



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

(11) PI 0709030-7 B1

(22) Data do Depósito: 20/03/2007

(45) Data de Concessão: 17/05/2016

(RPI 2367)



(54) Título: DERIVADO DE N-2-(HETERO)ARILETILCARBOXAMIDA, AGENTE CONTROLADOR DE PRAGAS COMPREENDENDO O MESMO, E MÉTODO PARA CONTROLAR PRAGAS

(51) Int.Cl.: C07C 233/66; A01N 37/18; A01N 43/08; A01N 43/10; A01N 43/32; A01N 43/40; A01N 43/56; A01N 43/60; A01N 43/78; A01N 47/02; A01P 3/00; C07C 233/65; C07C 233/73; C07D 213/82; C07D 231/14; C07D 241/24; C07D 277/20; C07D 277/56; C07D 307/56; C07D 327/06; C07D 333/38

(30) Prioridade Unionista: 20/03/2006 JP 2006-077752, 30/10/2006 JP 2006-294810

(73) Titular(es): NIHON NOHYAKU CO., LTD.

(72) Inventor(es): MASATSUGU ODA, YOSHIHIRO MATSUZAKI, KOJI TANAKA, EIJI TAKIZAWA, MOTOHIRO HASEBE, NOBUTAKA KUROKI, AKIYUKI SUWA, KENJI OSHIMA

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para **"DERIVADO DE N-2-(HETERO)ARILETILCARBOXAMIDA, AGENTE CONTROLADOR DE PRAGAS COMPREENDENDO O MESMO, E MÉTODO PARA CONTROLAR PRAGAS"**.

5 Campo Técnico

A presente invenção refere-se a derivados de N-2-(hetero)ariletilcarboxamida, um sal dos mesmos, e um agente controlador de praga contendo o composto como um ingrediente ativo, particularmente um agente controlador de doença de planta, nematocidas e método de uso dos mesmos.

10 Técnica Anterior

Convencionalmente, é sabido que um certo tipo de derivado de N-2-(hetero)ariletilcarboxamida tem uma atividade fungicida (por exemplo, vide JP-A-1-151546, WO 04/016088, WO 04/074280 ou a WO 06/016708).

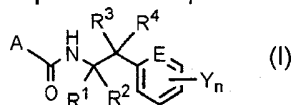
Descoberta da Invenção

15 No entanto, derivados de fenetilcarboxamida descritos JP-A-1-151546 dificilmente apresentam atividade contra doenças de plantas em um nível prático. Embora derivados de carboxamida descritos no WO 04/016088, WO 04/074280 e WO 06/016708 possam algumas vezes apresentar uma elevada atividade fungicida, eles são problemáticos pelo fato de que não têm um
20 espectro fungicida suficientemente satisfatório e semelhantes. Na técnica anterior, portanto, a eficácia e o espectro de controle de agentes controladores de doenças de plantas não são inteiramente suficientes. Nos últimos anos, a sobrecarga sobre o ambiente global tem atraído atenção, que dá origem a uma demanda por um composto para um agente controlador de doença de
25 planta, o qual apresente um amplo espectro de controle com uma baixa dose.

Os presentes inventores conduziram intensivos estudos em uma tentativa de resolver os problemas mencionados acima e descobriram que derivados de N-2-(hetero)ariletilcarboxamida representados pela fórmula (I) da presente invenção e um sal dos mesmos têm uma eficácia de controle
30 superior e um espectro fungicida extremamente amplo como agentes controladores de doenças de plantas, e uma atividade nematocida também, a qual resultou no completamento da presente invenção.

Por conseguinte, a presente invenção refere-se a [1] um derivado N-

2-(hetero)ariletilacarboxamida representado pela fórmula (I)



em que R¹ e R² são cada um de modo independente

um átomo de hidrogênio; ou

5 um grupo (C₁-C₃)alquila,

ou

R¹ e R² são opcionalmente ligados um ao outro para formar

um (C₃-C₆)cicloalcano,

R³ e R⁴ são cada um de modo independente

10 um átomo de hidrogênio;

um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₆)alquila, ou

R³ e R⁴ são opcionalmente ligados um ao outro para formar

um (C₃-C₆)cicloalcano,

15 quando A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A3), R³ e R⁴ opcionalmente formam um átomo de oxigênio em combinação,

cada Y é de modo independente

um átomo de halogênio;

um grupo ciano;

20 um grupo hidróxi;

um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₂-C₆)alquenila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

25 um grupo (C₂-C₆)alquinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo (C₁-C₆)alcóxi;

30 um grupo (C₂-C₆)alquenilóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

- um grupo (C₂-C₆)alquililóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- 5 um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alcóxi-carbonila;
- 10 um grupo (C₁-C₆)alcoxiimino(C₁-C₃)alquila;
- um grupo (C₃-C₃₀)trialquilsilila;
- um grupo fenila opcionalmente substituído por um ou mais substituintes selecionados entre grupo substituinte Z;
- um grupo fenóxi opcionalmente substituído por um ou mais substituintes selecionados entre grupo substituinte Z; ou
- 15 grupo heterociclíloxi opcionalmente substituído por um ou mais substituintes selecionados entre grupo substituinte Z,
- n é um inteiro de 1 a 5,
- dois Y's que se tornam adjacentes quando n é um inteiro de 2 a 5 são opcionalmente ligados um ao outro para apresentar
- 20 um grupo (C₃-C₅)alquileno;
- um grupo (C₃-C₅)alquenileno;
- um grupo (C₂-C₄)alquilenoóxi; ou
- um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,
- 25 grupo substituinte Z apresenta
- um átomo de hidrogênio;
- um átomo de halogênio;
- um grupo ciano;
- 30 um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₂-C₆)alquenila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de

halogênio;

um grupo (C₂-C₆)alquinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

5 um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₂-C₆)alquenilóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₂-C₆)alquinilóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

10 um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₁-C₆)alquilsulfinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

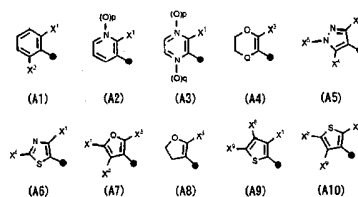
15 um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₁-C₆)alcóxi-carbonila;

um grupo (C₁-C₆)alcoxiimino(C₁-C₃)alquila; ou

um grupo carbamoila,

20 A é um grupo cíclico substituído selecionado entre o grupo consistindo nas fórmulas (A1) a (A10),



em que X¹ é

um átomo de halogênio;

25 um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₁-C₃)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

X^2 é

um átomo de hidrogênio; ou

um átomo de halogênio,

5 X^3 é um grupo (C_1-C_3)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

X^4 , X^7 , X^8 e X^9 são cada um de modo independente

um átomo de hidrogênio;

um átomo de halogênio; ou

10 um grupo (C_1-C_3)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

X^5 é

um átomo de hidrogênio; ou

um grupo (C_1-C_3)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

15 X^6 é

um átomo de hidrogênio;

um grupo amino;

um grupo mono(C_1-C_3)alquilamino;

um grupo di(C_1-C_3)alquilamino;

20 um átomo de halogênio; ou

um grupo (C_1-C_3)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

Q é

um átomo de oxigênio;

25 um átomo de enxofre;

$-SO_2-$ ou

$-CH_2-$,

p e q são cada um de modo independente 0 ou 1, e

E é

30 C-H;

C-Y (Y é conforme definido acima); ou

um átomo de nitrogênio,

contanto que

(1) quando E é um átomo de nitrogênio, A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A3), e

(2) 2,6-dicloro-N-[2-{3-(trifluórmethyl)fenil}etil]benzamida é excluído,

5 ou um sal dos mesmos;

[2] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida do [1] mencionado acima, em que E é C-H ou C-Y (Y é conforme definido no [1] mencionado acima),

ou um sal dos mesmos;

[3] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida do [1] ou [2] mencionados acima,

10 em que

A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A1),

ou um sal dos mesmos;

[4] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida de qualquer um dos [1] a [3] mencionados acima, em que

15 A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A1),

E é

C-H ou

C-Y (Y é conforme definido abaixo),

R¹ e R² são cada um de modo independente

20 um átomo de hidrogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquila, ou

R¹ e R² são opcionalmente ligados um ao outro para formar

um (C₃-C₆)cicloalcano,

R³ e R⁴ são cada um de modo independente

25 um átomo de hidrogênio;

um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₆)alquila, ou

R³ e R⁴ são opcionalmente ligados um ao outro para formar

um (C₃-C₆)cicloalcano,

30 cada Y é de modo independente

um átomo de halogênio;

um grupo ciano;

- um grupo hidróxi;
- um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- 5 um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo (C₁-C₆)alcóxi;
- um grupo (C₂-C₆)alquenilóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- 10 um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquilsulfinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- 15 um grupo fenila opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- 20 style="padding-left: 40px;">(iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo fenóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- 25 style="padding-left: 40px;">(ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; ou
- um grupo heterociclíloxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes
- 30 um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais

átomos de halogênio e

(iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais

átomos de halogênio,

n é um inteiro de 1 a 3,

5 dois Y's que se tornam adjacentes quando n é um inteiro de 2 ou 3 são opcionalmente ligados um ao outro para apresentar

um grupo (C₃-C₅)alquileno;

um grupo (C₃-C₅)alquenileno;

um grupo (C₂-C₄)alquilenooxi; ou

10 um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

X¹ é

um átomo de halogênio;

um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
15 logênio;

um grupo (C₁-C₃)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
logênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de
halogênio, e

20 X² é

um átomo de hidrogênio; ou

um átomo de halogênio,

ou um sal dos mesmos;

[5] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida dos [1] ou [2] mencionados aci-
25 ma, em que

A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A2),

ou um sal dos mesmos;

[6] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida de qualquer um dos [1], [2] e [5]
mencionados acima, em que

30 A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A2),

E é

C-H ou

- C-Y (Y é conforme definido abaixo),
 R¹ e R² são cada um de modo independente
 um átomo de hidrogênio; ou
 um grupo (C₁-C₃)alquila, ou
- 5 R¹ e R² são opcionalmente ligados um ao outro para formar
 um (C₃-C₆)cicloalcano,
 R³ e R⁴ são cada um de modo independente
 um átomo de hidrogênio;
 um átomo de halogênio; ou
- 10 um grupo (C₁-C₆)alquila, ou
 R³ e R⁴ são opcionalmente ligados um ao outro para formar
 um (C₃-C₆)cicloalcano,
 cada Y é de modo independente
 um átomo de halogênio;
- 15 um grupo ciano;
 um grupo hidróxi;
 um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
 logênio;
 um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais substituintes
- 20 selecionados entre o grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo
 (C₁-C₆)alcóxi;
 um grupo (C₂-C₆)alquenilóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de
 halogênio;
 um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de
- 25 halogênio;
 um grupo (C₁-C₆)alquilsulfinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos
 de halogênio;
 um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos
 de halogênio;
- 30 um grupo fenila opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou
 mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
 (i) um átomo de halogênio,

(ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e

(iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

5 um grupo fenóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em

(i) um átomo de halogênio,

(ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e

10 (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; ou

um grupo heterociclilóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em

(i) um átomo de halogênio,

15 (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e

(iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

n é um inteiro de 1 a 3,

20 dois Y's que se tornam adjacentes quando n é um inteiro de 2 ou 3 são opcionalmente ligados um ao outro para apresentar

um grupo (C₃-C₅)alquileno;

um grupo (C₃-C₅)alquenileno;

um grupo (C₂-C₄)alquilenooxi; ou

25 um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

X¹ é

um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
30 logênio, e

p é 0,

ou um sal dos mesmos;

[7] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida do [1] ou [2] mencionados acima, em que

A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A3),
ou um sal dos mesmos;

5 [8] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida dos [1] ou [7] mencionados acima, em que

A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A3),

E é

C-H;

10 C-Y (Y é conforme definido abaixo) ou

um átomo de nitrogênio,

R¹ e R² são cada um de modo independente

um átomo de hidrogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquila, ou

15 R¹ e R² são opcionalmente ligados um ao outro para formar

um (C₃-C₆)cicloalcano,

R³ e R⁴ são cada um de modo independente

um átomo de hidrogênio;

um átomo de halogênio; ou

20 um grupo (C₁-C₆)alquila,

R³ e R⁴ são opcionalmente ligados um ao outro para formar

um (C₃-C₆)cicloalcano, ou

R³ e R⁴ opcionalmente formam um átomo de oxigênio em combinação,

cada Y é de modo independente

25 um átomo de halogênio;

um grupo ciano;

um grupo hidróxi;

um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

30 um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₂-C₆)alquenilóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de

- halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo fenila opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo fenóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; ou
- um grupo heterociclíloxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,
- n é um inteiro de 1 a 3,
- dois Y's que se tornam adjacentes quando n é um inteiro de 2 ou 3 são opcionalmente ligados um ao outro para apresentar
- um grupo (C₃-C₅)alquileno;

- um grupo (C₃-C₅)alquenileno;
 um grupo (C₂-C₄)alquilenooxi; ou
 um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,
- 5 X¹ é
 um átomo de halogênio; ou
 um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio, e
 p e q são cada 0,
- 10 ou um sal dos mesmos;
 [9] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida do [8] mencionado acima, em que
 E é C-H ou C-Y (Y é conforme definido no [8]) mencionado acima,
 ou um sal dos mesmos;
- 15 [10] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida dos [1] ou [2] mencionados acima, em que
 A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A4),
 ou um sal dos mesmos;
- 20 [11] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida de qualquer um dos [1], [2] e [10] mencionados acima, em que
 A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A4),
 E é
 C-H ou
 C-Y (Y é conforme definido abaixo),
- 25 R¹ e R² são cada um de modo independente
 um átomo de hidrogênio; ou
 um grupo (C₁-C₃)alquila,
 R³ e R⁴ são cada um de modo independente
 um átomo de hidrogênio;
- 30 um átomo de halogênio; ou
 um grupo (C₁-C₆)alquila, ou
 R³ e R⁴ são opcionalmente ligados um ao outro para formar

- um (C₃-C₆)cicloalcano,
 cada Y é de modo independente
 um átomo de halogênio;
 um grupo ciano;
- 5 um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
 um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
 um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de
- 10 halogênio;
 um grupo (C₁-C₆)alquilsulfinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
 um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- 15 um grupo fenila opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
 (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- 20 (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; ou
- um grupo fenóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- 25 (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,
- n é um inteiro de 1 a 3,
- 30 dois Y's que se tornam adjacentes quando n é um inteiro de 2 ou 3 são opcionalmente ligados um ao outro para apresentar
- um grupo (C₃-C₅)alquileno;

- um grupo (C₃-C₅)alquenileno;
 um grupo (C₂-C₄)alquilenooxi; ou
 um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,
- 5 X³ é um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio, e
 Q é um átomo de enxofre,
 ou um sal dos mesmos;
- 10 [12] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida dos [1] ou [2] mencionados acima, em que
 A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A5),
 ou um sal dos mesmos;
- [13] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida de qualquer um dos [1], [2] e [12] mencionados acima, em que
- 15 A é grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A5),
 E é
 C-H ou
 C-Y (Y é conforme definido abaixo),
 R¹ e R² são cada um de modo independente
- 20 um átomo de hidrogênio; ou
 um grupo (C₁-C₃)alquila,
 R³ e R⁴ são cada um de modo independente
 um átomo de hidrogênio;
 um átomo de halogênio; ou
- 25 um grupo (C₁-C₆)alquila, ou
 R³ e R⁴ são opcionalmente ligados um ao outro para formar
 um (C₃-C₆)cicloalcano,
 cada Y é de modo independente
 um átomo de halogênio;
- 30 um grupo ciano;
 um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

- um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- 5 um grupo (C₁-C₆)alquilsulfinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- 10 um grupo fenila opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais
- 15 átomos de halogênio; ou
- um grupo fenóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais
- 20 átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,
- n é um inteiro de 1 a 3,
- dois Y's que se tornam adjacentes quando n é um inteiro de 2 ou 3 são opcional-
- 25 mente ligados um ao outro para apresentar
- um grupo (C₃-C₅)alquileno;
- um grupo (C₃-C₅)alquenileno;
- um grupo (C₂-C₄)alquilenooxi; ou
- um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos
- 30 de halogênio,
- X¹ é
- um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

X⁴ é

um átomo de hidrogênio;

5 um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio, e

X⁵ é

um átomo de hidrogênio; ou

10 um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

ou um sal dos mesmos;

[14] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida dos [1] ou [2] mencionados acima, em que

15 A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A6),
ou um sal dos mesmos;

[15] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida de qualquer um dos [1], [2] e [14] mencionados acima, em que

A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A6),

20 E é

C-H ou

C-Y (Y é conforme definido abaixo),

R¹ e R² são cada um de modo independente

um átomo de hidrogênio; ou

25 um grupo (C₁-C₃)alquila,

R³ e R⁴ são cada um de modo independente

um átomo de hidrogênio;

um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₆)alquila, ou

30 R³ e R⁴ são opcionalmente ligados um ao outro para formar

um (C₃-C₆)cicloalcano,

cada Y é de modo independente

- um átomo de halogênio;
- um grupo ciano;
- um grupo (C₁-C₆)alcquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- 5 um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquilsulfinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos
- 10 de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo fenila opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- 15 (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alcquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; ou
- 20 um grupo fenóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alcquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- 25 (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,
- n é um inteiro de 1 a 3,
- dois Y's que se tomam adjacentes quando n é um inteiro de 2 ou 3 são opcionalmente ligados um ao outro para apresentar
- 30 um grupo (C₃-C₅)alquileno;
- um grupo (C₃-C₅)alquenileno;
- um grupo (C₂-C₄)alquilenoóxi; ou

um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

X¹ é

um átomo de halogênio; ou

5 um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio, e

X⁶ é

um átomo de hidrogênio;

um grupo amino;

10 um grupo mono(C₁-C₃)alquilamino;

um grupo di(C₁-C₃)alquilamino;

um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

15 ou um sal dos mesmos;

[16] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida dos [1] ou [2] mencionados acima, em que

A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A7),

ou um sal dos mesmos;

20 [17] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida de qualquer um dos [1], [2] e [16] mencionados acima, em que

A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A7),

E é

C-H ou

25 C-Y (Y é conforme definido abaixo),

R¹ e R² são cada um de modo independente

um átomo de hidrogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquila,

R³ e R⁴ são cada um de modo independente

30 um átomo de hidrogênio;

um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₆)alquila, ou

- R^3 e R^4 são opcionalmente ligados um ao outro para formar
 um (C_3 - C_6)cicloalcano,
 cada Y é de modo independente
 um átomo de halogênio;
 5 um grupo ciano;
 um grupo (C_1 - C_6)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
 logênio;
 um grupo (C_1 - C_6)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
 logênio;
 10 um grupo (C_1 - C_6)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de
 halogênio;
 um grupo (C_1 - C_6)alquilsulfinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos
 de halogênio;
 um grupo (C_1 - C_6)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos
 15 de halogênio;
 um grupo fenila opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou
 mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
 (i) um átomo de halogênio,
 (ii) um grupo (C_1 - C_6)alquila opcionalmente substituído por um ou mais
 20 átomos de halogênio e
 (iii) um grupo (C_1 - C_6)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais
 átomos de halogênio; ou
 um grupo fenóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou
 mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
 25 (i) um átomo de halogênio,
 (ii) um grupo (C_1 - C_6)alquila opcionalmente substituído por um ou mais
 átomos de halogênio e
 (iii) um grupo (C_1 - C_6)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais
 átomos de halogênio,
 30 n é um inteiro de 1 a 3,
 dois Y's que se tornam adjacentes quando n é um inteiro de 2 ou 3 são opcional-
 mente ligados um ao outro para apresentar

- um grupo (C₃-C₅)alquilenos;
 um grupo (C₃-C₅)alquenileno;
 um grupo (C₂-C₄)alquilenooxi; ou
 um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos
 5 de halogênio,
 X³ é um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de
 halogênio, e
 X⁴ e X⁷ são cada um de modo independente
 um átomo de hidrogênio;
 10 um átomo de halogênio; ou
 um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
 logênio,
 ou um sal dos mesmos;
 [18] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida dos [1] ou [2] mencionados
 15 acima, em que
 A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A8),
 ou um sal dos mesmos;
 [19] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida de qualquer um dos [1], [2] e
 [18] mencionados acima, em que
 20 A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A8),
 E é
 C-H ou
 C-Y (Y é conforme definido abaixo),
 R¹ e R² são cada um de modo independente
 25 um átomo de hidrogênio; ou
 um grupo (C₁-C₃)alquila,
 R³ e R⁴ são cada um de modo independente
 um átomo de hidrogênio;
 um átomo de halogênio; ou
 30 um grupo (C₁-C₆)alquila, ou
 R³ e R⁴ são opcionalmente ligados um ao outro para formar
 um (C₃-C₆)cicloalcano,

- cada Y é de modo independente
- um átomo de halogênio;
- um grupo ciano;
- um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
- 5 logênio;
- um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
- logênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de
- halogênio;
- 10 um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos
- de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos
- de halogênio;
- um grupo fenila opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou
- 15 mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais
- átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais
- 20 átomos de halogênio; ou
- um grupo fenóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou
- mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais
- 25 átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais
- átomos de halogênio,
- n é um inteiro de 1 a 3,
- dois Y's que se tornam adjacentes quando n é um inteiro de 2 ou 3 são opcional-
- 30 mente ligados um ao outro para apresentar
- um grupo (C₃-C₅)alquilenos;
- um grupo (C₃-C₅)alquenilenos;

um grupo (C₂-C₄)alquilenooxi; ou

um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio, e

5 X³ é um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

ou um sal dos mesmos;

[20] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida dos [1] ou [2] mencionados acima, em que

10 A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A9),
ou um sal dos mesmos;

[21] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida de qualquer um dos [1], [2] e [20] mencionados acima, em que

A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A9),

E é

15 C-H ou

C-Y (Y é conforme definido abaixo),

R¹ e R² são cada um de modo independente

um átomo de hidrogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquila,

20 R³ e R⁴ são cada um de modo independente

um átomo de hidrogênio;

um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₆)alquila, ou

R³ e R⁴ são opcionalmente ligados um ao outro para formar

25 um (C₃-C₆)cicloalcano,

cada Y é de modo independente

um átomo de halogênio;

um grupo ciano;

30 um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₁-C₆)alquilsulfinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

5 um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo fenila opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em

(i) um átomo de halogênio,

10 (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e

(iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; ou

15 um grupo fenóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em

(i) um átomo de halogênio,

(ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e

(iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais

20 átomos de halogênio,

n é um inteiro de 1 a 3,

dois Y's que se tornam adjacentes quando n é um inteiro de 2 ou 3 são opcionalmente ligados um ao outro para apresentar

um grupo (C₃-C₅)alquileno;

25 um grupo (C₃-C₅)alquenileno;

um grupo (C₂-C₄)alquilenooxi; ou

um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

X¹ é

30 um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio, e

- X^8 e X^9 são cada um de modo independente
 um átomo de hidrogênio;
 um átomo de halogênio; ou
 um grupo (C_1-C_3)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
 5 logênio,
 ou um sal dos mesmos;
 [22] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida dos [1] ou [2] mencionados
 acima, em que
 A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A10),
 10 ou um sal dos mesmos;
 [23] o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida de qualquer um dos [1], [2] e
 [22] mencionados acima, em que
 A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A10),
 E é
 15 C-H ou
 C-Y (Y é conforme definido abaixo),
 R^1 e R^2 são cada um de modo independente
 um átomo de hidrogênio; ou
 um grupo (C_1-C_3)alquila, ou
 20 R^3 e R^4 são cada um de modo independente
 um átomo de hidrogênio;
 um átomo de halogênio; ou
 um grupo (C_1-C_6)alquila, ou
 R^3 e R^4 são opcionalmente ligados um ao outro para formar
 25 um (C_3-C_6)cicloalcano,
 cada Y é de modo independente
 um átomo de halogênio;
 um grupo ciano;
 um grupo (C_1-C_6)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
 30 logênio;
 um grupo (C_1-C_6)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de ha-
 logênio;

- um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo (C₁-C₆)alquilsulfinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- 5 um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo fenila opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- 10 (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; ou
- um grupo fenóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou
- 15 mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em
- (i) um átomo de halogênio,
- (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais
- 20 átomos de halogênio,
- n é um inteiro de 1 a 3,
- dois Y's que se tornam adjacentes quando n é um inteiro de 2 ou 3 são opcionalmente ligados um ao outro para apresentar
- um grupo (C₃-C₅)alquilenos;
- 25 um grupo (C₃-C₅)alquenileno;
- um grupo (C₂-C₄)alquilenooxi; ou
- um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,
- X¹ é um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de
- 30 halogênio, e
- X⁸ e X⁹ são cada um de modo independente
- um átomo de hidrogênio;

um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,

ou um sal dos mesmos;

- 5 [24] um agente controlador de praga compreendendo o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida de qualquer um dos [1] a [23] mencionados acima, ou um sal dos mesmos como um ingrediente ativo;

[25] o agente controlador de praga do [24] mencionado acima, o qual é um agente controlador de doença de planta;

- 10 [26] o agente controlador de praga do [24] mencionado acima, o qual é um nematocida; e

[27] um método para controlar pragas, o qual compreende tratar uma planta de safra visada ou o solo usado para cultivo da planta com uma quantidade eficaz do agente controlador de praga de qualquer um dos [24] a [26] mencionados acima.

- 15 A presente invenção proporciona um composto útil como um agente controlador de praga apresentando desempenho superior comparado com a técnica anterior, particularmente um agente controlador de doença de planta ou nematocida tendo um amplo espectro de controle em uma baixa dose.

Melhor Modo para Incorporar a Invenção

- 20 A definição da fórmula (I) do derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida da presente invenção é explicada a seguir.

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

- 25 O "grupo (C₁-C₆)alquila" é grupo alquila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono tal como grupo metila, grupo etila, grupo propila normal, grupo isopropila, grupo butila normal, grupo isobutila, grupo butila secundário, grupo butila terciário, grupo pentila normal, grupo neopentila, grupo hexila normal e semelhantes.

- 30 O "grupo (C₁-C₃)alquila" é grupo alquila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 3 átomos de carbono, tal como grupo metila, grupo etila, grupo propila normal, grupo isopropila e semelhantes.

O "grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais

átomos de halogênio" é grupo alquila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, tal como grupo metila, grupo etila, grupo propila normal, grupo isopropila, grupo butila normal, grupo isobutila, grupo butila secundário, grupo butila terciário, grupo pentila normal, grupo neopentila, grupo hexila normal e semelhantes; e grupo alquila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo trifluórmethyl, grupo difluórmethyl, grupo perfluoroetila, grupo perfluoroisopropila, grupo clorometila, grupo bromometila, grupo 1-bromoetila, grupo 2,3-dibromopropila e semelhantes.

O "grupo (C_1-C_3)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio" é grupo alquila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 3 átomos de carbono, tal como grupo metila, grupo etila, grupo propila normal, grupo isopropila e semelhantes; e grupo alquila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 3 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo trifluórmethyl, grupo difluórmethyl, grupo perfluoroetila, grupo perfluoroisopropila, grupo clorometila, grupo bromometila, grupo 1-bromoetila, grupo 2,3-dibromopropila e semelhantes.

O "grupo (C_2-C_6)alquênica opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio" é grupo alquênica de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono, tal como grupo vinil, grupo propenil, grupo butenila e semelhantes; e grupo alquênica de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 2 to 6 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo fluorovinila, grupo difluorovinila, grupo perfluorovinila, grupo 3,3-dicloro-2-propenil, grupo 4,4-difluoro-3-butenila e semelhantes.

O "grupo (C_2-C_6)alquina opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio" é grupo alquina de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono, tal como grupo etinila, grupo propinil, grupo butinila e semelhantes; e grupo alquina de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo fluoroetinila, grupo perfluoropropinila, grupo 4,4,4-trifluor-2-butinila e semelhantes.

O "grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio" é grupo alcóxi de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono tal como grupo metóxi, grupo etóxi, grupo propóxi normal, grupo isopropóxi, grupo butóxi normal, grupo butóxi secundário, grupo butóxi terciário, grupo pentilaóxi normal, grupo isopentilaóxi, grupo neopentilaóxi, grupo hexilaóxi normal e semelhantes; e grupo alcóxi de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo trifluórmétóxi, grupo difluorometóxi, grupo perfluoroetóxi, grupo perfluoroisopropóxi, grupo clorometóxi, grupo bromometóxi, grupo 1-bromoetóxi, grupo 2,3-dibromopropóxi e semelhantes.

O "grupo (C₁-C₃)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio" é grupo alcóxi de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 3 átomos de carbono tal como grupo metóxi, grupo etóxi, grupo propóxi normal, grupo isopropóxi e semelhantes; e grupo alcóxi de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 3 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo trifluórmétóxi, grupo difluorometóxi, grupo perfluoroetóxi, grupo perfluoroisopropóxi, grupo clorometóxi, grupo bromometóxi, grupo 1-bromoetóxi, grupo 2,3-dibromopropóxi e semelhantes.

O "grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais substituintes selecionados entre o grupo consistindo em átomo de halogênio e grupo (C₁-C₆)alcóxi" é grupo alcóxi de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono tal como grupo metóxi, grupo etóxi, grupo propóxi normal, grupo isopropóxi, grupo butóxi normal, grupo butóxi secundário, grupo butóxi terciário, grupo pentilaóxi normal, grupo isopentilaóxi, grupo neopentilaóxi, grupo hexilaóxi normal e semelhantes; e grupo alcóxi de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio e/ou os mesmos ou diferentes, um ou mais grupos (C₁-C₆)alcóxi, tais como grupo trifluórmétóxi, grupo difluorometóxi, grupo perfluoroetóxi, grupo perfluoroisopropóxi, grupo clorometóxi, grupo bromometóxi, grupo 1-bromoetóxi, grupo 2,3-dibromopropóxi, grupo metoximetóxi, grupo etoximetóxi, grupo propoximetóxi, grupo metoxietóxi, grupo etoxietóxi e semelhantes.

O "grupo (C₂-C₆)alquenilóxi opcionalmente substituído por um ou

mais átomos de halogênio" é grupo alquenilóxi de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono tal como grupo propenilóxi, grupo butenilóxi, grupo pentenilóxi e semelhantes; e grupo alquenilóxi de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo fluorovinilóxi, grupo difluorovinilóxi, grupo perfluorovinilóxi, grupo 3,3-dicloro-2-propenilóxi, grupo 4,4-difluoro-3-butenilóxi e semelhantes.

O "grupo (C₂-C₆)alquinilóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio" é grupo alquinilóxi de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono tal como grupo propinilóxi, grupo butinilóxi, grupo pentinilóxi e semelhantes; e grupo alquinilóxi de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 2 a 6 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo fluoroetinilóxi, grupo perfluoropropinilóxi, grupo 4,4,4-trifluor-2-butinilóxi e semelhantes.

O "grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio" é grupo alquiltio de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono tal como grupo metilatio, grupo etilatio, grupo propilatio normal, grupo isopropilatio, grupo butilatio normal, grupo butilatio secundário, grupo butilatio terciário, grupo pentilatio normal, grupo isopentilatio, grupo hexilatio normal e semelhantes; e grupo alquiltio de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo trifluormetilatio, grupo difluorometilatio, grupo perfluoroetilatio, grupo perfluoroisopropilatio, grupo clorometilatio, grupo bromometilatio, grupo 1-bromoetilatio, grupo 2,3-dibromopropilatio e semelhantes.

O "grupo (C₁-C₃)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio" é grupo alquiltio de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 3 átomos de carbono tal como grupo metilatio, grupo etilatio, grupo propilatio normal, grupo isopropilatio e semelhantes; e grupo alquiltio de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 3 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo trifluormetilatio, grupo difluorometilatio, grupo perfluoroetilatio, grupo perfluoroisopropilatio, grupo

clorometilatio, grupo bromometilatio, grupo 1-bromoetilatio, grupo 2,3-dibromopropilatio e semelhantes.

O "grupo (C₁-C₆)alquilsulfinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio" é grupo alquilsulfinila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono tal como grupo metilasulfinila, grupo etilasulfinila, grupo propilasulfinila normal, grupo isopropilasulfinila, grupo butilsulfinila normal, grupo butilsulfinila secundário, grupo butilsulfinila terciário, grupo pentilasulfinil normal, grupo isopentilsulfinila, grupo hexilsulfinila normal e semelhantes; e grupo alquilsulfinila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo trifluormetilsulfinila, grupo difluormetilsulfinila, grupo perflúoretilsulfinila, grupo perflúorisopropilsulfinila, grupo clorometilsulfinila, grupo bromometilsulfinila, grupo 1-bromoetilsulfinila, grupo 2,3-dibromopropilsulfinila e semelhantes.

O "grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio" é grupo alquilsulfonila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, tal como grupo metilsulfonila, grupo etilsulfonila, grupo propilsulfonila normal, grupo isopropilsulfonila, grupo butilsulfonila normal, butilsulfonila secundário, grupo butilsulfonila terciário, grupo pentilsulfonila normal, grupo isopentilsulfonila, grupo hexilsulfonila normal e semelhantes; e grupo alquilsulfonila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 6 átomos de carbono, o qual é substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como grupo trifluormetilsulfonila, grupo difluormetilsulfonila, grupo perflúoretilsulfonila, grupo perflúorisopropilsulfonila, grupo clorometilsulfonila, grupo bromometilsulfonila, grupo 1-bromoetilsulfonila, grupo 2,3-dibromopropilsulfonila e semelhantes.

O "grupo (C₁-C₆)alcóxi-carbonila" é grupo alcóxi-carbonila em que o alcóxi é de cadeia reta ou de cadeia ramificada e tem 1 a 6 átomos de carbono; tal como grupo metoxycarbonilaa, grupo etoxycarbonila, grupo propoxycarbonila normal, grupo isopropoxycarbonila, grupo butoxycarbonila normal, grupo butoxycarbonila terciário e semelhantes.

O "grupo (C₁-C₆)alcoxiimino(C₁-C₃)alquila" é grupo alcoxiimino(C₁-

C₃)alquila em que o alcóxi é de cadeia reta ou de cadeia ramificada e tem 1 a 6 átomos de carbono, tal como grupo metoxiiminometila, grupo etoxiiminometila, grupo propoxiiminometila normal, grupo isopropoxiiminoetila e semelhantes.

5 O "grupo (C₃-C₃₀)trialquilsilila" é grupo alquilsilila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 3 a 30 átomos de carbono no total, tal como grupo trimetilsilila, grupo trietilsilila e semelhantes.

Como o "(C₃-C₆)cicloalcano" formado por R¹ e R² ou R³ e R⁴, os quais são ligados por um ao outro, podem ser mencionados ciclopropano, ciclobutano, ciclopentano, ciclohexano e semelhantes.

10 Como o "grupo (C₃-C₅)alquilenos", podem ser mencionados grupo trimetileno, grupo tetrametileno, grupo pentametileno e semelhantes.

Como o "grupo (C₃-C₅)alquilenos", podem ser mencionados -CH₂-CH=CH-, -CH₂-CH₂-CH=CH-, -CH=CH-CH=CH-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH=CH-, -CH₂-CH₂-CH=CH-CH₂-, -CH=CH-CH=CH-CH₂- e semelhantes.

15 Como o "grupo (C₂-C₄)alquilenooxi", podem ser mencionados -CH₂-CH₂-O-, -CH₂-CH₂-CH₂-O-, -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-O- e semelhantes.

Como o "grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio", grupo alquilenodióxi tendo 1 a 3 átomos de carbono tal como -O-CH₂-O-, -O-CH₂-CH₂-O-, -O-CH₂-CH₂-CH₂-O- e semelhantes; e o grupo alquilenodióxi substituído pelo mesmo ou diferentes, um ou mais átomos de halogênio, tal como -O-CF₂-O-, -O-CF₂-CF₂-O-, -O-CCl₂-O- e semelhantes.

20

O "grupo mono(C₁-C₃)alquilamino" é grupo alquilamino em que a alquila é de cadeia reta ou de cadeia ramificada e tem 1 a 3 átomos de carbono, tal como grupo metilamino, grupo etilamino, grupo propilamino normal, grupo isopropilamino e semelhantes.

25

O "grupo di(C₁-C₃)alquilamino" é grupo amino tendo dois os mesmos ou diferentes grupos alquila de cadeia reta ou de cadeia ramificada tendo 1 a 3 átomos de carbono, tal como grupo dimetilamino, grupo dietilamino, grupo dinormal propilamino, grupo diisopropilamino, grupo N-metila-N-etilamino, grupo N-metila-N-isopropilamino e semelhantes.

30

O "grupo heterociclíloxi" é grupo heterociclíloxi de 5 ou de 6 membros

tendo 1 a 3, os mesmos ou diferentes heteroátomos selecionados entre átomo de oxigênio, átomo de enxofre e átomo de nitrogênio, ou grupo heterociclilóxi fundido do mesmo, tal como grupo furilóxi, grupo tienilóxi, grupo pirazolilóxi, grupo imidazolilóxi, grupo triazolilóxi, grupo tiazolilóxi, grupo piridilóxi, grupo pirimidinilóxi, grupo pirazinilóxi, grupo triazinilóxi, grupo indolilóxi, grupo benzotiazolilóxi, grupo quinolilóxi, grupo quinazolinilóxi, grupo quinoxalinilóxi e semelhantes.

O derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida representado pela fórmula (I) da presente invenção é sob as seguintes condições (1) e (2), para evitar coincidência accidental com um composto conhecido.

(1) Quando E é átomo de nitrogênio, A é grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A3).

(2) 2,6-Dicloro-N-[2-{3-(trifluórmethyl)fenil}etil]benzamida é excluído.

Como os sais do derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida representado pela fórmula (I) da presente invenção, por exemplo, sais de ácidos inorgânicos tais como cloridrato, sulfato, nitrato, fosfato e semelhantes, sais de ácidos orgânicos tais como acetato, fumarato, maleato, oxalato, metanossulfonato, benzenossulfonato, paratoluenossulfonato e semelhantes, e sais com bases inorgânicas ou orgânicas tais como íon de sódio, íon de potássio, íon de cálcio, trimetilamônio e semelhantes podem ser mencionados como exemplos.

No composto representado pela fórmula (I) da presente invenção, R^1 e R^2 são cada um preferencialmente átomo de hidrogênio; grupo metila; ou grupo etila. No mínimo um de R^1 e R^2 é mais preferencialmente átomo de hidrogênio, e um dos enantiômeros opticamente ativos causados por estes é mais preferencial.

R^3 e R^4 são cada um de modo independente átomo de hidrogênio; átomo de flúor; ou R^3 e R^4 são preferencialmente ligados um ao outro para formar ciclopropano.

Y é preferencialmente átomo de halogênio tal como átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo, átomo de iodo e semelhantes; grupo hidróxi; grupo (C₁-C₄)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; grupo (C₂-C₄)alquenila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; grupo (C₁-C₄)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; grupo (C₂-C₄)alquenilóxi opcionalmente substituído por um ou mais

átomos de halogênio; grupo (C₁-C₄)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; grupo fenila opcionalmente substituído por um ou mais substituintes selecionados entre grupo substituinte Z; ou grupo fenóxi opcionalmente substituído por um ou mais substituintes selecionados entre grupo substituinte Z, ou os dois Y's adjacentes são preferencialmente ligados um ao outro para formar grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio.

Z é preferencialmente átomo de halogênio; grupo halo(C₁-C₄)alquila; ou grupo halo(C₁-C₄)alcóxi.

10 n é preferencialmente 2 ou 3.

A é preferencialmente grupo cíclico substituído selecionado entre o grupo consistindo da fórmula (A1), (A2), (A3), (A4), (A5), (A6), (A7) e (A9), e mais preferencialmente grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A3).

15 X¹ é preferencialmente átomo de halogênio; grupo (C₁-C₃)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio tal como grupo trifluórmethyla, grupo difluórmethyla e semelhantes; grupo (C₁-C₃)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio tal como grupo trifluórmethylóxi, grupo difluórmethylóxi e semelhantes; ou grupo (C₁-C₃)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio tal como grupo trifluórmethylatio, grupo difluórmethylatio e semelhantes, e mais preferencialmente grupo trifluórmethyla.

20 X² é preferencialmente átomo de hidrogênio, átomo de flúor ou átomo de cloro, e mais preferencialmente átomo de hidrogênio.

X³ é preferencialmente grupo metila, grupo trifluórmethyla ou grupo difluórmethyla.

25 X⁴, X⁷, X⁸ e X⁹ são preferencialmente átomos de hidrogênio.

X⁵ é preferencialmente grupo metila.

X⁶ é preferencialmente átomo de hidrogênio, grupo amino, átomo de cloro ou grupo metila.

Q é preferencialmente átomo de enxofre.

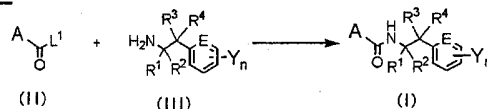
30 p e q são cada um preferencialmente 0.

E é preferencialmente C-H ou C-Y (Y é conforme definido acima).

Embora o composto da presente invenção possa ser produzido, por

exemplo, de acordo com os seguintes métodos de produção, os métodos de produção não são limitados aos mesmos.

Método de produção 1



em que A, R¹, R², R³, R⁴, E, Y e n são conforme definido acima, e L¹ é grupo de partida tal como átomo de cloro, átomo de bromo, grupo alcóxi e semelhantes.

O derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida representado pela fórmula (I) da presente invenção pode ser produzido reagindo o derivado de ácido (hetero)cíclico carboxílico representado pela fórmula (II) com o derivado de 2-(hetero)ariletilamina representado pela fórmula (III) na presença de uma base em um solvente inerte.

A temperatura de reação desta reação é geralmente dentro da faixa de -20°C a 120°C, e o tempo de reação é geralmente dentro da faixa de 0,2 hora a 24 horas. O derivado de N-2-(hetero)ariletilamina representado pela fórmula (III) é usado geralmente dentro da faixa de 0,2 a 5 vezes molares em relação ao derivado de ácido (hetero)cíclico carboxílico representado pela fórmula (II).

Como uma base, por exemplo, bases inorgânicas tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, carbonato de hidrogênio de sódio, carbonato de hidrogênio de potássio e semelhantes; acetatos tais como acetato de sódio, acetato de potássio e semelhantes; alcóxidos de metais de álcali tais como t-butóxido de potássio, metóxido de sódio, etóxido de sódio e semelhantes; aminas terciárias tais como trietilamina, diisopropilaetilamina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno e semelhantes; compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como piridina, dimetilaminopiridina e semelhantes, e semelhantes podem ser mencionados. A quantidade da base usada é geralmente dentro da faixa de 0,5 a 10 vezes molares em relação ao derivado de ácido (hetero)cíclico carboxílico representado pela fórmula (II).

Nesta reação, um solvente pode ou não ser usado. Qualquer solvente pode ser usado na medida que não iniba marcadamente a reação e, por exemplo, podem ser usados álcoois tais como metanol, etanol, propanol, butanol, 2-propanol e semelhantes; éteres lineares ou cíclicos tais como éter dietílico, tetrai-

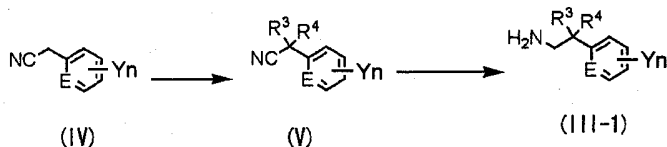
drofurano, dioxano e semelhantes; hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e semelhantes; hidrocarbonetos halogenados tais como cloreto de metileno, clorofórmio, tetracloreto de carbono e semelhantes, hidrocarbonetos aromáticos halogenados tais como clorobenzeno, diclorobenzeno e semelhantes; nitrilas tais como acetonitrila e semelhantes; ésteres tais como acetato de etila, acetato de butila e semelhantes; solventes polares tais como N,N-dimetilaformamida, N,N-dimetilacetamida, sulfóxido de dimetila, 1,3-dimetila-2-imidazolidinona, água, ácido acético e semelhantes. Estes solventes inertes podem ser usados sozinhos ou em uma mistura de dois ou mais tipos dos mesmos.

Depois do completamento da reação, um composto desejado pode ser isolado de uma mistura da reação contendo o composto desejado por um método convencional e, onde necessário, purificado por recristalização, cromatografia de coluna e semelhantes.

O derivado de ácido (hetero)cíclico carboxílico representado pela fórmula (II) a ser usado para esta reação pode ser produzido por um método descrito em uma publicação conhecida (por exemplo, WO 05/115994, WO 01/42223, WO 03/066609, WO 03/066610, WO 03/099803, WO 03/099804, WO 03/080628 etc.) ou um método análogo aos mesmos.

O derivado de 2-(hetero)ariletilamina representado pela fórmula (III) pode ser produzido, por exemplo, de acordo com os seguintes métodos de produção intermediária 1 a 4.

Método de produção intermediário 1 (quando R¹ e R² são átomos de hidrogênio)

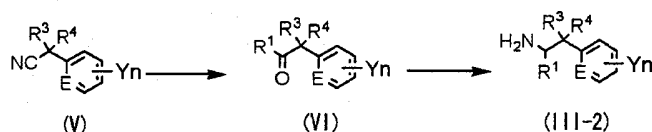


em que R³, R⁴, E, Y e n são conforme definido acima.

Esta reação pode ser realizada de acordo com um método descrito em uma publicação conhecida (por exemplo, Tetrahedron, 2002, 58(11), p.2211 etc.), ou um método análogo a este. Isto é, o derivado de 2-(hetero)ariletilamina representado pela fórmula (III-1) pode ser produzido reagindo o derivado de acetonitrila representado pela fórmula (IV) com o agente de alquilação correspondente na presença de uma base em um solvente inerte para dar o derivado de (hete-

ro)arilacetonitrila representado pela fórmula (V) e seguido por, com ou sem isolamento do derivado de (hetero)arilacetonitrila (V), hidrogenação em um solvente inerte na presença de um catalisador tal como níquel de Raney e semelhantes, ou redução com um agente redutor tal como hidreto de alumínio de lítio e semelhantes.

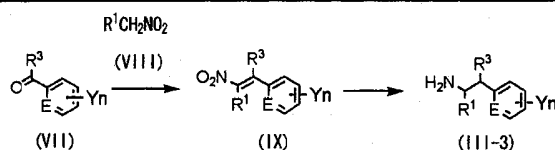
Método de produção intermediário 2 (quando R² é átomo de hidrogênio)



em que R¹, R³, R⁴, E, Y e n são conforme definido acima.

Esta reação pode ser realizada de acordo com um método descrito em uma publicação conhecida (por exemplo, J. Med. Chem., 1986, 29, p.302; Angew. Chem., 1989, 28(2), p.218. etc.), ou um método análogo a este. Isto é, um derivado 2-(hetero)ariletilamina representado pela fórmula (III-2) pode ser produzido submetendo um derivado (hetero)arilacetonitrila representado pela fórmula (V) a uma reação de Grignard para dar um derivado cetona representado pela fórmula (VI) e seguido por, com ou sem isolamento do derivado cetona, uma reação de Leuckart-Wallach ou uma reação de aminação redutiva similar, ou reação com hidroxilamina para dar um derivado hidroxima, o qual é em seguida hidrogenado na presença de um catalisador tal como níquel de Raney e semelhantes.

Método de produção intermediário 3 (quando R² e R⁴ são átomos de hidrogênio)

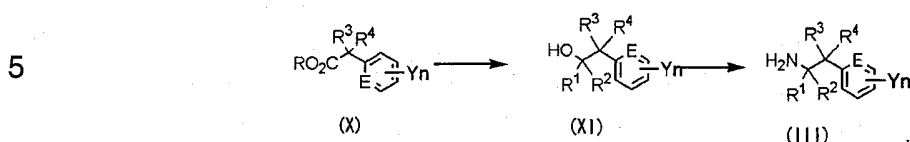


em que R¹, R³, E, Y e n são conforme definido acima.

Esta reação pode ser realizada de acordo com um método descrito em uma publicação conhecida (por exemplo, Tetrahedron, 1995, 51(18), p.5361 etc.), ou um método análogo a este. Isto é, um derivado 2-(hetero)ariletilamina representado pela fórmula (III-3) pode ser produzido reagindo um derivado cetona representado pela fórmula (VII) com nitroalcano representado pela fórmula (VIII) para dar um derivado nitroalqueno representado pela fórmula (IX) e seguido por, com ou sem isolamento do derivado nitroalqueno (IX), redução metálica com pó

de zinco e semelhantes, hidrogenação catalítica usando um catalisador tal como níquel de Raney e semelhantes, ou redução usando um agente redutor tal como hidreto de alumínio de lítio e semelhantes.

Método de produção intermediário 4



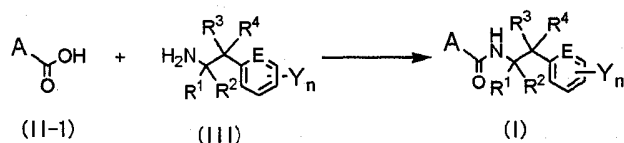
em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , E, Y e n são conforme definido acima.

Esta reação pode ser realizada de acordo com um método descrito em uma publicação conhecida (por exemplo, J. Am. Chem. Soc., 1950, 72, p.2786. e etc.), ou um método análogo a este. Isto é, uma 2-(hetero)ariletilamina derivada representada pela fórmula (III) pode ser produzida submetendo um (hetero)arilacetato derivado representado pela fórmula (X) a uma reação de Grignard ou uma reação similar para dar um derivado álcool (hetero)ariletílico representado pela fórmula (XI), seguida por uma reação de Gabriel de um haleto de (hetero)ariletila derivado obtido a partir do álcool (hetero)ariletílico derivado (XI), ou uma redução de uma (hetero)ariletilazida derivada obtida a partir do álcool derivado.

10

15

Método de produção 2



em que A, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , E, Y e n são conforme definido acima).

O derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida representado pela fórmula (I) da presente invenção pode ser produzido reagindo um ácido (hetero)cíclico carboxílico representado pela fórmula (II-1) com uma 2-(hetero)ariletilamina derivada representada pela fórmula (III) na presença de um agente de condensação e uma base em um solvente inerte.

20

A temperatura de reação desta reação é geralmente dentro da faixa de -20°C a 120°C , e o tempo de reação é geralmente dentro da faixa de 0,2 hora a 24 horas. O derivado de 2-(hetero)ariletilamina representado pela fórmula (III) é geralmente usado dentro da faixa de 0,2 a 5 vezes molares em relação ao derivado de ácido (hetero)cíclico carboxílico representado pela fórmula (II-1).

25

Como o agente de condensação a ser usado nesta reação, por exemplo, podem ser mencionados cianeto de dietilafosforila (DEPC), carbonildiimidazol (CDI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida (DCC), cloridreto de 1-etila-3-(3-dimetilaminopropila)carbodiimida, clorocarbonatos, iodeto de 2-cloro-1-metilpiridínio e semelhantes e a quantidade dos mesmos a ser usado é geralmente dentro da faixa de 0,5 a 3 vezes molares em relação ao derivado de ácido (hetero)cíclico carboxílico representado pela fórmula (II-1).

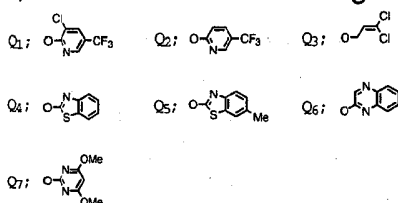
Como uma base, por exemplo, podem ser mencionadas bases inorgânicas tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, carbonato de hidrogênio de sódio, carbonato de hidrogênio de potássio e semelhantes; acetatos tais como acetato de sódio, acetato de potássio e semelhantes; alcóxidos de metais de álcali tais como t-butóxido de potássio, metóxido de sódio, etóxido de sódio e semelhantes; aminas terciárias tais como trietilamina, diisopropilaetilamina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno e semelhantes; compostos aromáticos contendo nitrogênio tais como piridina, dimetilaminopiridina e semelhantes, e semelhantes. A quantidade da base é geralmente usada dentro da faixa de 0,5 a 10 vezes molares em relação ao derivado de ácido (hetero)cíclico carboxílico representado pela fórmula (II-1).

Qualquer solvente pode ser usado para esta reação na medida que não iniba marcadamente a reação e, por exemplo, podem ser mencionados éteres lineares ou cíclicos tais como éter dietílico, tetraidrofurano, dioxano e semelhantes; hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno, xileno e semelhantes; hidrocarbonetos halogenados tais como cloreto de metileno, clorofórmio, tetracloreto de carbono e semelhantes; hidrocarbonetos aromáticos halogenados tais como clorobenzeno, diclorobenzeno e semelhantes; nitrilas tais como acetonitrila e semelhantes; ésteres tais como acetato de etila, butila de ácido acético e semelhantes; e solventes polares tais como N,N-dimetilaformamida, N,N-dimetilacetamida, sulfóxido de dimetila, 1,3-dimetila-2-imidazolidinona e semelhantes. Estes solventes inertes podem ser usados sozinhos ou em uma mistura de dois ou mais tipos dos mesmos.

Depois do completamento da reação, um composto desejado pode ser isolado de uma mistura da reação contendo o composto desejado por um mé-

todo convencional e, onde necessário, purificado por recristalização, cromatografia de coluna e semelhantes.

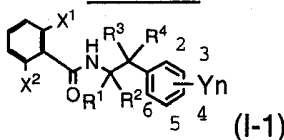
Exemplos típicos do derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida obtido deste modo representado pela fórmula (I) da presente invenção são mostrados na Tabela 1 à Tabela 11. No entanto, o derivado da presente invenção não é limitado aos mesmos. Na Tabela 1 à Tabela 11, "Me" mostra grupo metila, "Et" mostra grupo etila, "Pr" mostra grupo propila, "Bu" mostra grupo butila, "Ph" mostra grupo fenila, "i-" mostra iso, e "Q1 - Q7" mostra as seguintes estruturas.



As propriedades mostram ponto de fusão (°C) ou índice refrativo n_D (temperatura de medição °C).

Na Tabela 3, os composto N°. 3-43-R e 3-43-S são formas oticamente ativas do composto N°. 3-43, e a rotação ótica foi $[\alpha]_D^{25.0} = -48,18$ (C = 1,00, CHCl₃) para 3-43-R e $[\alpha]_D^{25.0} = +48,10$ (C = 1,00, CHCl₃) para 3-43-S. Além disso, dados de espectro de ¹H RMN dos compostos, para os quais "Pasta" está indicada na coluna de propriedade na Tabela 1 à Tabela 11, são mostrados na Tabela 12.

Tabela 1



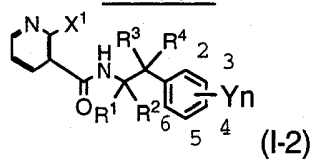
Comp. N°.	X ¹	X ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	propriedade
1- 1	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl	104,9-105,7
1- 2	CF ₃	H	H	H	H	H	3-CF ₃	63-65
1- 3	CF ₃	H	H	H	H	H	4-Cl	116,6-117,6
1- 4	CF ₃	H	H	H	Me	H	4-Cl	89
1- 5	CF ₃	H	H	H	Me	Me	4-Cl	91-92
1- 6	CF ₃	H	H	H	Et	H	4-Cl	Pasta
1- 7	CF ₃	H	H	H	Me	Et	4-Cl	Pasta
1- 8	CF ₃	H	H	H	Et	Et	4-Cl	Pasta
1- 9	CF ₃	H	H	H	i-Bu	H	4-Cl	Pasta
1- 10	I	H	H	H	Me	H	4-Cl	119

1-	11	I	H	H	H	Me	Me	4-Cl	121-122
1-	12	I	H	H	H	Et	H	4-Cl	103
1-	13	I	H	H	H	Me	Et	4-Cl	Pasta
1-	14	I	H	H	H	Et	Et	4-Cl	Pasta
1-	15	I	H	H	H	i-Bu	H	4-Cl	86-91
1-	16	CF ₃	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	104,2-105,2
1-	17	CF ₃	H	H	H	H	H	2,3-Cl ₂	135-136
1-	18	I	H	H	H	H	H	2,3-Cl ₂	145-146
1-	19	CF ₃	H	H	H	H	H	2,6-Cl ₂	148,4-149,4
1-	20	CF ₃	H	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	95-96,8
1-	21	I	H	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	107,2-109,2
1-	22	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-F	81,5-82,8
1-	23	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	97-98
1-	24	I	H	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	121-122,7
1-	25	CF ₃	H	H	H	H	H	2,5-Cl ₂	89,8-90,9
1-	26	CF ₃	H	H	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	112,9-113,7
1-	27	CF ₃	H	H	H	H	H	2,4-Me ₂	75,1-77,2
1-	28	CF ₃	H	H	H	H	H	2,5-Me ₂	94-95
1-	29	I	H	H	H	H	H	2,5-Me ₂	115-116
1-	30	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-5-CF ₃	95,7-96,9
1-	31	I	H	H	H	H	H	2-Cl-5-CF ₃	122-123
1-	32	CF ₃	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	142
1-	33	I	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	161-162
1-	34	CF ₃	H	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	108-112
1-	35	I	H	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	101-103
1-	36	F	F	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	99-101
1-	37	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	107-110
1-	38	I	H	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	50-51
1-	39	CF ₃	H	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	94-97
1-	40	I	H	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	118
1-	41	SCHF ₂	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	103
1-	42	I	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	125-126
1-	43	Br	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	127-128
1-	44	Cl	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	124-126
1-	45	Me	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	136-138
1-	46	F	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	78
1-	47	F	F	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	75-76
1-	48	OCF ₃	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	88-90
1-	49	CF ₃	H	H	H	H	H	4-Ph(4'-OCF ₃)	64-65
1-	50	CF ₃	H	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF ₃)	146-148

1-	51	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	102-103
1-	52	CF ₃	H	H	H	H	2-F-4-Cl	101-102
1-	53	CF ₃	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	Pasta
1-	54	I	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	98-100
1-	55	CF ₃	H	H	H	H	2,4-F ₂	94,4-95,8
1-	56	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	Pasta
1-	57	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	135,7-137,2
1-	58	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	137,8-138,8
1-	59	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	Pasta
1-	60	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	109,6-111,5
1-	61	CF ₃	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	130-131,6
1-	62	CF ₃	H	H	H	H	2,4,5-F ₃	
1-	63	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-CF ₃	144,5-145,5
1-	64	CF ₃	H	Me	H	H	2,4-F ₂	121,5-124,5
1-	65	CF ₃	H	Me	H	H	2-F-4-Cl	140,7-142,3
1-	66	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-OH	169,2-171,6
1-	67	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	
1-	68	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ OCH ₃	109,2-112,9
1-	69	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-Q1	159,5-160,8
1-	70	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-Q2	
1-	71	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-Q3	123,9-125,4
1-	72	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-Q4	
1-	73	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-Q5	
1-	74	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-Q6	
1-	75	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-Q7	
1-	76	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-OPh	118,3-119,8
1-	77	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
1-	78	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
1-	79	CF ₃	H	Me	H	H	2,4,5-F ₃	146,9-148,7
1-	80	CF ₃	H	Me	H	H	2,4,5-Cl ₃	169,1-169,8
1-	81	CF ₃	H	Me	H	H	3,4-Cl ₂	133
1-	82	I	H	Me	H	H	3,4-Cl ₂	143
1-	83	CF ₃	H	Me	H	H	3-OCF ₂ O-4	
1-	84	CF ₃	H	Me	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
1-	85	CF ₃	H	Me	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5	
1-	86	CF ₃	H	Me	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5	
1-	87	CF ₃	H	Me	Me	H	2,4-Cl ₂	121
1-	88	CF ₃	H	Me	Me	H	3,4-Cl ₂	

1-	89	CF ₃	H	Me	Me	H	H	2,4-F ₂	
1-	90	CF ₃	H	Me	Me	H	H	3,4-F ₂	
1-	91	CF ₃	H	CH ₂ CH ₂		H	H	2,4-Cl ₂	
1-	92	CF ₃	H	CH ₂ CH ₂		H	H	2-Cl-4-CF ₃	
1-	93	CF ₃	H	CH ₂ CH ₂		H	H	2-F-4-CF ₃	
1-	94	CF ₃	H	H	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	95,4-96,2
1-	95	CF ₃	H	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	160,2-161,1
1-	96	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	103,6-104,7
1-	97	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	
1-	98	CF ₃	H	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
1-	99	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
1-	100	CF ₃	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	98,7-99
1-	101	CF ₃	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
1-	102	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	74,1-76,3
1-	103	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Cl-4-SMe	125,4-128,4
1-	104	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-SOMe	128,9-129,6
1-	105	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me	135,4-137,1
1-	106	CF ₃	H	Me	H	H	H	2-Br-4-Cl	143,0
1-	107	CF ₃	H	H	H	H	H	2-Br-4-F	106,4
1-	108	CF ₃	H	H	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	126,0
1-	109	F	F	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	134,6-136,7

Tabela 2



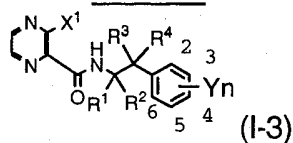
Comp. N°.	X¹	R¹	R²	R³	R⁴	Yn	propriedade
2- 1	CF ₃	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	104,2-105,2
2- 2	Cl	H	H	H	H	2-Cl	92,4-93,3
2- 3	Cl	H	H	H	H	3-CF ₃	82-87
2- 4	Cl	H	H	H	H	4-Cl	112,5-113,2
2- 5	Cl	H	H	Me	H	4-Cl	Pasta
2- 6	Cl	H	H	Me	Me	4-Cl	Pasta
2- 7	Cl	H	H	Et	H	4-Cl	Pasta
2- 8	Cl	H	H	Me	Et	4-Cl	Pasta
2- 9	Cl	H	H	Et	Et	4-Cl	Pasta
2- 10	Cl	H	H	H	H	2,6-Cl ₂	126,3-127,4
2- 11	Cl	H	H	H	H	2,4-Me ₂	

2-	12	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-F	108,3-109,4
2-	13	Cl	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	99
2-	14	Cl	H	H	H	H	4-Ph(4-OCF ₃)	184-185
2-	15	Cl	H	H	H	H	2,5-Cl ₂	99,7-101
2-	16	Cl	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	98,1-99,2
2-	17	Cl	H	H	Me	H	2,4-Cl ₂	Pasta
2-	18	Cl	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	Pasta
2-	19	Cl	H	H	Pr	H	2,4-Cl ₂	142-144
2-	20	Cl	H	H	i-Pr	H	2,4-Cl ₂	93-99
2-	21	Cl	H	H	Bu	H	2,4-Cl ₂	90-91
2-	22	Cl	H	H	i-Bu	H	2,4-Cl ₂	Pasta
2-	23	Cl	H	H	Me	Me	2,4-Cl ₂	Pasta
2-	24	Cl	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	
2-	25	Cl	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	88-109
2-	26	Cl	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	53-63
2-	27	Cl	H	H	H	H	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃	123,4-124
2-	28	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
2-	29	Cl	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	
2-	30	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
2-	31	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	76-85
2-	32	Cl	H	H	F	H	2,4-Cl ₂	
2-	33	Cl	Me	H	F	H	2,4-Cl ₂	
2-	34	CF ₃	H	H	F	H	2,4-Cl ₂	
2-	35	CF ₃	Me	H	F	H	2,4-Cl ₂	
2-	36	Cl	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
2-	37	Cl	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	124
2-	38	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	Pasta
2-	39	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	137,8-139,3
2-	40	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	127-129
2-	41	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
2-	42	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
2-	43	Cl	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
2-	44	Cl	H	H	H	H	2,4,5-F ₃	
2-	45	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
2-	46	Cl	Me	H	H	H	2,4-F ₂	107,6-111,9
2-	47	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	
2-	48	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	156,8-158,3
2-	49	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ OCH ₃	

2-	50	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	
2-	51	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	137,8-139,3
2-	52	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	127-129,1
2-	53	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	118,4-119,7
2-	54	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
2-	55	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
2-	56	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
2-	57	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
2-	58	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	100,8-102,9
2-	59	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
2-	60	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
2-	61	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-F ₃	
2-	62	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	157,4-158,9
2-	63	Cl	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	104-109
2-	64	Cl	Me	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	138,4-138,5
2-	65	Cl	Me	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
2-	66	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5	
2-	67	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5	
2-	68	Cl	Me	Me	H	H	2,4-Cl ₂	
2-	69	Cl	Me	Me	H	H	3,4-Cl ₂	
2-	70	Cl	Me	Me	H	H	2,4-F ₂	
2-	71	Cl	Me	Me	H	H	3,4-F ₂	
2-	72	Cl	CH ₂ CH ₂		H	H	2,4-Cl ₂	
2-	73	Cl	CH ₂ CH ₂		H	H	2-Cl-4-CF ₃	
2-	74	Cl	CH ₂ CH ₂		H	H	2-F-4-CF ₃	
2-	75	Cl	Et	H	H	H	2,4-Cl ₂	
2-	76	Cl	H	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	116-117,6
2-	77	Cl	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	127-129
2-	78	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	131,8-132,8
2-	79	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	128,4-129,5
2-	80	Cl	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
2-	81	Cl	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
2-	82	Cl	H	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	104,5-105
2-	83	Cl	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	140,8-141
2-	84	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-F)	108,5-109,9
2-	85	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-F)	Pasta
2-	86	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-OMe)	Pasta
2-	87	Cl	Me	H	H	H	2-Br-4-Cl	135,0

2-	88	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	76,9-79,4
2-	89	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SOMe	71,9-113,6
2-	90	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me	117,8-119,7
2-	91	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-SMe	114,1-114,2
2-	92	Cl	H	H	H	H	2-Br-4-F	Pasta
2-	93	Cl	Me	H	H	H	2-Br-4-F	123,4-127,1

Tabela 3



Comp. N°.	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	propriedade
3- 1	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl	
3- 2	CF ₃	H	H	H	H	3-Cl	
3- 3	CF ₃	H	H	H	H	4-Cl	
3- 4	CF ₃	H	H	H	H	3-CF ₃	104-106
3- 5	CF ₃	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	110,2-111,2
3- 6	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-F	93,1-95,7
3- 7	CF ₃	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	110,7-112,1
3- 8	CF ₃	H	H	H	H	2,4-Me ₂	Pasta
3- 9	CF ₃	H	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	102-102,7
3- 10	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	118-119
3- 11	CF ₃	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	111-113
3- 12	CF ₃	H	H	H	H	2,4-F ₂	78-86
3- 13	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-Br	
3- 14	CF ₃	H	H	H	H	2-OCHF ₂ -4-Cl	
3- 15	CF ₃	H	H	H	H	2-OPr(i)-4-Cl	108-110
3- 16	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	106,3-108,0
3- 17	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-SCF ₃	
3- 18	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me	149,2-150,0
3- 19	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ CF ₃	
3- 20	CF ₃	H	H	H	H	2,5-Cl ₂	
3- 21	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-5-F	
3- 22	CF ₃	H	H	H	H	2-Me-5-Cl	
3- 23	CF ₃	H	H	H	H	2,5-Me ₂	105,7-106,6
3- 24	CF ₃	H	H	H	H	2,5-(CF ₃) ₂	
3- 25	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-5-CF ₃	131-133
3- 26	CF ₃	H	H	H	H	2-F-5-CF ₃	

3-	27	CF ₃	H	H	H	H	2,5-F ₂	
3-	28	CF ₃	H	H	H	H	2,3-Cl ₂	
3-	29	CF ₃	H	H	H	H	2,6-Cl ₂	
3-	30	CF ₃	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	114-115,2
3-	31	CF ₃	H	H	H	H	3,4-(OMe) ₂	
3-	32	CF ₃	H	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	
3-	33	CF ₃	H	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3-	34	CF ₃	H	H	H	H	3,5-Cl ₂	
3-	35	CF ₃	H	H	H	H	3,5-(CF ₃) ₂	
3-	36	CF ₃	H	H	H	H	3,5-F ₂	
3-	37	CF ₃	H	H	H	H	2,3,4-Cl ₃	150-154
3-	38	CF ₃	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3-	39	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ O-5	
3-	40	CF ₃	H	H	Me	H	2,4-Cl ₂	
3-	41	CF ₃	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	
3-	42	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	91-95
3-	43	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	163-164
3-43-R		CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	184
3-43-S		CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	183
3-	44	CF ₃	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Pasta
3-	45	CF ₃	Me	H	F	H	2,4-Cl ₂	
3-	46	CF ₃	Me	H	F	F	2,4-Cl ₂	
3-	47	CF ₃	H	H	H	H	4-Ph(4'-CF ₃)	
3-	48	CF ₃	H	H	H	H	4-Ph(4'-OCF ₃)	149-150
3-	49	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-Ph(4'-OCF ₃)	124-125
3-	50	CF ₃	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF ₃)	126-127
3-	51	CF ₃	H	H	H	H	2-F-4-Cl	132-133
3-	52	CF ₃	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	Pasta
3-	53	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	68,3-71,9
3-	54	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	128,8-129,9
3-	55	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3-	56	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3-	57	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3-	58	CF ₃	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	127,9-130,4
3-	59	CF ₃	H	H	H	H	2,4,5-F ₃	103-105,9
3-	60	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	177-178

3-	61	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-F ₂	109,2-110
3-	62	CF ₃	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	134-135,6
3-	63	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	159-162,4
3-	64	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	137,4-140,7
3-	65	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	177,2-178,3
3-	66	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3-	67	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	136,6-137,5
3-	68	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
3-	69	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
3-	70	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
3-	71	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
3-	72	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	127-128,7
3-	73	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3-	74	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
3-	75	CF ₃	Me	H	H	H	2,4,5-F ₃	125,1-127,9
3-	76	CF ₃	Me	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	195,6-196,5
3-	77	CF ₃	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	129
3-	78	CF ₃	Me	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	164,2
3-	79	CF ₃	Me	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3-	80	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5	
3-	81	CF ₃	Me	H	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5	
3-	82	CF ₃	Me	Me	H	H	2,4-Cl ₂	82-85
3-	83	CF ₃	Me	Me	H	H	3,4-Cl ₂	
3-	84	CF ₃	Me	Me	H	H	2,4-F ₂	
3-	85	CF ₃	Me	Me	H	H	3,4-F ₂	
3-	86	CF ₃	CH ₂ CH ₂		H	H	2,4-Cl ₂	125-128
3-	87	CF ₃	CH ₂ CH ₂		H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3-	88	CF ₃	CH ₂ CH ₂		H	H	2-F-4-CF ₃	
3-	89	CF ₃	Et	H	H	H	2,4-Cl ₂	169-175
3-	90	CF ₃	Et	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	
3-	91	CF ₃	H	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	110,3-112,9
3-	92	CF ₃	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	145-147
3-	93	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	132,2-132,7
3-	94	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	161,4-162,5
3-	95	CF ₃	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
3-	96	CF ₃	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	Pasta
3-	97	CF ₃	H	H	O		2,4-Cl ₂	

3-	98	CF ₃	Me	H	O	2,4-Cl ₂	
3-	99	CF ₃	Me	Me	O	2,4-Cl ₂	Pasta
3-	100	CF ₃	Me	Me	O	3,4-Cl ₂	133,9-135,2
3-	101	CF ₃	Me	Me	O	2,4,5-Cl ₃	
3-	102	CF ₃	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	123,3-125,5
3-	103	CF ₃	Me	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	175,9-176
3-	104	CF ₃	Me	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-F)	128,1-133,5
3-	105	CF ₃	Me	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-F)	113,7-117
3-	106	CF ₃	Me	H	H	2-Cl-4-OPh(3'-OMe)	100,7-103
3-	107	CF ₃	Me	H	H	2,4-Br ₂	
3-	108	CF ₃	Me	H	H	2-Br-4-F	
3-	109	CF ₃	Me	H	H	2-Br-4-CF ₃	
3-	110	CF ₃	Me	H	H	2-Br-4-OCF ₃	
3-	111	CF ₃	Me	H	H	2-Br-4-OCHF ₂	
3-	112	CF ₃	Me	H	H	2-Br-4-Cl-5-F	
3-	113	CF ₃	Me	H	H	2,4-Br ₂ -5-F	
3-	114	CF ₃	Me	H	H	2-Br-4-SCF ₃	
3-	115	CF ₃	Me	H	H	2-Br-4-SOCF ₃	
3-	116	CF ₃	Me	H	H	2-Br-4-SO ₂ CF ₃	
3-	117	CF ₃	Me	H	H	2-Cl-4-OCF ₃	
3-	118	CF ₃	Me	H	H	2-Br-4-Cl	154
3-	119	CF ₃	H	H	H	2-Cl-SOMe	101,4-103,4
3-	120	CF ₃	Me	H	H	2-Cl-4-SMe	142,4
3-	121	CF ₃	H	H	H	2-Br-4-F	112,0
3-	122	CF ₃	Me	H	H	2-Br-4-F	140,6-141,8
3-	123	CF ₃	Me	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ CF ₃	153,1-154,0
3-	124	CF ₃	Me	H	H	2-Cl-4-OCH(Me) ₂	122,5
3'-	1	Cl	H	H	H	2-Cl	
3'-	2	Cl	H	H	H	3-Cl	
3'-	3	Cl	H	H	H	4-Cl	
3'-	4	Cl	H	H	H	3-CF ₃	98-100
3'-	5	Cl	H	H	H	2,4-Cl ₂	99-100
3'-	6	Cl	H	H	H	2-Cl-4-F	77-79
3'-	7	Cl	H	H	H	2-Me-4-Cl	96,5-97,4
3'-	8	Cl	H	H	H	2,4-Me ₂	
3'-	9	Cl	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	
3'-	10	Cl	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	

3'-	11	Cl	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	107-108
3'-	12	Cl	H	H	H	H	2,4-F ₂	
3'-	13	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Br	
3'-	14	Cl	H	H	H	H	2-OCHF ₂ -4-Cl	
3'-	15	Cl	H	H	H	H	2-OPr(i)-4-Cl	70,4-71,3
3'-	16	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	
3'-	17	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SCF ₃	
3'-	18	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me	
3'-	19	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ CF ₃	
3'-	20	Cl	H	H	H	H	2,5-Cl ₂	
3'-	21	Cl	H	H	H	H	2-Cl-5-F	
3'-	22	Cl	H	H	H	H	2-Me-5-Cl	
3'-	23	Cl	H	H	H	H	2,5-Me ₂	
3'-	24	Cl	H	H	H	H	2,5-(CF ₃) ₂	
3'-	25	Cl	H	H	H	H	2-Cl-5-CF ₃	104-105
3'-	26	Cl	H	H	H	H	2-F-5-CF ₃	
3'-	27	Cl	H	H	H	H	2,5-F ₂	
3'-	28	Cl	H	H	H	H	2,3-Cl ₂	
3'-	29	Cl	H	H	H	H	2,6-Cl ₂	
3'-	30	Cl	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	100-102
3'-	31	Cl	H	H	H	H	3,4-(OMe) ₂	83-85
3'-	32	Cl	H	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	
3'-	33	Cl	H	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3'-	34	Cl	H	H	H	H	3,5-Cl ₂	
3'-	35	Cl	H	H	H	H	3,5-(CF ₃) ₂	
3'-	36	Cl	H	H	H	H	3,5-F ₂	
3'-	37	Cl	H	H	H	H	2,3,4-Cl ₃	
3'-	38	Cl	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3'-	39	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ O-5	85-87
3'-	40	Cl	H	H	Me	H	2,4-Cl ₂	
3'-	41	Cl	H	H	Me	Me	2,4-Cl ₂	Pasta
3'-	42	Cl	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	Pasta
3'-	43	Cl	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Pasta
3'-	44	Cl	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	168
3'-	45	Cl	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Pasta
3'-	46	Cl	Me	H	F	H	2,4-Cl ₂	
3'-	47	Cl	Me	H	F	F	2,4-Cl ₂	

3'-	48	Cl	H	H	H	H	4-Ph(4'-CF ₃)	
3'-	49	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Ph(4'-OCF ₃)	132-133
3'-	50	Cl	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF ₃)	136-137
3'-	51	Cl	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
3'-	52	Cl	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	Pasta
3'-	53	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	
3'-	54	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	
3'-	55	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3'-	56	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3'-	57	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3'-	58	Cl	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3'-	59	Cl	H	H	H	H	2,4,5-F ₃	
3'-	60	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3'-	61	Cl	Me	H	H	H	2,4-F ₂	149-150
3'-	62	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	143,2-145,8
3'-	63	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	
3'-	64	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	
3'-	65	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	183,7-184,6
3'-	66	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3'-	67	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	
3'-	68	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
3'-	69	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
3'-	70	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
3'-	71	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
3'-	72	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3'-	73	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3'-	74	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
3'-	75	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-F ₃	
3'-	76	Cl	Me	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3'-	77	Cl	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	
3'-	78	Cl	Me	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	
3'-	79	Cl	Me	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3'-	80	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5	
3'-	81	Cl	Me	H	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5	
3'-	82	Cl	Me	Me	H	H	2,4-Cl ₂	
3'-	83	Cl	Me	Me	H	H	3,4-Cl ₂	
3'-	84	Cl	Me	Me	H	H	2,4-F ₂	

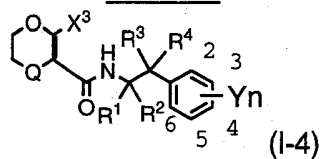
3'-	85	Cl	Me	Me	H	H	3,4-F ₂	
3'-	86	Cl	CH ₂ CH ₂		H	H	2,4-Cl ₂	
3'-	87	Cl	CH ₂ CH ₂		H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3'-	88	Cl	CH ₂ CH ₂		H	H	2-F-4-CF ₃	
3'-	89	Cl	Et	H	H	H	2,4-Cl ₂	
3'-	90	Cl	Et	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	
3'-	91	Cl	H	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
3'-	92	Cl	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
3'-	93	Cl	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	
3'-	94	Cl	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	
3'-	95	Cl	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
3'-	96	Cl	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
3"-	1	Me	H	H	H	H	2-Cl	
3"-	2	Me	H	H	H	H	3-Cl	
3"-	3	Me	H	H	H	H	4-Cl	
3"-	4	Me	H	H	H	H	3-CF ₃	
3"-	5	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	83-91
3"-	6	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-F	
3"-	7	Me	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	
3"-	8	Me	H	H	H	H	2,4-Me ₂	Pasta
3"-	9	Me	H	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	
3"-	10	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3"-	11	Me	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	
3"-	12	Me	H	H	H	H	2,4-F ₂	
3"-	13	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Br	
3"-	14	Me	H	H	H	H	2-OCHF ₂ -4-Cl	
3"-	15	Me	H	H	H	H	2-OPr(i)-4-Cl	
3"-	16	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SMe	
3"-	17	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SCF ₃	
3"-	18	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me	
3"-	19	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ CF ₃	
3"-	20	Me	H	H	H	H	2,5-Cl ₂	
3"-	21	Me	H	H	H	H	2-Cl-5-F	
3"-	22	Me	H	H	H	H	2-Me-5-Cl	
3"-	23	Me	H	H	H	H	2,5-Me ₂	
3"-	24	Me	H	H	H	H	2,5-(CF ₃) ₂	
3"-	25	Me	H	H	H	H	2-Cl-5-CF ₃	

3"-	26	Me	H	H	H	H	2-F-5-CF ₃	
3"-	27	Me	H	H	H	H	2,5-F ₂	
3"-	28	Me	H	H	H	H	2,3-Cl ₂	
3"-	29	Me	H	H	H	H	2,6-Cl ₂	
3"-	30	Me	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	85,4-86,1
3"-	31	Me	H	H	H	H	3,4-(OMe) ₂	
3"-	32	Me	H	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	
3"-	33	Me	H	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3"-	34	Me	H	H	H	H	3,5-Cl ₂	
3"-	35	Me	H	H	H	H	3,5-(CF ₃) ₂	
3"-	36	Me	H	H	H	H	3,5-F ₂	
3"-	37	Me	H	H	H	H	2,3,4-Cl ₃	
3"-	38	Me	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3"-	39	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OCH ₂ O-5	
3"-	40	Me	H	H	Me	Me	2,4-Cl ₂	Pasta
3"-	41	Me	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	
3"-	42	Me	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Pasta
3"-	43	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
3"-	44	Me	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	
3"-	45	Me	Me	H	F	H	2,4-Cl ₂	
3"-	46	Me	Me	H	F	F	2,4-Cl ₂	
3"-	47	Me	H	H	H	H	4-Ph(4'-CF ₃)	123-124
3"-	48	Me	H	H	H	H	4-Ph(4'-OCF ₃)	122-123
3"-	49	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Ph(4'-OCF ₃)	
3"-	50	Me	H	H	H	H	2-F-4-Ph(4'-OCF ₃)	85-86
3"-	51	Me	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
3"-	52	Me	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
3"-	53	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	
3"-	54	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Q1	
3"-	55	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3"-	56	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3"-	57	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3"-	58	Me	H	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3"-	59	Me	H	H	H	H	2,4,5-F ₃	
3"-	60	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3"-	61	Me	Me	H	H	H	2,4-F ₂	
3"-	62	Me	Me	H	H	H	2-F-4-Cl	

3"-	63	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OH	
3"-	64	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCHF ₂	
3"-	65	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q1	
3"-	66	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q2	
3"-	67	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q3	
3"-	68	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q4	
3"-	69	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q5	
3"-	70	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q6	
3"-	71	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-Q7	
3"-	72	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh	
3"-	73	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-CF ₃)	
3"-	74	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OPh(4'-Cl)	
3"-	75	Me	Me	H	H	H	2,4,5-F ₃	
3"-	76	Me	Me	H	H	H	2,4,5-Cl ₃	
3"-	77	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	
3"-	78	Me	Me	H	H	H	3-OCF ₂ O-4	
3"-	79	Me	Me	H	H	H	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
3"-	80	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4-OCF ₂ O-5	
3"-	81	Me	Me	H	H	H	2-F-4-OCF ₂ O-5	
3"-	82	Me	Me	Me	H	H	2,4-Cl ₂	
3"-	83	Me	Me	Me	H	H	3,4-Cl ₂	
3"-	84	Me	Me	Me	H	H	2,4-F ₂	
3"-	85	Me	Me	Me	H	H	3,4-F ₂	
3"-	86	Me	CH ₂ CH ₂		H	H	2,4-Cl ₂	
3"-	87	Me	CH ₂ CH ₂		H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3"-	88	Me	CH ₂ CH ₂		H	H	2-F-4-CF ₃	
3"-	89	Me	Et	H	H	H	2,4-Cl ₂	
3"-	90	Me	Et	H	H	H	2,4-(CF ₃) ₂	
3"-	91	Me	H	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
3"-	92	Me	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
3"-	93	Me	H	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	
3"-	94	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	
3"-	95	Me	H	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
3"-	96	Me	Me	H	H	H	2-F-4,5-Cl ₂	
3"-	1	Br	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	125,2-126,1
3"-	2	Br	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	176,7-178
3"-	3	Br	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	

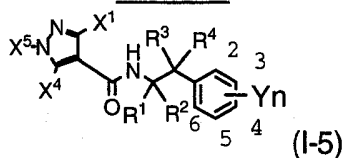
3 ^{'''} -	4	Br	Me	H	H	H	2,4,5-F ₃	
3 ^{'''} -	5	Br	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
3 ^{'''} -	1	I	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	160,9-161,8
3 ^{'''} -	2	I	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
3 ^{'''} -	3	I	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
3 ^{'''} -	4	I	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

Tabela 4



Comp. N°.	Q	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	propriedade
4- 1	S	CF ₃	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	139
4- 2	S	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	104
4- 3	S	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
4- 4	S	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
4- 5	S	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
4- 6	S	CF ₃	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
4- 7	S	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
4- 8	S	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

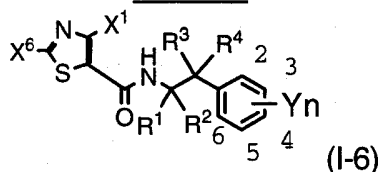
Tabela 5



Comp. N°.	X ¹	X ⁴	X ⁵	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	propriedade
5- 1	Me	H	Me	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	131-135
5- 2	Me	H	Me	H	H	H	H	3-CH=CH-CH=CH- 4	103-106
5- 3	Me	H	Me	H	H	H	H	3-CF ₃	Pasta
5- 4	Me	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	110-115
5- 5	Me	H	Me	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	Pasta
5- 6	CF ₃	H	Me	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	102-103
5- 7	CF ₃	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	83-120
5- 8	CF ₃	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	129
5- 9	Me	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	145-150
5- 10	CF ₃	H	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
5- 11	I	Me	Et	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	143-144
5- 12	I	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	140-141

5-	13	Br	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	129-130
5-	14	Cl	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	112
5-	15	I	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	120-154
5-	16	Br	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	145-147
5-	17	Cl	H	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	155-157
5-	18	CF ₃	H	Me	H	H	H	H	2-F-4-Cl	1,5062 (26°C)
5-	19	CF ₃	H	Me	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	77
5-	20	Me	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	169-170
5-	21	CF ₃	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	163
5-	22	Me	H	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	129-134
5-	23	CF ₃	H	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	133-134
5-	24	I	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	152-188
5-	25	Br	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	163-166
5-	26	Cl	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	141-142
5-	27	CHF ₂	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
5-	28	CHF ₂	H	Me	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
5-	29	CHF ₂	H	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
5-	30	CHF ₂	H	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

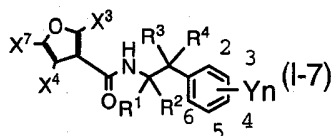
Tabela 6



Comp. N°.	X ¹	X ⁶	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	propriedade
6- 1	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	95-97
6- 2	CF ₃	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	136
6- 3	Me	Me	H	H	H	H	2,4-Me ₂	Pasta
6- 4	Me	Me	H	H	H	H	3,4-Cl ₂	Pasta
6- 5	Me	Me	H	H	H	H	2-Me-4-Cl	Pasta
6- 6	Me	Me	H	H	H	H	3-CH=CH-CH=CH-4	97-99
6- 7	Me	Me	H	H	H	H	2-i-Pr-4-Cl	Pasta
6- 8	Me	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
6- 9	Me	Me	H	H	H	H	3-CF ₃	89-90
6- 10	Me	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
6- 11	Me	Me	H	H	H	H	2-F-4-CF ₃	115-116
6- 12	Me	Me	H	H	Me	H	4-Cl	89
6- 13	Me	Me	H	H	Me	Me	4-Cl	81
6- 14	Me	Me	H	H	Et	H	4-Cl	Pasta

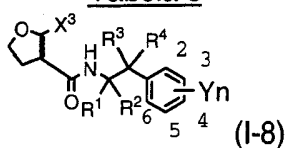
6-	15	Me	Me	H	H	Et	Me	4-Cl	Pasta
6-	16	Me	Me	H	H	Et	Et	4-Cl	Pasta
6-	17	Me	Me	H	H	Et	H	2,4-Cl ₂	Pasta
6-	18	Me	Me	H	H	n-Pr	H	2,4-Cl ₂	Pasta
6-	19	Me	Me	H	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Pasta
6-	20	Me	Me	H	H	i-Pr	H	2,4-Cl ₂	Pasta
6-	21	Me	Me	H	H	i-Bu	H	2,4-Cl ₂	Pasta
6-	22	Me	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	154
6-	23	Me	Me	Me	H	CH ₂ CH ₂		2,4-Cl ₂	Pasta
6-	24	Me	Cl	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	Pasta
6-	25	CF ₃	Me	H	H	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	114-115
6-	26	CF ₃	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	142-144
6-	27	Me	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	143
6-	28	CF ₃	Me	Me	H	H	H	3,4-Cl ₂	142-143
6-	29	CHF ₂	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
6-	30	CHF ₂	Me	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
6-	31	CHF ₂	Me	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
6-	32	CHF ₂	Me	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

Tabela 7



Comp. N°.	X ³	X ⁴	X ⁷	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	propriedade
7- 1	Me	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	106-107°C
7- 2	Me	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
7- 3	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	
7- 4	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
7- 5	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
7- 6	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
7- 7	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
7- 8	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

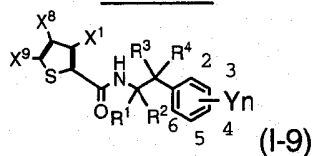
Tabela 8



Comp. N°.	X ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	propriedade
8- 1	Me	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	

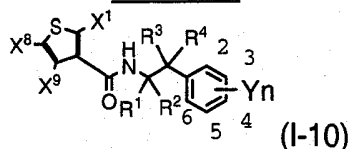
8-	2	Me	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
8-	3	CF ₃	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	
8-	4	CF ₃	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
8-	5	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
8-	6	CF ₃	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
8-	7	CF ₃	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
8-	8	CF ₃	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

Tabela 9



Comp. N°.	X ¹	X ⁸	X ⁹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	propriedade
9- 1	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	67-70°C
9- 2	I	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	81-87°C
9- 3	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
9- 4	Me	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
9- 5	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂	
9- 6	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,5-F ₂ -4-Cl	
9- 7	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2,4-Cl ₂ -5-F	
9- 8	CF ₃	H	H	Me	H	H	H	2-Cl-4,5-F ₂	

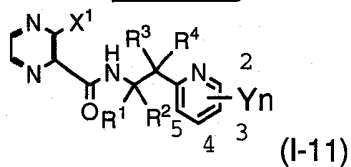
Tabela 10



Comp. N°.	X ¹	X ⁸	X ⁹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	propriedade
10- 1	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2-Cl-4-CF ₃	
10- 2	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2-F-4-Cl	
10- 3	CF ₃	H	H	H	H	H	H	2,4-Cl ₂	

5

Tabela 11



Comp. N°.	X ¹	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Yn	propriedade
11- 1	CF ₃	H	H	H	H	3-CF ₃ -5-Cl	130-131°C
11- 2	CF ₃	H	H	H	H	3-Cl-5-F	
11- 3	CF ₃	H	H	H	H	3,5-Cl ₂	

Tabela 12

Comp. N°.	¹ H-RMN [CDCl ₃ / TMS, valor de δ (ppm)]
1-6	7,65 (dd, 1H), 7,51 (m, 2H), 7,32 (dd, 1H), 7,30 (d, 2H), 7,14 (d, 2H), 5,58 (br, 1H), 3,92 (m, 1H), 3,38 (m, 1H), 2,80 (m, 1H), 1,79 (m, 1H), 1,60 (m, 1H), 0,83 (t, 3H)
1-7	7,65 (d, 1H), 7,51 (m, 2H), 7,25 - 7,36 (m, 5H), 5,40 (br, 1H), 3,77 (dd, 1H), 3,59 (dd, 1H), 1,80 (m, 1H), 1,66 (m, 1H), 1,37 (s, 3H), 0,74 (t, 3H)
1-8	7,65 (dd, 1H), 7,51 (m, 2H), 7,26 - 7,37 (m, 5H), 5,31 (br, 1H), 3,74 (d, 2H), 1,75 (m, 4H), 0,79 (t, 6H)
1-9	7,65 (dd, 1H), 7,51 (m, 2H), 7,32 (dd, 1H), 7,29 (d, 2H), 7,15 (d, 2H), 5,56 (br, 1H), 3,87 (m, 1H), 3,33 (m, 1H), 2,98 (m, 1H), 1,53 (m, 2H), 1,40 (m, 1H), 0,87 (t, 6H)
1-13	7,81 (dd, 1H), 7,27 - 7,34 (m, 5H), 7,22 (dd, 1H), 7,05 (dt, 1H), 5,43 (br, 1H), 3,76 (dd, 1H), 3,61 (dd, 1H), 1,83 (m, 1H), 1,68 (m, 1H), 1,41 (s, 3H), 0,75 (t, 3H)
1-14	7,81 (dd, 1H), 7,30 - 7,35 (m, 5H), 7,22 (dd, 1H), 7,06 (dt, 1H), 5,34 (br, 1H), 3,75 (d, 2H), 1,78 (m, 4H), 0,81 (t, 6H)
1-53	7,70 (d, 1H), 7,58 (t, 1H), 7,53 (t, 1H), 7,46 (d, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,30 (d, 1H), 5,86 (br, 1H), 3,71 (dd, 2H), 3,00 (t, 2H), 2,44 (s, 3H)
1-56	7,70 (d, 1H), 7,51 - 7,60 (m, 2H), 7,47 (d, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,19 (d, 1H), 7,01 (dd, 1H), 6,49 (t, 1H), 5,84 (br, 1H), 3,72 (q, 2H), 3,07 (t, 2H)
1-59	7,69 (d, 1H), 7,47 - 7,60 (m, 3H), 7,36 (t, 2H), 7,24 (d, 1H), 7,15 (t, 1H), 7,00 - 7,03 (m, 3H), 6,88 (dd, 1H), 5,85 (br, 1H), 3,73 (q, 2H), 3,05 (t, 2H)
2-5	8,41 (dd, 1H), 8,00 (dd, 1H), 7,31 (m, 3H), 7,20 (d, 1H), 6,39 (br, 1H), 3,79 (m, 1H), 3,50 (m, 1H), 3,11 (m, 1H), 1,35 (d, 3H)
2-6	8,41 (dd, 1H), 8,01 (dd, 1H), 7,27 - 7,36 (m, 5H), 6,23 (br, 1H), 3,69 (d, 2H), 1,43 (s, 6H)
2-7	8,40 (dd, 1H), 7,99 (dd, 1H), 7,26 - 7,33 (m, 3H), 7,17 (d, 1H), 6,32 (br, 1H), 3,91 (m, 1H), 3,45 (m, 1H), 2,83 (m, 1H), 1,80 (m, 1H), 1,62 (m, 1H), 0,85 (t, 3H)
2-8	8,41 (dd, 1H), 8,03 (dd, 1H), 7,27 - 7,34 (m, 4H), 6,18 (br, 1H), 3,79 (dd, 2H), 3,62 (dd, 2H), 1,85 (m, 1H), 1,68 (m, 1H), 1,41 (s, 3H), 0,75 (t, 3H)
2-9	8,41 (dd, 1H), 8,05 (dd, 1H), 7,29 - 7,35 (m, 4H), 6,13 (br, 1H), 3,77 (d, 2H), 1,79 (m, 4H), 0,80 (t, 6H)
2-17	8,42 (dd, 1H), 8,00 (dd, 1H), 7,39 (dd, 1H), 7,31 (dd, 1H), 7,27 (m, 2H), 6,43 (br, 1H), 3,77 (m, 1H), 3,65 (m, 2H), 1,34 (d, 3H)
2-18	8,41 (dd, 1H), 7,99 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,30 (dd, 1H), 7,25 (m, 2H), 6,36 (br, 1H), 3,86 (m, 1H), 3,60 (m, 1H), 3,51 (m, 1H), 3,84 (m, 1H), 1,67 (m, 1H), 0,88 (t, 3H)
2-22	8,42 (dd, 1H), 8,00 (dd, 1H), 7,39 (dd, 1H), 7,31 (dd, 1H), 7,27 (m, 2H), 6,36 (br, 1H), 3,83 (m, 1H), 3,68 (m, 1H), 3,51 (m, 1H), 1,64 (m, 1H), 1,57 (m, 1H), 1,44 (m, 1H), 0,90 (dd, 6H)
2-23	8,36 (dd, 1H), 7,98 (dd, 1H), 7,37 (m, 2H), 7,28 (dd, 2H), 7,22 (dd, 2H), 6,26 (br, 1H), 4,06 (d, 2H), 1,57 (s, 6H)
2-38	8,46 (dd, 1H), 8,08 (dd, 1H), 7,34 (dd, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,02 (dd, 1H), 6,55 (br, 1H), 6,49 (t, 1H), 3,77 (q, 2H), 3,10 (t, 2H)
2-85	8,45 (dd, 1H), 8,00 (dd, 1H), 7,33 (dd, 1H), 7,30 (t, 1H), 7,29 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 6,90 (dd, 1H), 6,83 (m, 1H), 6,78 (dd, 1H), 6,69 - 6,72 (m, 1H), 6,36 (d, 1H), 4,50 - 4,61 (m, 1H), 3,07 (dd, 1H), 2,99 (dd, 1H), 1,35 (d, 3H)

2-86	8,44 (dd, 1H), 7,99 (dd, 1H), 7,32 (dd, 1H), 7,24 (t, 2H), 7,03 (d, 1H), 6,88 (dd, 1H), 6,75 (d, 1H), 6,58 (d, 1H), 6,57 (s, 1H), 6,35 (d, 1H), 4,48 - 4,59 (m, 1H), 3,79 (s, 3H), 3,06 (dd, 1H), 2,97 (dd, 1H), 1,34 (d, 3H)
2-92	8,46 (dd, 1H), 8,09 (dd, 1H), 7,27 - 7,36 (m, 3H), 7,00 (ddd, 1H), 6,56 (br, 1H), 3,76 (q, 2H), 3,10 (t, 2H)
3-8	8,8 (d,1H), 8,7 (d,1H), 7,45 (br,1h), 6,9 - 7,1 (m,3H), 3,7 (q,2H), 2,9 (t,2H), 2,33 (s,3H), 2,30 (s,3H)
3-44	8,80 (d, 1H), 8,72 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 7,20 (dd, 1H), 4,10 (m, 1H), 1,28 (m, 1H), 1,24 (d, 3H), 1,02 (m, 1H), 0,90 (m, 1H)
3-52	8,82 (d, 1H), 8,71 (d, 1H), 7,50 (br, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,30 (d, 1H), 3,75 (dd, 2H), 3,02 (t, 2H), 2,44 (s, 3H)
3'-41	8,49 (d, 1H), 8,39 (d, 1H), 7,42 (d, 1H), 7,34 (d, 1H), 7,24 (br, 1H), 7,21 (dd, 1H), 4,02 (d, 2H), 1,54 (s, 6H)
3'-42	8,50 (d, 1H), 8,42 (d, 1H), 7,47 (br, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,22 - 7,28 (m, 2H), 3,80 (m, 1H), 3,58 (m, 1H), 3,49 (m, 1H), 1,83 (m, 1H), 1,68 (m, 1H), 0,87 (t, 3H)
3'-43	8,52 (d, 1H), 8,45 (d, 1H), 7,61 (br, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,28 (d, 1H), 7,16 (dd, 1H), 3,65 (d, 2H), 1,11 (dd, 2H), 0,91 (dd, 2H)
3'-45	8,53 (d, 1H), 8,47 (d, 1H), 7,56 (br, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 7,19 (dd, 1H), 4,11 (m, 1H), 1,28 (m, 1H), 1,23 (d, 3H), 0,92 (m, 1H), 0,87 (m, 1H)
3'-52	8,54 (d, 1H), 8,46 (d, 1H), 7,73 (br, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,30 (d, 1H), 3,71 (dd, 2H), 3,01 (t, 2H), 2,45 (s, 3H)
3"-8	8,6 (d, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,0 (br, 1H), 7,1 (d, 1H), 7,0 (d, 1H), 6,97 (dd, 1H), 3,6 (q, 2H), 3,0 (s,3H), 2,9 (t, 2H), 2,34 (s, 3H)
3"-40	8,55 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,70 (br, 1H), 7,42 (d, 1H), 7,34 (d, 1H), 7,20 (dd, 1H), 3,99 (d, 2H), 2,96 (s, 3H), 1,54 (s, 6H)
3"-42	8,58 (d, 1H), 8,33 (d, 1H), 7,97 (br, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,28 (d, 1H), 7,16 (dd, 1H), 3,63 (d, 2H), 2,94 (s, 3H), 1,09 (dd, 2H), 0,89 (dd, 2H)
5-3	7,62 (s, 1H), 7,4 - 7,5 (m, 4H), 5,55 (br, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,7 (q, 2H), 2,98 (t, 2H), 2,35 (s, 3H)
5-5	7,57 (s, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,20 - 7,29 (m, 2H), 5,60 (br, 1H), 3,78 (s, 3H), 3,78 (m, 1H), 3,45 (m, 2H), 2,29 (s, 3H), 1,79 (m, 2H), 1,63 (m, 1H), 0,85 (t, 3H)
6-3	6,9 - 7,0 (m, 3H), 5,7 (br, 1H), 3,6 (q, 2H), 2,9 (t, 2H), 2,7 (s, 3H), 2,6 (s, 3H), 2,32 (s,3H), 2,30 (s,3H)
6-4	7,39 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 7,07 (dd,1H), 5,65 (br, 1H), 3,63 (q, 2H), 2,88 (t, 2H), 2,66 (s, 3H), 2,60 (s,3H)
6-5	7,18 (d, 1H), 7,13 (dd, 1H), 7,07 (d,1H), 5,96 (br, 1H), 3,59 (q, 2H), 2,89 (t, 2H), 2,67 (s, 3H), 2,60 (s,3H), 2,34 (s,3H)
6-7	7,06 (d, 1H), 6,88 (dd, 1H), 6,87 (d,1H), 5,8 (br, 1H), 4,55 (m,1H), 3,60 (q, 2H), 2,86 (t, 2H), 2,65 (s, 3H), 2,57 (s,3H), 1,59 (s,6H)
6-14	7,32 (d, 2H), 7,14 (d, 2H), 5,48 (br, 1H), 3,86 (m, 1H), 3,30 (m, 1H), 2,77 (m, 1H), 2,63 (s, 3H), 2,47 (s, 1H), 1,77 (m, 1H), 1,60 (m, 1H), 0,84 (t, 3H)
6-15	7,35 (d, 2H), 7,27 (d, 2H), 5,30 (br, 1H), 3,69 (dd, 1H), 3,49 (dd, 1H), 2,62 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 1,82 (m, 1H), 1,64 (m, 1H), 1,34 (s, 3H), 0,74 (t, 3H)
6-16	7,35 (d, 2H), 7,29 (d, 2H), 5,22 (br, 1H), 3,64 (d, 2H), 2,62 (s, 3H), 2,42 (s, 3H), 1,74 (q, 4H), 0,79 (t, 6H)
6-17	7,41 (d, 1H), 7,27 (dd, 1H), 7,21 (d, 1H), 5,54 (br, 1H), 3,77 (m, 1H), 3,47 (m, 2H), 2,64 (s, 3H), 2,50 (s, 3H), 1,79 (m, 1H), 1,65 (m, 1H), 0,86 (t, 3H)
6-18	7,40 (d, 1H), 7,27 (dd, 1H), 7,22 (d, 1H), 5,52 (br, 1H), 3,76 (m, 1H), 3,54 (m, 1H), 3,45 (m, 1H), 2,64 (s, 3H), 2,50 (s, 3H), 1,65 (m, 2H), 1,25 (m, 2H), 0,88 (t, 3H)

6-19	7,39 (d, 1H), 7,28 (d, 1H), 7,20 (dd, 1H), 5,76 (br, 1H), 3,57 (d, 2H), 2,65 (s, 3H), 2,56 (s, 3H), 1,07 (dd, 2H), 0,90 (dd, 2H),
6-20	7,42 (d, 1H), 7,27 (dd, 1H), 7,21 (d, 1H), 5,39 (br, 1H), 3,96 (m, 1H), 3,48 (m, 1H), 3,27 (m, 1H), 2,62 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 1,94 (m, 1H), 1,11 (d, 3H), 0,79 (d, 3H)
6-21	7,40 (d, 1H), 7,27 (dd, 1H), 7,22 (d, 1H), 5,53 (br, 1H), 3,74 (m, 1H), 3,62 (m, 1H), 3,40 (m, 1H), 2,64 (s, 3H), 2,51 (s, 3H), 1,61 (m, 1H), 1,51 (m, 1H), 1,41 (m, 1H), 0,88 (dd, 6H)
6-23	7,40 (d, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 5,69 (br, 1H), 4,00 (m, 1H), 2,67 (s, 3H), 2,61 (s, 3H), 1,24 (m, 1H), 1,19 (d, 3H), 0,88 - 0,99 (m, 3H)
6-24	7,41 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 7,18 (d, 1H), 5,78 (br, 1H), 3,66 (q, 2H), 3,04 (t, 2H), 2,56 (s, 3H)

O agente controlador de praga contendo derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida representado pela fórmula (I) da presente invenção ou um sal do mesmo como um ingrediente ativo é particularmente adequado para controle de doenças de plantas de arroz, árvores frutíferas, legumes e verduras, plantas de outras colheitas e flores e plantas ornamentais, bem como controle de pragas do solo tais como nematódeos e semelhantes.

As doenças-alvo do agente controlador de doença de planta da presente invenção são doenças causadas por fungos ou mofos, doenças causadas por bactérias, e doenças causadas por vírus e, por exemplo, o agente é adequado para controlar as doenças causadas pela família *Fungi Imperfecti* (por exemplo, as doenças causadas pelo gênero *Botrytis*, o gênero *Helminthosporium*, o gênero *Fusarium*, o gênero *Septoria*, o gênero *Cercospora*, o gênero *Pseudocercospora*, o gênero *Rhynchosporium*, o gênero *Pyricularia*, o gênero *Alternaria*, e etc.), as doenças causadas pela família *Basidiomycetes* (por exemplo, as doenças causadas pelo gênero *Hemileia*, o gênero *Rhizoctonia*, o gênero *Ustilago*, o gênero *Typhula*, o gênero *Puccinia*, e etc.), as doenças causadas pela família dos Ascomicetos (por exemplo, as doenças causadas pelo gênero *Venturia*, o gênero *Podosphaera*, o gênero *Leptosphaeria*, o gênero *Blumeria*, o gênero *Erysiphe*, o gênero *Microdochium*, o gênero *Sclerotinia*, o gênero *Gaeumannomyces*, o gênero *Monilinia*, o gênero *Uncinula*, e etc.), as doenças causadas por diversas famílias de fungos (por exemplo, as doenças causadas pelo gênero *Ascochyta*, o gênero *Phoma*, o gênero *Pythium*, o gênero *Corticium*, o gênero *Pyrenophora*, e etc.), as doenças causadas por bactérias, tais como as doenças causadas pelo gênero *Pseudomonas*, o gênero *Xanthomonas*, o gênero *Erwinia* e semelhantes, ou as doenças causadas por vírus (por exemplo, as doenças causadas pelo vírus do mosaico do

tabaco, e etc.), e semelhantes.

Doenças de plantas específicas incluem, por exemplo, ferrugem da planta do arroz (*Pyricularia oryzae*), praga da bainha da planta do arroz (*Rhizoctonia solani*), listra da planta do arroz (*Cochiobolus miyabeanus*), praga da muda da
 5 planta do arroz (*Rhizopus chinensis*, *Pythium graminicola*, *Fusarium graminicola*, *Fusarium roseum*, *Mucor sp.*, *Phoma sp.*, *Tricoderma sp.*), doença "bakanae" da planta do arroz (*Gibberella fujikuroi*), míldio pulverulento de plantas de trigo e cevada (*Blumeria graminis*), ou míldio pulverulento de planta de pepino (*Sphaerotheca fuliginea*), míldio pulverulento da planta da berinjela (*Erysiphe cichoracoarum*),
 10 etc. e míldios pulverulentos de diversas plantas hospedeiras, ocelo da plantas de trigo e de cevada (*Pseudocercospora herpotrichoides*), ferrugem da planta de trigo (*Urocystis tritici*), praga da neve de plantas de trigo e de cevada (*Microdochium nivalis*, *Pythium iwayamai*, *Typhla ishikariensis*, *Typhla incarnata*, *Sclerotinia borealis*), sarna de plantas de trigo e de cevada (*Fusarium graminearum*, *Fusarium*
 15 *avenaceum*, *Fusarium culmorum*, *Microdochium nivalis*), ferrugem de plantas de trigo e de cevada (*Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia graminis*), "take-all" de plantas de trigo e de cevada (*Gaeumannomyces graminis*), ferrugem da coroa da planta de aveia (*Puccinia coronata*), e ferrugem de diversas plantas, mofo cinza das plantas do pepino e do morango (*Botrytis cinerea*), podridão do caule
 20 das plantas do tomate e do repolho (*Sclerotinia sclerotiorum*), praga tardia de plantas de batata e de tomate (*Phytophthora infestans*) e praga tardias de diversas plantas, míldio penugento de várias plantas tais como míldio penugento da planta do pepino (*Pseudoperonospora cubensis*), míldio penugento da parreira (*Plasmopara viticola*) e semelhantes, sarna da macieira (*Venturia inaequalis*), mancha da
 25 folha da macieira (*Alternaria mali*), mancha preta da pereira japonesa (*Alternaria kikuchiana*), podridão da extremidade do caule de árvores de frutos cítricos (*Diaporthe citri*), sarna de árvores de frutos cítricos (*Elsinoe fawcetti*), mancha da folha marrom da planta de beterraba (*Cercospora beticola*), mancha da folha marrom da planta do amendoim (*Cercospora arachidicola*), mancha da folha da planta do
 30 amendoim (*Cercospora personata*), manchas de folhas pintadas da planta de trigo (*Septoria tritici*), mancha da gluma (*glume blotch*) da planta de trigo (*Leptosphaeria nodorum*), mancha adulterada da planta de cevada (*Pyrenophora teres*), listra da

folha da planta de cevada (*Pyrenophora graminea*), planta de cevada queimada (*Rhynchosporium secalis*), ferrugem frouxa da planta de trigo (*Ustilago nuda*), ferrugem fétida da planta de trigo (*Tilletia caries*), mancha marrom da turfa ou de gramínea de relva (*Rhizoctonia solani*), "dollar spot" da turfa ou de gramínea de relva (*Sclerotinia homoeocarpa*), as doenças causadas por bactérias tais como as doenças causadas pelo gênero *Pseudomonas* (por exemplo, "spot blotch" bacteriana da planta de pepino (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*), definhção bacteriana da planta do tomate (*Pseudomonas solanacearum*) e podridão bacteriana de grãos da planta do arroz (*Pseudomonas glumae*)), as doenças causadas pelo gênero *Xanthomonas* (por exemplo, podridão negra da planta do repolho (*Xanthomonas campestris*), praga bacteriana da folha da planta do arroz (*Xanthomonas oryzae*), e cancro de árvores de frutos cítricos (*Xanthomonas citri*)), as doenças causadas pelo gênero *Erwinia* (por exemplo, podridão friável bacteriana da planta do repolho (*Erwinia carotovora*)) e semelhantes, as doenças causadas por vírus tais como mosaico do tabaco (vírus do mosaico do tabaco) e semelhantes, e semelhantes.

Além disso, o agente é adequado para controlar nematódeos tais como nematódeo de lesão da raiz (*Pratylenchus coffeae*), nematódeo do cisto da batata (*Glabodera rostchiensis*), nematódeo do nó da raiz (*Meloidogyne* sp.), nematódeo do nó da raiz meridional (*Meloidogyne incognita*), nematódeo de cítricos (*Tylenchulus semipenetrans*), nematódeo micófago (*Aphelenchus avenae*), crisântemo foliar (*Aphelenchoides ritzemabosi*) e semelhantes.

As plantas, para as quais um agente controlador de praga da presente invenção pode ser usado, não são especificamente limitadas e incluem, por exemplo, plantas tais como cereais (por exemplo, arroz, cevada, trigo, centeio, aveia, milho, sorgo, e etc.); leguminosas (soja, feijão azuki, feijão de fava, feijão, amendoim, e etc.); árvores frutíferas e frutos (maçã, frutos cítricos, pera, uvas, pêsego, ameixa, cereja, noz, amêndoa, banana, morango, e etc.); legumes e verduras (repolho, tomate, espinafre, brócolis, alface, cebola, cebola galesa, pimentão verde, e etc.); tubérculos (cenoura, batata, batata-doce, rabanete, raiz de lótus, nabo, e etc.); colheita para processamento (algodão, linho, amora, "paperbush", colza, beterraba, lúpulo, cana-de-açúcar, beterraba sacarina, oliva, borracha, café,

tabaco, chá, e etc.); curcubitáceas (abóbora, pepino, melancia, melão, e etc.); gramíneas (gramas de pomar, sorgo, capim-rabo-de-gato, trevo, alfalfa, etc.); gramíneas (gramínea de relva coreana, agróstea, e etc.); colheita para especiarias (lavenda, alecrim, tomilho, salsa, pimenta, gengibre, e etc.); e flores (crisântemo, rosa, orquídea, e etc.), etc.

Recentemente, tecnologia IPM (manejo de pragas integrado) usando colheitas recombinantes genéticas (colheita resistente à herbicida, colheita resistente à pragas de insetos incorporada com gene produtor de toxina inseticida, colheita resistente à doença incorporada com gene produtor de indutor de resistência à doença, colheita de sabor aprimorado, colheita de aprimorada preservabilidade, colheita de aprimorada produção, e etc.), ferormônio sexuais de insetos (produtos químicos de interrupção de ferormônios para traças de culturas, lagarta dos cereais do repolho, e etc.), inseto inimigo natural e semelhantes têm feito progresso, e agente controlador de praga da presente invenção pode ser usado em combinação com ou por sistematização com semelhantes tecnologias.

Quando o composto da presente invenção é usado como um ingrediente ativo de agentes controladores de pragas, pode ser usado no estado em que se encontra sem adição de outros ingredientes, mas é preferencialmente usado depois de processamento em uma forma de formulação agroquímica conveniente para uso de acordo com o método de processamento de formulação agroquímica convencional.

Isto é, o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida representado pela fórmula (I) da presente invenção ou um sal dos mesmos e, opcionalmente, um adjuvante são combinados com um veículo inerte adequado em uma proporção apropriada e preparados em uma forma de formulação adequada tal como uma suspensão, concentrado emulsificável, concentrado solúvel, pó umedecível, grânulo dispersível em água, grânulos, pó, comprimidos, pacote ou semelhantes através de dissolução, dispersão, suspensão, misturação, impregnação, adsorção ou aderência.

O veículo inerte utilizável na presente invenção pode ser ou sólido ou líquido. Como um material utilizável como o veículo sólido, podem ser exemplificados farinha de soja, farinha de cereal, serragem, farinha de casca, serradura, talos

de tabaco pulverizados, cascas de nozes pulverizadas, farelo, celulose pulverizada, resíduo da extração de legumes e verduras, resinas tais como polímeros sintéticos pulverizados e semelhantes, argilas (por exemplo, caulim, bentonita, e argila ácida), talcos (por exemplo, talco e pirofilita), flocos ou pós de sílica (por exemplo, terra diatomácea, areia de sílica, mica e carbono branco [ácido silícico de alta dispersão, sintético, também denominado sílica hidratada finamente dividida ou ácido silícico hidratado, alguns dos produtos disponíveis comercialmente contêm silicato de cálcio como o principal componente]), carbono ativado, pós inorgânicos ou minerais tais como enxofre pulverizado, pedra-pomes, terra diatomácea calcinada, tijolo triturado, cinza viva, areia, carbonato de cálcio, fosfato de cálcio e semelhantes, veículos plásticos tais como polietileno, polipropileno, poli(cloreto de vinileno) e semelhantes, fertilizantes químicos (por exemplo, sulfato de amônio, fosfato de amônio, nitrato de amônio, uréia e cloreto de amônio), e composto. Estes veículos podem ser usados sozinhos ou como uma mistura de dois ou mais tipos dos mesmos.

Um material utilizável como o veículo líquido é selecionado entre materiais que têm solubilidade por si próprios ou os quais, mesmo sem a referida solubilidade, são capazes de dispersar um ingrediente ativo com o auxílio de um adjuvante. Os seguintes são exemplos típicos do veículo líquido e podem ser usados sozinhos ou como uma mistura de dois ou mais tipos dos mesmos: água, álcoois (por exemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol e etileno glicol), cetonas (por exemplo, acetona, metila etila cetona, metila isobutila cetona, diisobutila cetona e ciclohexanona), éteres (por exemplo, éter etílico, dioxano, Cellosolve, éter dipropílico e tetraidrofurano), hidrocarbonetos alifáticos (por exemplo, queroseno e óleos minerais), hidrocarbonetos aromáticos (por exemplo, benzeno, tolueno, xileno, nafta solvente e alquilnaftalenos), hidrocarbonetos halogenados (por exemplo, dicloroetano, clorofórmio, tetracloreto de carbono e clorobenzeno), ésteres (por exemplo, acetato de etila, ftalato de diisopropila, ftalato de dibutila e ftalato de dioctil), amidas (por exemplo, dimetilaformamida, dietilaformamida e dimetilacetamida), nitrilas (por exemplo, acetonitrila), e sulfóxido de dimetila.

Os seguintes são exemplos típicos do adjuvante, os quais são usados dependendo dos fins e usados sozinhos ou em combinação de dois ou mais

tipos, ou em alguns casos, não precisam ser usados de modo algum.

Para emulsificar, dispersar, dissolver e/ou umedecer um composto como ingrediente ativo, usa-se um tensoativo. Como o tensoativo, podem ser exemplificados éteres de alquila de polioxietilaeno, éteres de alquilarila de polioxietilaeno, ésteres de ácidos graxos superiores de polioxietilaeno, resinatos de polioxietilaeno, monolaurato de sorbitano de polioxietilaeno, monooleato de sorbitano de polioxietilaeno, alquilarilsulfonatos, produtos da condensação de ácido sulfônico de naftaleno, sulfonatos de lignina e ésteres de sulfato de álcoois superiores.

Além disso, para estabilizar a dispersão de um composto como ingrediente ativo, torná-lo aderente e/ou ligá-lo, os adjuvantes exemplificados abaixo também podem ser usados, isto é, também podem ser usados adjuvantes tais como caseína, gelatina, amido, metila celulose, carboximetila celulose, goma arábica, poli(vinil álcoois, terebintina, óleo de farelo, bentonita e sulfonatos de lignina.

Para melhorar a escoabilidade de um produto sólido, os seguintes adjuvantes também podem ser usados, isto é, podem ser usados adjuvantes tais como ceras, estearatos, fosfatos de alquila, e etc.

Adjuvantes tais como produtos da condensação de ácido naftalenosulfônico e policondensados de fosfatos podem ser usados como um peptizador para produtos dispersíveis

Adjuvantes tais como óleos de silicone também podem ser usados como um agente desespumante.

Adjuvantes tais como 1,2-benzisotiazolina-3-ona, p-cloro-m-xilenol, p-hidroxibenzoato de butila também podem ser adicionados como um conservante.

Além disso, caso necessário, agentes de dispersão funcional, reforçadores ativos tais como inibidor de decomposição metabólica como butóxido de piperonila, agentes anticongelamento tais como propilaeno glicol, antioxidantes tais como BHT, absorvedores ultravioleta, e os outros aditivos também podem ser adicionados.

O conteúdo do composto como ingrediente ativo pode ser variado conforme necessário, e o composto como ingrediente ativo pode ser usado em uma proporção adequadamente escolhida dentro da faixa de 0,01 a 90 partes em peso por 100 partes dos agentes controladores de pragas. Por exemplo, em con-

centrado emulsificável, pós umedecíveis, pós ou grânulos, o conteúdo adequado do composto como ingrediente ativo é a partir de 0,01 até 50 % em peso.

De modo a controlar uma variedade de pragas, o agente controlador de praga da presente invenção pode ser aplicado no estado em que se encontra ou depois de ser adequadamente diluído com ou suspenso em água ou semelhantes. A dosagem de aplicação do agente controlador de praga da presente invenção é variada dependendo de vários fatores tais como a finalidade, pragas a serem controladas, um estado de crescimento de uma planta, tendência de aparecimento de pragas, clima, condições ambientais, uma forma de formulação, um método de aplicação, um sítio de aplicação e momento da aplicação. Pode ser escolhida adequadamente dentro da faixa de 0,001 g a 10 kg, preferencialmente de 0,01 g a 1 kg, (em termos do composto como ingrediente ativo) por 10 ares dependendo dos fins.

De modo a controlar uma variedade de pragas, o agente controlador de praga a ser usado para um método da presente invenção pode ser aplicado nas sementes de plantas alvo nas quais se espera que apareçam as pragas ou no veículo de cultivo para semeadura das sementes e semelhantes, no estado em que se encontra ou depois de ser adequadamente diluído com ou suspenso em água ou semelhantes, em uma quantidade eficaz para controle das pragas, através dos métodos convencionais tais como aplicação métodos tais como aplicação na caixa da sementeira de arroz, adubo de sementes e semelhantes, métodos de aplicação tais como método de desinfecção de sementes, aplicação em escavação para plantio, aplicação no pé da planta, aplicação em leira para plantio, incorporação no solo e semelhantes. Para doenças de plantas desenvolvidas em colheitas tais como árvores frutíferas, cereais, verduras e legumes e semelhantes, o agente pode ser aplicado por tratamentos das sementes tais como por adubo ou imersão e semelhantes, tratamento de imersão da raiz da sementeira, injeção do solo de veículos da sementeira tais como leira para plantio por ocasião da semeadura e semelhantes, recipiente de cultivo para sementeira, escavação para plantio, pé da planta e semelhantes, irrigação depois de adubo superficial, tratamento de incorporação e semelhantes, para permitir a absorção do agente pelas plantas. O agente controlador de praga pode ser usado para tratar um meio de cultura em

água para cultura hidropônica.

Como métodos para tratamento de sementes, podem ser mencionados métodos convencionais tais como um método compreendendo penetração do agente por imersão das no agente líquido obtido diluindo ou não diluindo uma formulação líquida ou diluindo uma formulação sólida, um método compreendendo aderir uma formulação sólida ou formulação líquida à superfície das sementes misturando a formulação com sementes, adubo e semelhantes, um método compreendendo misturar a formulação com veículos altamente adesivos tais como resina, polímero e semelhantes e formar um revestimento de camada única ou multicamada sobre as sementes, um método compreendendo aplicação próxima das sementes simultaneamente com plantio e semelhantes.

A "semente" a ser submetida ao tratamento de semente significa, em um sentido criterioso, o mesmo que o "corpo da planta para propagação" na presente invenção, o qual inclui o que é denominado sementes, bem como corpo da planta para propagação vegetativa tal como bulbo, tubérculo, batata de semente, bulbo escamoso, para propagação por corte, e semelhantes.

O "solo" e "veículo de cultivo" ao praticar o método da presente invenção significam suportes para cultivo de plantas, e o material não é particularmente limitado. O material pode ser qualquer um na medida que as plantas possam crescer no mesmo e inclui, por exemplo, várias terras, esteira de sementeira, água e semelhantes. Além disso, também podem ser usados areia, vermiculita, algodão, papel, terra diatomácea, ágar, substância gelificada, substância polimérica, lã mineral, lã de vidro, aparas de madeira, casca de árvore, pedra-pomes e semelhantes.

Para aplicação no solo, por exemplo, um método compreendendo aplicação de uma formulação líquida ou sólida na vizinhança do corpo da planta, sementeira para cultivar muda e semelhantes com ou sem diluição em água, um método compreendendo aplicação na vizinhança do corpo da planta ou sementeira com grânulos, um método compreendendo aplicação com pó umedecível, grânulo dispersível em água, grânulo e semelhantes antes da sementeira ou da transplantação para permitir que os mesmos sejam incorporados em todo o solo, um método compreendendo aplicação em escavação para plantio, leira para plan-

tio e semelhantes com pó, pó umedecível, grânulo dispersível em água, grânulo e semelhantes antes da semeadura ou do plantio e semelhantes podem ser mencionados.

5 No caso da caixa de sementeira de arroz, a forma de dosagem pode variar dependendo do momento, por exemplo, aplicação na semeadura, aplicação durante o brotamento, aplicação durante a transplantação e semelhantes. No entanto, podem ser empregadas as formas de dosagens de pó, grânulo dispersível em água, grânulo e semelhantes.

10 A aplicação também é possível por incorporação dentro dos sulcos do solo, em que os sulcos do solo podem ser misturados com um pó, grânulo dispersível em água, grânulo e semelhantes e, por exemplo, incorporação no leito do solo, incorporação no solo de cobertura, incorporação dentro dos sulcos do solo e semelhantes podem ser empregadas.

15 Alternativamente, um sulco do solo e várias formulações podem ser aplicadas em camadas alternadas. O momento para aplicação na semeadura pode ser qualquer um de antes da semeadura, simultaneamente com a semeadura e depois da semeadura. Além disso, está disponível aplicação depois de cobrir o solo.

20 Para colheitas em terreno elevado tais como trigo e semelhantes, tratamento das sementes, um veículo de cultivo a ser colocado próximo do corpo da planta e semelhantes durante o período a partir da semeadura até o plantio da muda é preferencial. Para plantas a serem diretamente semeadas no campo, um tratamento direto das sementes, um tratamento de um veículo de cultivo a ser colocado próximo da planta sob cultivo e semelhantes são preferenciais. Uma aplicação com grânulos, um tratamento de injeção do solo com um agente líquido com ou sem diluição com água e semelhantes são possíveis.

25 Para um tratamento na semeadura ou durante o plantio da muda de uma planta cultivada a ser transplantada, um tratamento direto das sementes, um tratamento de injeção do solo da sementeira para plantio da muda com um agente líquido ou um tratamento de dispersão do mesmo com grânulos podem ser aplicados. Além disso, uma escavação para plantio pode ser tratada com grânulos ou
30 um veículo de cultivo a ser colocado próximo do sítio de transplantação pode ser

misturado com os grânulos durante o plantio fixo.

O agente controlador de praga da presente invenção pode ser usado em mistura com outros fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, pesticidas bióticos ou semelhantes de modo a expandir tanto o espectro de espécies de pragas controláveis quanto o período de tempo quando são possíveis aplicações eficazes ou para reduzir a dosagem. Além disso, o inseticida agrohortícola da presente invenção pode ser usado em mistura com herbicidas, reguladores do crescimento vegetal, fertilizantes ou semelhantes, dependendo das situações de aplicação.

Como os outros fungicidas usados para a finalidade acima, podem ser exemplificados fungicidas tais como Enxofre, Cal de enxofre, Sulfato de cobre básico, Iprobenfos, Edifenfos, Tolclofos-metila, Tiram, Policarbamato, Zineb, Maneb, Mancozeb, Propineb, Tiofanato, Tiofanato de metila, Benomila, Acetato de Iminoctadina, Albecilato de Iminocutadina, Mepronil, Flutolanil, Pencicuron, Fura-metpila, Tifluzamida, Metalaxila, Oxadixila, Carpropamid, Diclofluanid, Flussulfamida, Clorotalonil, Kresoxim-metila, Fenoxanil, Himexazol, Etridiazol, Fluoroimida, Procimidone, Vinclozolin, Iprodione, Triadimefon, Bitertanol, Triflumizol, Ipconazol, Fluconazol, Propiconazol, Difenconazol, Miclobutanil, Tetraconazol, Hexaconazol, Tebuconazol, Tiadinil, Imibenconazol, Procloraz, Pefurazoato, Ciproconazol, Isoprotiolano, Fenarimol, Pirimetanil, Mepanipirim, Pirifenox, Fluazinam, Triforine, Diclomezine, Azoxistrobin, Tiadiazin, Captan, Probenazol, Acibenzolar-S-metila, Fta-lida, Triciclazol, Piroquilon, QUinometionat, Ácido oxolínico, Ditianon, Casugamicina, Validamicina, Polioxina, Blastidina, Estreptomicina, e etc.

Como os inseticidas, acaricidas e nematocidas, os quais são usados para o mesmo propósito acima, podem ser exemplificados inseticidas, acaricidas e nematocidas, tais como Eton, Triclorfon, Metamidofos, Acefato, Diclorvos, Mevinfos, Monocrotofos, Malation, Dimetoato, Formotion, Mecarbam, Vamidotion, Tio-meton, Dissulfoton, Oxideprofos, Naled, Metilaparaation, Fenitroton, Cianofos, Propafos, Fention, Protiofos, Profenofos, Isofenfos, Temefos, Fentoato, Dimetilavinfos, Clorfenvinfos, Tetraclorvinfos, Foxim, Isoxation, Piraclofos, Metidation, Clorpirifos, Clorpirifos-metila, Piridafention, Diazinon, Pirimifosmetila, Fosalone, Fosmet, Dioxabenzofos, Quinalfos, Terbufos, Etoprofos, Cadusafos, Mesulfenfos, DPS (NK-

- 0795), Fosfocarb, Fenamifos, Isoamidofos, Fostiazato, Isazofos, Etoprofos, Fention, Fostietano, Diclofention, Tionazin, Sulprofos, Fensulfotion, Diamidafos, Piretrin, Aletrin, Praletrin, Resmetrin, Permetrin, Teflutrin, Bifentrin, Fenpropatrin, Cipermetrin, α -Cipermetrin, Cialotrin, λ -Cialotrin, Deltametrin, Acrinatrín, Fenvalerato, Esfenvalerato, Cicloprotrin, Etofenprox, Halfenprox, Silafluofen, Flucitrinato, Fluvalinato, Metomila, Oxamila, Tiodicarb, Aldicarb, Alanicarb, Cartap, Metolcarb, Xililcarb, Propoxur, Fenoxicarb, Fenobucarb, Etiofencarb, Fenotiocarb, Bifenazato, BPMC (2-butíla secundário-fenila-N-metilacarbamato), Carbaril, Pirimicarb, Carbofuran, Carbossulfan, Furatiocarb, Benfuracarb, Aldoxicarb, Diafentiuron, Diflubenzuron, Teflubenzuron, Hexaflumuron, Novaluron, Lufenuron, Flufenoxuron, Clorfluazuron, Óxido de fenbutatin, Hidróxido de triciclohexilatin, Oleato de sódio, Oleato de potássio, Metoprene, Hidroprene, Binapacril, Amitraz, Dicofol, Kersen, Clorobenzilato, Fenisobromolato, Tetradifon, Bensultap, Benzoximato, Tebufenozida, Metoxifenozida, Piridalila, Metaflumizona, Flubendiamida, Cromafenozida, Propargite, Acequinosil, Endossulfan, Diofenolan, Clorfenapil, Fenpiroximato, Tolfenpirad, Fipronil, Tebufenpirad, Triazamato, Etoxazol, Hexitiazox, Sulfato de nicotina, Nitenpiram, Acetamiprid, Tiaclopid, Imidaclopid, Tiametoxam, Clotianidin, Dinotefuran, Fluazinam, Piriproxifen, Hidrametilanon, Pirimidifen, Piridaben, Ciromazine, TPIC (isocianurato de tripropila), Pimetrozin, Clofentezin, Buprofedín, Tiociclám, Fenazaquin, Quinometionato, Indoxacarb, Complexos de Polinactin, Milbemectin, Abamectin, Benzoato de Enamectin, Spinosad, BT (*Bacillus thuringiensis*), Azadiractin, Rotonone, Hidroxipropila amido, Cloridreto de Levamisol, Metam-sódio, Tartarato de Morantel, Dazomet, Triclamida, Pasteuria, *Monacrosporium phymatophagum*, etc.

- Similarmente, como os herbicidas, podem ser exemplificados herbicidas tais como Glifosato, Sulfosato, Glifosinato, Bialafos, Butamifos, Esprocarb, Prossulcarb, Bentiocarb, Piributicarb, Asulam, Linuron, Dinron, Isouron, Metilabensulfuron, Ciclossulfamuron, Cinossulfuron, Etila pirazossulfurona, Azinsulfurona, Imazossulfurona, Tenilclor, Alaclor, Pretilaclor, Clomeprop, Etobenzanid, Mefenacet, Pendimetalin, Bifenox, Acifluorfen, Lactfen, Cialofop-butíla, Ioxinil, Bromobutida, Aloxidim, Setoxidim, Napropamida, Indanofan, Pirazolato, Benzofenap, Piraflufenetila, Imazapil, Sulfentrazone, Cafenstrol, Bentoxazon, Oxadiazon, Paraquat, Diquat, Piriminobac, Simazine, Atrazine, Dimetametrin, Triaziflam, Benflesato, Flutia-

cet-metila, Quizalofop-etila, Bentazon, Peróxido de cálcio, etc.

Exemplos

5 A presente invenção é especificamente explicada no seguinte por referência aos Exemplos, os quais não devem ser considerados como limitantes na medida que não se afastem do âmbito da invenção.

Exemplo 1. Produção de N-[2-(2,4-dicloro-fenila)-1-metilaetila]-2-trifluórmethylbenzamida (composto N°.1-32)

1-1)

10 Uma mistura de 2,4-diclorobenzaldeído (1,45 g, 8,3 mmols), acetato de amônio (0,64 g, 8,3 mmols) e nitroetano (6 g, 80 mmols) foi aquecida sob refluxo por 6 horas. A mistura foi deixada para esfriar até a temperatura ambiente e acetato de etila foi adicionado. A mistura foi lavada com água e salmoura saturada, secada sobre sulfato de magnésio anídrico, e concentrada. Recristalização a partir de etanol deu 2,4-dicloro-1-(2-nitro-1-propenil)benzeno (cristais de agulhas amarelos, rendimento; 1,0 g, 52%).

1-2)

20 A uma suspensão de hidreto de alumínio de lítio (0,33 g, 8,9 mmols) em tetraidrofurano (20 ml) foi adicionada gota a gota uma solução de 2,4-dicloro-1-(2-nitro-1-propenil)benzeno (1,0 g, 4,3 mmols) em tetraidrofurano (5 ml) em temperatura ambiente. O refluxo iniciou lentamente e a mistura foi aquecida sob refluxo por 1 hora depois disso. A mistura foi deixada para esfriar até a temperatura ambiente e água (2 ml) foi adicionada sob esfriamento em um banho de gelo. Uma solução aquosa a 1 N de hidróxido de sódio (5 ml) foi adicionada, e o material insolúvel foi removido por filtração através de celite. Foi adicionada água ao filtrado, e a

25 mistura foi extraída com metil t-butil-éter. A camada orgânica foi lavada com salmoura saturada, secada sobre sulfato de magnésio anídrico, e concentrada para dar [2-(2,4-diclorofenil)-1-metilaetila]amina bruta (rendimento; 0,8 g, 91%). propriedade; ^1H -RMN [CDCl_3/TMS , valor de δ (ppm)] 7,38 (d, 1H), 7,18 (d, 1H), 7,17 (s, 1H), 3,24 (m, 1H), 2,80 (dd, 1H), 2,65 (dd, 1H), 1,23 (d, 3H)

30 1-3)

A uma solução de [2-(2,4-diclorofenil)-1-metilaetila]amina bruta (cerca de 0,8 g, 3,9 mmols) e trietilamina (0,6 g, 5,9 mmols) em tetraidrofurano (20 ml) foi

adicionado lentamente gota a gota cloreto de 2-trifluórmethylbenzoíla (0,8 g, 3,8 mmols) em temperatura ambiente. Depois de agitar em temperatura ambiente por 0,5 hora, foi adicionada água e a mistura foi extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi lavada com ácido clorídrico a 0,5 N, carbonato de hidrogênio de sódio aquoso saturado, e salmoura saturada, secada sobre sulfato de magnésio anídrico, e concentrada. O resíduo foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel e recristalizado a partir de um solvente misto de acetona / n-hexano para dar um composto desejado (sólido branco, rendimento; 0,4 g, 27%). propriedade; ponto de fusão 142°C

10 Exemplo 2. Produção de N-[2-(2,4-diclorofenil)-1-metilaetila]-2-trifluórmethylpirazina-3-carboxamida (composto N°. 3-43)

A uma solução de ácido 2-trifluórmethylpirazina-3-carboxílico (0,25 g, 1,3 mmol), [2-(2,4-diclorofenil)-1-metilaetila]amina (0,27 g, 1,3 mmol) e 4-dimetilaminopiridina (0,19 g, 1,6 mmol) em clorofórmio (10 ml) foi adicionado clorido de 1-etila-3-(3-dimetilaminopropila)carbodiimida (0,3 g, 1,6 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 12 horas. Depois de adicionar água e clorofórmio, a mistura foi particionada, e a camada orgânica foi lavada sucessivamente com água e salmoura saturada e secada sobre sulfato de sódio anídrico. A mistura foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel (hexano : acetato de etila = 2:1) para dar um composto desejado (rendimento; 0,31 g, 63%). propriedade; ponto de fusão 163-164°C

20 Exemplo 3. Produção de N-[1-[1-(2,4-diclorofenil)ciclopropila]etila]-2-cloropirazina-3-carboxamida (composto N°. 3'-45)

3-1)

25 A uma solução de 1-(2,4-diclorofenil)ciclopropano-carbonitrila (5,0 g, 23,6 mmols) em tetraidrofurano (20 ml) foi adicionado brometo de metilamagnésio (0,96 mol/l de solução de tetraidrofurano; 30 ml) em temperatura ambiente. Depois de aquecer sob refluxo por 1,5 hora, a mistura foi deixada para esfriar até a temperatura ambiente, e ácido clorídrico a 0,5 M foi adicionado sob esfriamento em um banho de gelo. A camada orgânica extraída com acetato de etila foi secada sobre sulfato de magnésio anídrico e concentrada para dar 1-[1-(2,4-diclorofenil)ciclopropila]etanona bruta (óleo marrom, rendimento; 3,4 g, 63%).

3-2)

Uma mistura de 1-[1-(2,4-diclorofenil)ciclopropila]etanona (3,4 g, 14,8 mmols), cloridreto de hidroxilamina (2,8 g), trietilamina (3,8 g) e etanol (30 ml) foi aquecida sob refluxo por 8 horas. A mistura foi deixada para esfriar até a temperatura ambiente, etanol foi evaporado e acetato de etila foi adicionado. Depois de lavar com água e salmoura saturada, a camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anídrico, e concentrada. O resíduo foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel para dar 1-[1-(2,4-diclorofenil)ciclopropila] etanonaoxima (sólido branco, rendimento; 3,4 g, 94%).

3-3)

Uma mistura de 1-[1-(2,4-diclorofenil)ciclopropila] etanonaoxima (2,6 g, 10,7 mmols), níquel de Raney (2,0 g) e etanol (30 ml) foi agitada sob pressurização com hidrogênio em temperatura ambiente por 30 horas. O níquel de Raney foi removido por filtração por celite, e o filtrado foi concentrado. Acetato de etila foi adicionado ao resíduo e a mistura foi lavada com água e salmoura saturada. A camada orgânica foi secada sobre sulfato de magnésio anídrico e concentrada para dar 1-[1-(2,4-diclorofenil)ciclopropila] etilamina bruta (óleo marrom). propriedade; $^1\text{H-RMN}$ [CDCl_3/TMS , valor de δ (ppm)] 7,37 (d, 1H), 7,29 (d, 1H), 7,18 (dd, 1H), 2,87 (q, 1H), 1,05 (d, 3H), 0,96 (br, 2H), 0,80 (d, 2H)

Isto foi dissolvido em metil t-butil éter (20 ml) e uma solução a 4 N de ácido clorídrico em acetato de etila foi adicionada gota a gota a isto. Um precipitado branco foi filtrado, lavado com metil t-butil éter e secado ao ar para dar cloridreto de 1-[1-(2,4-diclorofenil)ciclopropila]etilamina (sólido branco, rendimento; 2,0 g). propriedade; $^1\text{H-RMN}$ [CDCl_3/TMS , valor de δ (ppm)] 8,35 (br, 3H), 7,45 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,19 (dd, 1H), 3,36 (br, 1H), 1,37 (d, 3H), 1,25 – 1,39 (m, 2H), 1,03 (m, 1H), 0,96 (m, 1H)

3-4)

A uma solução de ácido 2-cloropirazina-3-carboxílico (0,15 g, 1,0 mmol), cloridrato de 1-[1-(2,4-diclorofenil)ciclopropila]etilamina (0,25 g, 0,94 mmol) e 4-dimetilaminopiridina (0,29 g, 2,4 mmols) em clorofórmio (10 ml) foi adicionado cloridreto de 1-etila-3-(3-dimetilaminopropila)carbodiimida (0,22 g, 1,2 mmol) e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 12 h. Depois de adicionar água e

clorofórmio, a mistura foi separada, e a camada orgânica foi lavada sucessivamente com água e salmoura saturada e secada sobre sulfato de sódio anídrico. A mistura foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo foi purificado por cromatografia de coluna de sílica-gel (hexano : acetato de etila = 3:1) para dar um composto desejado (rendimento; 0,24 g, 69%). propriedade; ^1H -RMN [CDCl_3/TMS , valor de δ (ppm)]: 8,53 (d, 1H), 8,47 (d, 1H), 7,55 (br, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,32 (d, 1H), 7,19 (dd, 1H), 4,11 (m, 1H), 1,28 (m, 1H), 1,23 (d, 3H), 1,01 (m, 1H), 0,90 (m, 2H)

Exemplo de formulação típica e exemplo experimental da presente invenção são descritos abaixo mas não devem ser considerados como limitantes do âmbito da invenção.

Conforme usado nos exemplos, os termos "parte" e "partes" significam partes em peso.

Exemplo de Formulação 1

	composto da presente invenção	10 partes
15	Xileno	70 partes
	N-metilpirrolidona	10 partes
	Mistura de éter nonilfenílico de polioxietileno e alquilbenzenossulfonato de cálcio	10 partes

Foi preparado um concentrado emulsificável misturando uniformemente os ingredientes acima para realizar dissolução.

Exemplo de Formulação 2

	composto da presente invenção	3 partes
	Pó de argila	82 partes
	Pó de terra diatomácea	15 partes

Foi preparado um pó misturando uniformemente e triturando os ingredientes acima.

Exemplo de Formulação 3

	composto da presente invenção	5 partes
	Pó misto de bentonita e argila	90 partes
30	Sulfonato de lignina de cálcio	5 partes

Foram preparados grânulos misturando uniformemente os ingredientes acima, e amassando a mistura resultante junto com uma quantidade adequada

de água, seguido por granulação e secagem.

Exemplo de Formulação 4

	composto da presente invenção	20 partes
	Mistura de caulim e ácido silícico	
5	5 sintético de alta dispersão	75 partes
	Mistura de éter nonilfenílico de polioxietileno e alquilbenzenossulfonato de cálcio	5 partes

Um pó umedecível foi preparado misturando uniformemente e triturando os ingredientes acima.

- 10 Os Exemplos Experimentais seguintes mostram a utilidade do composto da presente invenção como um agente controlador de praga, particularmente um agente controlador de doença de planta ou nematocida. Os compostos da presente invenção são indicados com os números dos compostos descritos na Tabela 1 à Tabela 11. Como compostos controle para comparação, os quatro
- 15 compostos seguintes foram submetidos a uma avaliação similar .

- composto de comparação A; 2,6-dicloro-N-[2-{3-(trifluórmethyl)fenil}etil]benzamida (composto N°. 12 descrito no JP-A-1-151546)
- composto de comparação B; N-{2-[3-cloro-5-(trifluórmethyl)piridin-2-il]etil}-2-trifluórmethylbenzamida (composto N°. A-20 descrito na WO 04/016088)
- 20 composto de comparação C; N-{2-[3-cloro-5-(trifluórmethyl)piridin-2-il]etil}-2-cloropiridina-3-carboxamida (composto N°. R-1 descrito na WO 04/074280)
- composto de comparação D; N-[3',4'-dicloro-(1,1-dimetil)fenacil]-3-metil-2-tiofenocarboxamida (composto N°. 1-20 descrito na WO 06/016708)

Exemplo Experimental 1:

- 25 Teste sobre a eficácia de controle contra sarna da macieira

- Uma muda de uma macieira (a variedade: Ohurin) cultivada em um pote foi submetida à aplicação foliar com uma emulsão diluída do concentrado emulsificável do composto da presente invenção preparado de acordo com o Exemplo de Formulação 1, cuja emulsão diluída foi produzida diluindo o concentra-
- 30 do com água até o volume especificamente determinado. No dia seguinte depois da aplicação, a muda foi inoculada pulverizando com uma suspensão de esporos do fungo causal de sarna de macieira (*Venturia inaequalis*) conforme obtido por

cultura sobre o meio de PSA e mantida a 20°C sob condições úmidas.

Quatorze dias depois da inoculação, o valor de proteção (%) foi determinado de acordo com a equação (1), e a eficácia de controle foi avaliada de acordo com os critérios de julgamento descritos abaixo.

$$\text{Valor de proteção (\%)} = \frac{\left(\frac{\text{Proporção da área de lesão na seção não tratada}}{\text{Proporção da área de lesão na seção tratada}} - \frac{\text{Proporção da área de lesão na seção não tratada}}{\text{Proporção da área de lesão na seção não tratada}} \right) \times 100}{1} \quad (1)$$

5 Critérios de julgamento:

0: menos de 9 % em valor de proteção

1: 10 a 19 % em valor de proteção

2: 20 a 29 % em valor de proteção

3: 30 a 39 % em valor de proteção

10 4: 40 a 49 % em valor de proteção

5: 50 a 59 % em valor de proteção

6: 60 a 69 % em valor de proteção

7: 70 a 79 % em valor de proteção

8: 80 a 89 % em valor de proteção

15 9: 90 a 99 % em valor de proteção

10: 100 % em valor de proteção

Em consequência do experimento mencionado acima, o composto da presente invenção apresentou um efeito controle superior na concentração de ingrediente ativo de 50 ppm e a quantidade de emulsão de aplicação de 50 mL e particularmente, os compostos Nos. 1-16, 1-17, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-28, 1-29, 1-30, 1-34, 1-37, 1-51, 1-65, 2-1, 2-53, 2-58, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-10, 3-11, 3-23, 3-30, 3-37, 3-43, 3-43-S, 3-50, 3-51, 3-53, 3-54, 3-58, 3-59, 3-60, 3-61, 3-62, 3-64, 3-65, 3-67, 3-75, 3-76, 3-77, 3-82, 3-86, 3-92, 3-94, 3-96, 3-100, 3-102, 3-103, 3-106, 3'-5, 3'-6, 3'-7, 3'-11, 3'-30, 3'-44, 3'-61, 3'-62, 3"-5, 3"-8, 4-1, 5-4, 5-5, 5-7, 5-15, 5-20, 5-21, 5-26, 6-1, 6-2, 6-3, 6-5, 6-9, 6-22, 6-24, 6-26, 9-1 e 9-2 apresentaram uma alta atividade de 10 nos critérios de julgamento. O composto de comparação A não apresentou efeito conforme evidenciado por 0 nos critérios de julga-

mento, mesmo por um tratamento em uma concentração 4 vezes tão elevada quanto 200 ppm.

Exemplo Experimental 2:

Teste sobre a eficácia de controle contra mofo cinza da planta de pepino

5 Uma planta de pepino com idade de uma folha (cultivar: *Suyou*) plantada como uma muda em um pote de 9 cm de diâmetro foi submetida à aplicação foliar com uma emulsão diluída do concentrado emulsificável do composto da presente invenção preparado de acordo com o Exemplo de Formulação 1, cuja emulsão diluída foi produzida diluindo o concentrado com água até o volume especificamente determinado.

10 No dia seguinte depois da aplicação, o cotilédone da planta de pepino foi inoculado colocando um disco de papel de 6 mm de diâmetro embebido com uma suspensão de esporos do fungo causal de mofo cinza da planta de pepino (*Botrytis cinerea*) conforme obtido por cultura sobre o meio de PSA, e mantido a 15 20°C sob condições úmidas.

Sete dias depois da inoculação, o valor de proteção (%) foi determinado de acordo com a equação (2), e a eficácia de controle foi avaliada de acordo com os critérios de julgamento conforme determinado no Exemplo Experimental 1.

$$\text{Valor de proteção (\%)} = \frac{(\text{Diâmetro da lesão na seção não tratada}) - (\text{Diâmetro da lesão na seção tratada})}{(\text{Diâmetro da lesão na seção não tratada})} \times 100 \quad (2)$$

20 Em consequência do experimento mencionado acima, o composto da presente invenção apresentou um efeito controle superior na concentração de ingrediente ativo de 50 ppm e na quantidade de emulsão de aplicação de 50 mL e particularmente, os compostos Nos. 1-20, 2-1, 2-20, 2-25, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-10, 3-11, 3-25, 3-30, 3-42, 3-43, 3-43-S, 3-51, 3-53, 3-61, 3-62, 3-64, 3-75, 3-77, 3-86, 3-89, 3-92, 3-93, 3-94, 3-96, 3-100, 3-102, 3-103, 3-104, 3-105, 3-106, 3'-5, 3'-6, 3'-7, 3'-11, 3'-30, 3'-42, 3'-43, 3'-44, 3"-5, 3"-8, 3"-42, 4-2, 5-21, 6-1, 6-3, 6-19, 6-22, 7-1 e 9-2 apresentaram uma alta atividade de 10 nos critérios de julgamento. O composto de comparação A, o composto de comparação B e o composto de comparação D não apresentaram efeito conforme evidenciado por 0 nos

critérios de julgamento. O composto de comparação A não apresentou efeito conforme evidenciado por 0 nos critérios de julgamento, mesmo por um tratamento em uma concentração 4 vezes tão elevada quanto 200 ppm.

Exemplo Experimental 3:

5 Teste sobre a eficácia de controle contra míldio pulverulento da planta de cevada

Uma planta de cevada de uma folha de idade (o cultivar: *Kantoh* No. 6) plantada como uma muda em um pote de 6 cm de diâmetro foi submetida à aplicação foliar com uma emulsão diluída do concentrado emulsificável do composto da presente invenção preparado de acordo com o Exemplo de Formulação 1, cuja emulsão diluída foi produzida diluindo o concentrado com água ao volume especificamente determinado. No dia seguinte depois da aplicação, a planta de cevada foi inoculada por aspersão com esporos conforme obtidos das folhas de plantas de cevada infectadas com o fungo causal de míldio pulverulento da cevada (*Blumeria graminis* f. sp. *hordei*), e mantidas sob condições de estufa. Sete dias depois da inoculação, a eficácia de controle foi avaliada de acordo com os critérios de julgamento conforme determinado no Exemplo Experimental 1.

Em consequência do experimento mencionado acima, o composto da presente invenção apresentou um efeito controle superior na concentração de ingrediente ativo de 50 ppm e na quantidade de emulsão de aplicação de 50 mL e particularmente, os compostos Nos. 1-16, 1-25, 1-27, 1-29, 1-30, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-37, 1-39, 1-51, 1-61, 1-63, 1-79, 2-18, 2-25, 2-26, 2-58, 3-4, 3-5, 3-7, 3-9, 3-10, 3-11, 3-25, 3-37, 3-42, 3-43, 3-43-S, 3-44, 3-50, 3-51, 3-53, 3-58, 3-60, 3-61, 3-62, 3-64, 3-75, 3-77, 3-86, 3-92, 3-93, 3-94, 3-96, 3-100, 3-102, 3-103, 3-104, 3'-5, 3'-7, 3'-11, 3'-42, 3'-43, 3'-45, 3'-61, 3'-65, 3''-42, 5-4, 5-6, 5-7, 5-15, 5-20, 5-21, 5-23, 6-1, 6-4, 6-11, 6-12, 6-13, 6-14, 6-15, 6-18, 6-20, 6-22, 6-23, 6-26 e 9-1 apresentaram uma alta atividade de 10 nos critérios de julgamento. O composto de comparação A, o composto de comparação B, o composto de comparação C e o composto de comparação D não apresentaram efeito conforme evidenciado por 0 nos critérios de julgamento.

30 Exemplo Experimental 4:

Teste sobre a eficácia de controle contra nematódeo do nó da raiz meridional (*Meloidogyne incognita*)

Uma emulsão preparada diluindo um concentrado emulsificável do composto da presente invenção, o qual foi preparado de acordo com o Exemplo de Formulação 1, até 500 ppm foi irrigada no pé da planta de uma planta de sementeira cultivada em pote plantada a partir da semente de melão. Um dia depois da irrigação, uma suspensão aquosa (cerca de 500 nematódeos/ml) de nematódeo do nó da raiz meridional foi inoculada (irrigação do solo) em uma seção tratada e uma seção não tratada, e o pote foi colocado dentro de uma estufa a 25°C. Oito dias depois da inoculação, a raiz foi lavada com água, o número de nós das raízes foi contado, e o efeito foi avaliado de acordo com os seguintes critérios de julgamento.

Critérios de julgamento

A: nenhum nó na raiz.

B: aparentemente estavam presentes menores números de nós nas raízes do que na seção não tratada.

C: estavam presentes nós nas raízes no número equivalente a ou maior do que na seção não tratada.

Em consequência do experimento mencionado acima, o composto da presente invenção apresentou um efeito controle superior na concentração de ingrediente ativo de 500 ppm pelo tratamento de irrigação do pé da planta, e os compostos Nos. 1-16, 1-34, 3'-43, 3'-44 e 3"-48 apresentaram uma alta atividade de não menos de B nos critérios de julgamento.

Aplicabilidade Industrial

O composto da presente invenção é útil como um agente controlador de praga apresentando um baixo impacto geoambiental, um amplo espectro de controle em uma baixa dose, e uma eficácia de controle superior.

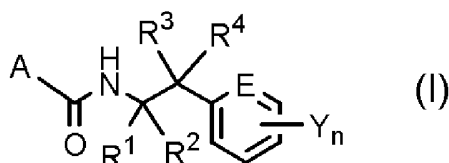
Este requerimento se baseia nos pedidos de patente N^{os}. 077752/2006 e 294810/2006 depositados no Japão, cujos conteúdos são por este incorporados por meio de referência.

Embora esta invenção tenha sido mostrada e descrita com referências a modalidades preferenciais da mesma, será entendido por aqueles versados na técnica que podem ser feitas várias alterações na forma e detalhes na mesma sem se afastar do âmbito da invenção englobada pelas reivindicações anexadas.

Todas as patentes, publicações de patente e outras publicações identificadas ou referidas aqui, neste requerimento de patente, são incorporadas por meio de referência em sua totalidade.

REIVINDICAÇÕES

1. Derivado de N-2-(hetero)ariletilcarboxamida, caracterizado pelo fato de que é representado pela fórmula (I)



em que R¹ e R² são, cada um de modo independente

5 um átomo de hidrogênio; ou

um grupo (C₁-C₃)alquila, ou

R¹ e R² são opcionalmente ligados um ao outro para formar um (C₃-C₆)cicloalcano,

R³ e R⁴ são cada um de modo independente

10 um átomo de hidrogênio;

um átomo de halogênio; ou

um grupo (C₁-C₆)alquila,

R³ e R⁴ são opcionalmente ligados um ao outro para formar um (C₃-C₆)cicloalcano, ou

15 R³ e R⁴ opcionalmente formam um átomo de oxigênio em combinação,

cada Y é de modo independente

um átomo de halogênio;

um grupo ciano;

um grupo hidróxi;

20 um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

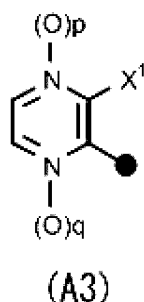
um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₂-C₆)alquenilóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

25 um grupo (C₁-C₆)alquiltio opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

um grupo (C₁-C₆)alquilsulfinila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

- um grupo (C₁-C₆)alquilsulfonila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- um grupo fenila opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados do grupo consistindo em
- 5 (i) um átomo de halogênio,
(ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
(iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;
- 10 um grupo fenóxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados do grupo consistindo em
(i) um átomo de halogênio,
(ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
- 15 (iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio; ou
um grupo heterociclíloxi opcionalmente substituído pelo mesmo ou por diferentes um ou mais substituintes selecionados do grupo consistindo em
(i) um átomo de halogênio,
- 20 (ii) um grupo (C₁-C₆)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio e
(iii) um grupo (C₁-C₆)alcóxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,
- n é um inteiro de 1 a 3,
- 25 dois Y's que se tornam adjacentes quando n é um inteiro de 2 ou 3 são opcionalmente ligados um ao outro para apresentar
um grupo (C₃-C₅)alquileno;
um grupo (C₃-C₅)alquenileno;
um grupo (C₂-C₄)alquilenoóxi; ou
- 30 um grupo (C₁-C₃)alquilenodióxi opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio,
A é um grupo cíclico substituído representado pela fórmula (A3)



em que X^1 é

um átomo de halogênio; ou

um grupo (C_1 - C_3)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio;

5 p e q são cada um 0, e

E é

C-H;

C-Y (Y é conforme definido acima); ou

um átomo de nitrogênio,

10 ou um sal dos mesmos.

2. Derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que

E é C-H ou C-Y, em que Y é como definido na reivindicação 1,

ou um sal do mesmo.

15 3. Agente controlador de praga, caracterizado pelo fato de que compreende o derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida como definido na reivindicação 1 ou 2, ou um sal do mesmo, como um ingrediente ativo.

4. Agente controlador de praga de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que é um agente controlador de doença de planta.

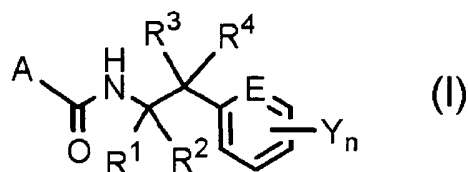
20 5. Agente controlador de praga de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que é um nematocida.

6. Método para controlar pragas, caracterizado pelo fato de que compreende tratar uma planta de safra objetiva ou o solo usado para cultivo da planta com uma quantidade eficaz do agente controlador de praga como
25 definido em qualquer uma das reivindicações 3 a 5.

RESUMO

Patente de Invenção: **"DERIVADO DE N-2-(HETERO)ARILETILCARBOXAMIDA, AGENTE CONTROLADOR DE PRAGAS COMPREENDENDO O MESMO, E MÉTODO PARA CONTROLAR PRAGAS".**

5 A presente invenção refere-se a um derivado de N-2-(hetero)ariletilacarboxamida representado pela fórmula (I)



em que R1 e R2 são cada um de modo independente um átomo de hidrogênio etc., R3 e R4 são cada um de modo independente um átomo de hidrogênio etc., cada Y é de modo independente um átomo de halogênio; um grupo
10 (C1-C6)alquila opcionalmente substituído por um ou mais átomos de halogênio etc., n é um inteiro de 1 a 5, A é um grupo cíclico substituído específico, E é C-H; C-Y (Y é conforme definido acima); ou um átomo de nitrogênio, um sal do mesmo, e um agente controlador de praga contendo o derivado ou
15 sal como um ingrediente ativo apresentam superior desempenho comparados com a técnica da arte anterior, e são úteis particularmente como agentes controladores de doenças de plantas ou nematocidas tendo um amplo espectro de controle em uma baixa dose.