloalquilo C3-C6; um

grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros opcionalmente substituído com um ou mais grupos independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6.

9. Composto de acordo com a reivindicação 8, em que R⁵ é um átomo de hidrogénio; um grupo metilo; um grupo etilo; um grupo terc-butilo; um grupo ciclopropilo; um grupo fenilo; um grupo 3-metilfenilo; um grupo 4-metoxifenilo; um grupo 2-piridinilo ou um grupo morfolino.

10. Composto de acordo com a reivindicação 1, em que

Q é Q2,

A³² é um átomo de oxigénio, e

R⁶ é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquilamino C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcóxicarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

11. Composto de acordo com a reivindicação 10, em que R⁶ é um grupo metilo; um grupo etilo; um grupo propilo; um grupo isopropilo; um grupo butilo; um grupo sec-butilo; um grupo 2-propenilo ou um grupo fenilo.
12. Composto de acordo com a reivindicação 1, em que

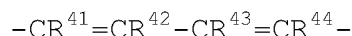
Q é Q4,

A³⁴ é um átomo de oxigénio, e

R⁸ e R⁹ representam, independentemente, um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcoxycarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo.

13. Composto de acordo com a reivindicação 12, em que R^8 e R^9 representam, independentemente, um átomo de hidrogénio; um grupo metilo; um grupo etilo ou um grupo fenilo.
14. Composto de acordo com a reivindicação 1, em que R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo, e R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo metilo, um grupo isopropilo ou um grupo metoxicarbonilo.
15. Composto de acordo com a reivindicação 1, em que
- R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,
- R^2 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,
- R^3 é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,
- R^4 é um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou

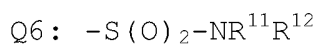
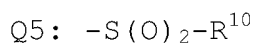
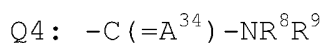
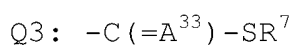
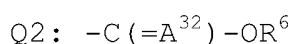
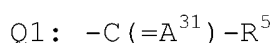
dois grupos R^4 que estão ligados aos átomos de carbono adjacentes são ligados nas suas extremidades para formar um grupo T1:



(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam um átomo de hidrogénio),

n é um número inteiro de 0 a 3,

Q é um grupo seleccionado de Q1 a Q6:



(em que A^{31} , A^{32} e A^{33} são um átomo de oxigénio, A^{34} é um átomo de oxigénio ou um átomo de enxofre,

R^5 é um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo alcoxilo C1-C6, (3) um grupo alquiltio C1-C6, (4) um grupo alquilsulfinilo C1-C6, (5) um grupo alquilsulfonilo C1-C6, (6) um grupo dialquilamino C2-C6 e (7) um grupo cicloalquilo C3-C6; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo

consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcóxicarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo heterocíclico não aromático de 3 a 8 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6,

R⁶ é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6

opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcóxicarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R⁷ é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

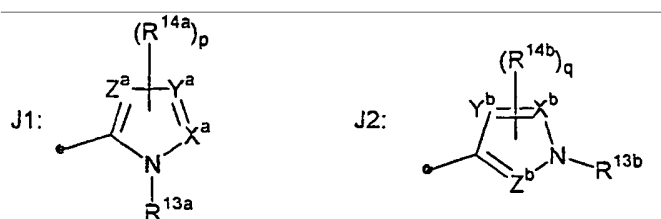
R⁸ e R⁹ representam, independentemente, um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (9) um grupo dialquilamino C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (10) um grupo alcóxicarbonilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{10} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, e

R^{11} e R^{12} representam, independentemente, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

J é um grupo representado por J1 ou J2:



(em que X^a é CH ou um átomo de azoto, Y^a é CH, Z^a é CH ou um átomo de azoto, X^b é CH ou um átomo de azoto, Y^b é CH, e Z^b é CH ou um átomo de azoto,

R^{13a} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo cicloalquilo C3-C6 opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo

consistindo de (1) um átomo de halogéneo e (2) um grupo alquilo C1-C6; um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (6) um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, (7) um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (8) um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo heteroarilo de 5 a 6 membros opcionalmente substituído com um ou mais substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{13b} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14a} é um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de

halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{14b} é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com 1 a 5 substituintes independentes seleccionados do grupo consistindo de (1) um átomo de halogéneo, (2) um grupo ciano, (3) um grupo nitro, (4) um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo e (5) um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

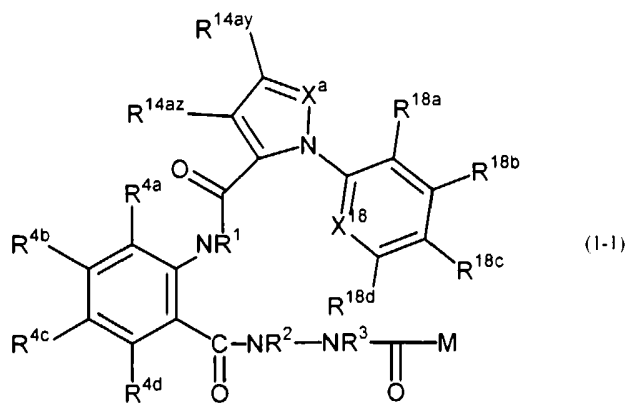
p é um número inteiro de 0 a 2, e

q é 1,

(desde que, quando p é 2, dois R^{14a} podem ser iguais ou diferentes), e

A^1 e A^2 são um átomo de oxigénio.

16. Composto de hidrazida representado pela fórmula (1-1):



em que

R^1 é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^2 é um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^3 é um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio; um átomo de halogéneo; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio; um átomo de halogéneo; um grupo ciano ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou

R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam um átomo de hidrogénio),

M é OR^6 , SR^7 ou NR^8R^9

(em que R^6 e R^7 são, independentemente, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcoxialquilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^8 e R^9 são, independentemente, um átomo de hidrogénio; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcenilo C2-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcinilo C3-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou

R^8 e R^9 são tomados em conjunto com o átomo de azoto ao qual estão ligados para formar um grupo pirrolidin-1-ilo; um grupo piperidino, um grupo hexametilenoimin-1-ilo; um grupo

heptametilenoimin-1-ilo; um grupo morfolino; um grupo tiomorfolin-4-ilo ou um grupo 4-fenilpiperazin-1-ilo),

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que R^{14ax} representa um átomo de hidrogénio; um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio; um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo,

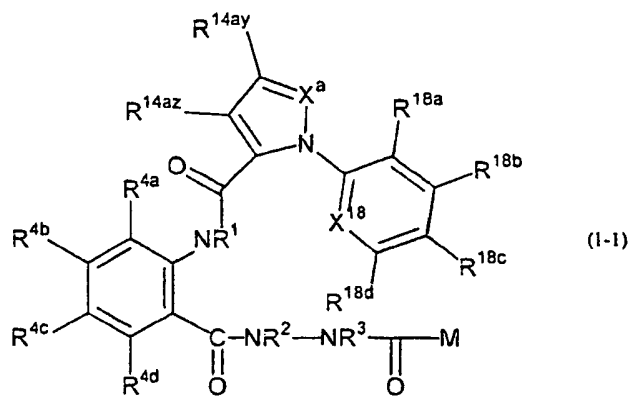
R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e}

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo), e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo.

17. Composto de hidrazida representado pela fórmula (1-1):



em que

R¹ é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R² é um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R³ é um átomo de hidrogénio, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

R^{4a} é um átomo de hidrogénio; um átomo de halogéneo; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcóxido C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo,

R^{4b} , R^{4c} e R^{4d} são, independentemente, um átomo de hidrogénio; um átomo de halogéneo; um grupo ciano, um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo, ou

R^{4b} e R^{4c} estão ligados um ao outro pelas suas extremidades para formar um grupo: $-CR^{41}=CR^{42}-CR^{43}=CR^{44}-$

(em que R^{41} , R^{42} , R^{43} e R^{44} representam um átomo de hidrogénio),

M é um átomo de hidrogénio,

X^a é um átomo de azoto ou CR^{14ax}

(em que R^{14ax} é um átomo de hidrogénio; um átomo de halogéneo; um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alcoxilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo),

R^{14ay} é um átomo de hidrogénio; um átomo de halogéneo, um grupo ciano; um grupo alquilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquiltio C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo; um grupo alquilsulfinilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de

halogéneo; um grupo alquilsulfonilo C1-C6 opcionalmente substituído com pelo menos um átomo de halogéneo ou um grupo fenilo,

R^{14az} é um átomo de hidrogénio,

X^{18} é um átomo de azoto ou CR^{18e}

(em que R^{18e} é um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo), e

R^{18a} , R^{18b} , R^{18c} e R^{18d} são, cada, independentemente, um átomo de hidrogénio ou um átomo de halogéneo.

18. Pesticida compreendendo o composto de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 17 como um ingrediente activo.
19. Método de controlo de uma praga que compreende a aplicação do composto de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 17 a uma planta, solo ou em casa.
20. Utilização do composto de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 17 para controlar uma praga, aplicando o composto a uma planta, solo ou em casa.
21. Utilização do composto de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 17 para o fabrico de uma preparação pesticida.

Lisboa, 29 de Junho de 2011

RESUMO

"COMPOSTO DE HIDRAZIDA E UTILIZAÇÃO PESTICIDA DO MESMO"

Composto de hidrazida representado pela fórmula (1): tem actividade pesticida excelente.

