



**República Federativa do Brasil**

Ministério do Desenvolvimento, Indústria,  
Comércio e Serviços

Instituto Nacional da Propriedade Industrial



**(11) BR 112016027901-8 B1**

**(22) Data do Depósito:** 28/05/2015

**(45) Data de Concessão:** 12/12/2023

---

**(54) Título:** COMPOSTOS DERIVADOS DE TIAZOLIDINONA QUE INIBEM ABSORÇÃO CELULAR DE ANANDAMIDA E USO DESTES COMPOSTOS

**(51) Int.Cl.:** C07D 417/06; C07D 277/54; A61K 31/426; A61P 25/00; A61P 29/00.

**(30) Prioridade Unionista:** 03/06/2014 EP 14171024.4; 28/05/2014 EP 14170449.4.

**(73) Titular(es):** UNIVERSITÄT BERN.

**(72) Inventor(es):** JEAN-LOUIS REYMOND; SIMON NICOLUSSI; JÜRIG GERTSCH.

**(86) Pedido PCT:** PCT EP2015061915 de 28/05/2015

**(87) Publicação PCT:** WO 2015/181337 de 03/12/2015

**(85) Data do Início da Fase Nacional:** 28/11/2016

**(57) Resumo:** COMPOSTOS. A presente invenção se refere a um composto compreendendo a seguinte fórmula geral (1) e o Dito composto para uso como um medicamento, em particular, para uso no tratamento de transtornos psiquiátricos ou neurológicos e inflamação, em particular, neuroinflamação: (fórmula 1) em que cada de R1, R2 e R3 são selecionados independentemente um do outro de alquila, alcoxi, alquenila, alquinila, cicloalquila, arila, heterociclo, ou heteroarila.

COMPOSTOS DERIVADOS DE TIAZOLIDINONA QUE INIBEM  
ABSORÇÃO CELULAR DE ANANDAMIDA E USO DESTES COMPOSTOS

[001] A presente invenção se refere a uma classe de derivados de tiazolidinona como inibidores de absorção celular de anandamida e seu uso no tratamento de transtornos psiquiátricos ou neurológicos e inflamação, em particular, neuroinflamação.

Antecedentes da invenção

[002] O sistema endocanabinoide (ECS) é um sistema de sinalização de lipídeo compreendendo endocanabinoides (ECs), que são lipídeos derivados de ácido araquidônico, os receptores de canabinoide acoplados a proteína G CB1 e CB2, bem como diversos outros alvos fisiológicos reais e potenciais envolvidos na síntese, transporte e degradação de ECs. Os principais ECs são 2-arachidonoilglicerol (2-AG) e *N*-arachidonoil etanolamida (AEA; anandamida) que modulam a transmissão sináptica pela sinalização retrógrada via receptores CB1 e exercem potentes efeitos imunomodulatórios via ambos os receptores CB1 e CB2. O ECS foi implicado em condições fisiológicas e patofisiológicas incluindo inflamação, dor, transtornos psiquiátricos e reprogramação metabólica. O ECS proporciona um sistema de proteção primário sob demanda contra excitotoxicidade aguda no sistema nervoso central (CNS) (Marsicano *et al.*, 2003, *Science*, 302, 84-8.)

[003] Estratégias terapêuticas dentro do ECS incluem o uso de agonistas e antagonistas de receptor canabinoide, bloqueio de enzimas hidrolíticas que degradam ECs, tais como amida hidrolase de ácido graxo (FAAH) e monoacilglicerol lipase (MAGL), bem como inibição de tráfico

de membrana celular de EC. Embora até o momento nenhuma proteína membrana para o transporte de EC tenha sido identificada, diversas linhas de evidência sugerem um transporte de membrana facilitado que envolve ambos os alvos de membrana e citoplásmico (Chicca *et al.*, 2012, *J Biol Chem.* 287, 36944-67; Fowler CJ., 2013, *FEBS J.*, 280:1895-904). O movimento de AEA através da célula é afetado pelo gradiente de concentração aumentado pela rápida hidrólise intracelular de AEA catalisada por FAAH. Portanto, FAAH desempenha um papel chave em absorção celular de AEA pela geração de um gradiente de concentração para dentro para AEA, que é a principal força motriz para a sua absorção celular.

[004] Usando os inibidores de absorção de AEA comercialmente disponíveis UCM707, OMDM-2 e LY2183240 foi recentemente proporcionada uma evidência para o transporte bidirecional de ambos os AEA e 2-AG através das membranas celulares, bem como um mecanismo comum de transporte de membrana celular para todos os ECs à base de araquidonato (Chicca *et al.*, 2012, *J Biol Chem.* 287, 36944-67). Uma vez que todos os inibidores disponíveis são somente moderadamente potentes e mostram baixa seletividade à inibição de transporte de AEA com relação à inibição de FAAH ou outros alvos citoplásmicos, as investigações dos mecanismos de absorção celular de AEA e 2-AG são atrapalhadas por uma falta de ferramentas adequadas. Como indicado por um recente estudo (Nicolussi *et al.*, *Pharmacol Res.*, 2014,80:52-65), a farmacologia de CNS de inibidores de quebra de endocanabinoide e inibidores de transporte de membrana de endocanabinoide é distintamente diferente e essa inibição de absorção celular de FAAH e AEA, respectivamente, pode ser

independente um do outro. A técnica anterior tem mostrado o uso de Dodeca-2E,4E-dieno amidas como inibidores específicos de absorção celular de AEA como agentes anti-inflamatórios na pele (documento WO 2010136221 A1). O valor terapêutico potencial de inibidores específicos de absorção celular de AEA para tratar doenças relacionadas com CNS permanece enormemente desconhecido. Em um modelo murino de esclerose múltipla, o transporte de membrana celular de AEA e inibidor de FAAH UCM707 mostrou efeitos benéficos pela redução da ativação microglial (Ortega-Gutierrez *et al.*, 2005, *FASEB J.*, 19, 1338-40). Usando UCM707, foi mostrado que um tono de AEA aumentado limita à excitotoxicidade *in vitro* e em um modelo de esclerose múltipla (Loria *et al.*, 2010, *Neurobiol Dis.*, 37, 166-76). A absorção celular de AEA não específica e inibidor de FAAH AM404 mostrou reduzir os efeitos de recompensa de elevações de dopamina induzidas por nicotina e nicotina no núcleo accumbens shell em ratos (Sherma *et al.*, *Br J Pharmacol.*, 2012, 165, 2539-48). O transporte não específico de membrana celular de inibidor de AEA VDM-11 mostrou modular o sono e expressão de c-Fos no cérebro de rato (Murillo-Rodriguez *et al.*, *Neuroscience*, 2008, 157, 1-11). A administração de inibidores de AEA de transporte de membrana celular OMDM-2 ou VDM-11 mostrou promover o sono e diminuir os níveis extracelulares de dopamina em ratos (Murillo-Rodriguez *et al.*, *Physiol Behav.* 2013, 109, 88-95). UCM707 mostrou se comportar como um agente de controle de sintoma em modelos de doença de Huntington e esclerose múltipla, mas falhou em atrasar/parar a progressão de diferentes transtornos motores relacionados (de Lago *et al.*, *Eur Neuropsychopharmacol.*, 2006, 16, 7-18). Como mostrado por

um estudo usando UCM707 e AM404, inibidores de transporte de AEA podem têm potencial no tratamento de neuropatia diabética dolorosa (Hasanein e Soltani, 2009, Clin Exp Pharmacol Physiol. 36, 1127-31). Ter como alvo os carreadores de AEA intracelular de proteína de ligação a ácido graxo (FABP) sugeriu recentemente ser uma estratégia para gerar fármacos anti-inflamatórios e anti-nociceptivos (Berger *et al.*, 2012, PLoS One., 7(12):e50968.). No entanto, a farmacologia entre a inibição de transporte de membrana celular de AEA e a inibição de carreadores citoplásmicos é esperada que seja diferente, como exemplificado pelo fato de que os inibidores de FABP5 aparentemente não mostram o mesmo grau de efeitos canabimiméticos observados com o potente inibidor de transporte de membrana celular de AEA guinensina (Kaczocha *et al.*, PLoS One. 2014, 9(4):e94200; Nicolussi *et al.*, 2014, Pharmacol Res., 80, 52-65).

[005] Em geral, existe uma necessidade de novos inibidores de transporte de membrana celular de AEA com especificidade e potência superiores para tratar das doenças relacionadas com inflamação e CNS que envolvem o tono endocanabinoide aberrante ou em que a inibição de absorção celular de AEA pode ter como alvo condições patofisiológicas. Dado o fato de que AEA e outros endocanabinoides estão envolvidos em ambos os processos sinápticos via sinalização retrógrada e processos imunomodulatórios, espera-se que os inibidores específicos de transporte de membrana celular de AEA exerçam efeitos terapêuticos em doenças neuropsiquiátricas que envolvem a neuroinflamação. Quando a degradação de AEA e outros endocanabinoides é bloqueada, por exemplo, pela inibição covalente de FAAH, espera-se que a

acumulação intracelular resultante de AEA (Chicca *et al.*, 2012, *J Biol Chem.*, 287, 36944-67) tenha potencialmente também efeitos pró-inflamatórios via oxigenação de AEA e possivelmente outros endocanabinoides pela ciclooxigenase-2 (discutido em Chicca *et al.*, 2014, *ACS Chem Biol*, <http://pubs.acs.org/doi/abs/10.1021/cb500177c>). Portanto, a inibição de degradação de AEA e a inibição de transporte de membrana celular são intervenções farmacológicas distintas. Além disso, espera-se que a inibição específica de transporte de membrana celular de AEA, ao contrário da inibição de FAAH ou carreadores citoplásmicos, module diferencialmente o tono de AEA sem levar a ativação de canais de TRPV1 via acumulação de AEA intracelular.

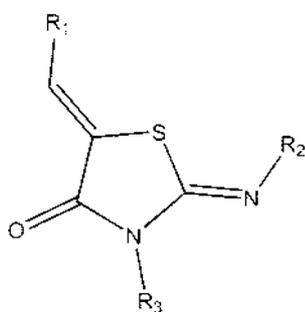
[006] É voltada a atenção, portanto, à identificação de uma nova classe de moléculas capazes de inibir especificamente a absorção celular de AEA que não afetam as enzimas hidrolíticas, tais como a serina hidrolase FAAH. Mostra-se que estes compostos desencadeiam os efeitos comportamentais canabimiméticos e inibem a inflamação, em particular, neuroinflamação.

[007] A presente invenção se refere a derivados de tiazolidinona e seu uso para o tratamento de transtornos psiquiátricos ou neurológicos e inflamação, em particular, neuroinflamação. O uso dos compostos da invenção em um método para o tratamento de transtornos psiquiátricos ou neurológicos está relacionado com a atenuação de neuroinflamação e sinalização neuronal retrógrada mediada via AEA e outros endocanabinoides. Em exemplo, tais doenças incluem esclerose múltipla, epilepsia, doença de Alzheimer, doenças bipolares, esquizofrenia, transtornos do sono, e

lesão da medula espinal (Ashton e Moore, *Acta Psychiatr Scand.* 2011, 124, 250- 61.; Aso e Ferrer I, *Front Pharmacol.*, 2014, 5, 37; Correa et al. *Vitam Horm.* 2009, 81, 207-30; Hofmann e Frazier, *Exp Neurol.* 2013, 244, 43-50; Pacheret al., *Pharmacol Rev.*, 2006, 58, 389-462).

#### Sumário da invenção

[008] Um primeiro aspecto da invenção se refere a um composto caracterizado por uma fórmula geral 1



(fórmula 1)

em que

1. R<sup>1</sup> é selecionado de

- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou
- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída, e

[009] cada de R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> são selecionados independentemente um do outro de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,
- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,
- uma alquenila substituída ou não substituída,

em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquênica substituída ou não substituída,

- uma alquênica substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquênica substituída ou não substituída,

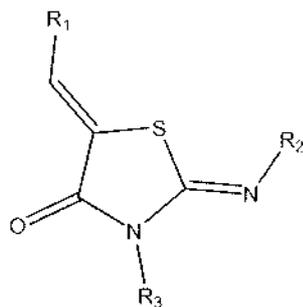
- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída.

[0010] Um segundo aspecto da invenção se refere a um composto caracterizado por uma fórmula geral 1



(fórmula 1)

em que

[0011] R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,

- um alcoxi substituído ou não substituído, em

particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída, e

cada de R<sup>1</sup> e R<sup>3</sup> são selecionados independentemente um do outro de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,

- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não

substituída,

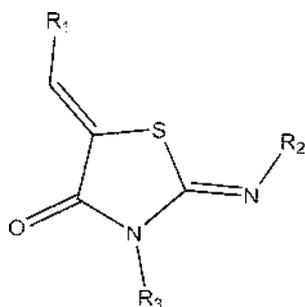
- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída.

[0012] Um terceiro aspecto da invenção se refere a um composto caracterizado por uma fórmula geral 1



(fórmula 1)

em que

R<sup>3</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,

- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída, e

cada de R<sup>1</sup> e R<sup>2</sup> são selecionados independentemente um do outro de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,

- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,

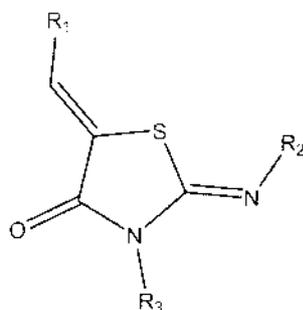
- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,
- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou
- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída.

Um quarto aspecto da invenção se refere a um composto caracterizado por a seguinte fórmula geral (1)



(fórmula 1)

em que

R<sup>1</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,
- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,
- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,
- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,
- uma cicloalquila substituída ou não

substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída, e cada de R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> são selecionados independentemente um do outro de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,

- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída.

[0013] Um quinto aspecto da invenção se refere a um composto de acordo com o primeiro, segundo, terceiro ou

quarto aspecto da invenção para uso como um medicamento.

[0014] Um sexto aspecto da invenção se refere a um composto de acordo com o primeiro, segundo, terceiro ou quarto aspecto da invenção para uso no tratamento de transtornos psiquiátricos ou neurológicos e inflamação, em particular, neuroinflamação.

[0015] Um sétimo aspecto da invenção se refere a uma preparação farmacêutica para uso no tratamento de transtornos psiquiátricos ou neurológicos e inflamação, em particular, neuroinflamação, compreendendo pelo menos um composto de acordo com o primeiro, segundo, terceiro ou quarto aspecto da invenção.

[0016] Um oitavo aspecto da invenção se refere ao composto do primeiro aspecto, particularmente o primeiro, segundo e terceiro subaspecto, da invenção para uso como um modulador do sistema de endocanabinoide.

[0017] Um nono aspecto da invenção se refere ao composto do primeiro aspecto, particularmente o primeiro, segundo e terceiro subaspecto, da invenção para uso como um Inibidor de absorção de AEA.

[0018] Os compostos da invenção podem também ser usados como um analgésico. É feita referência às figuras e seção experimental.

[0019] O termo "substituído" se refere à adição de um grupo substituinte a uma fração parental.

[0020] "Grupos substituintes" podem ser protegidos ou não protegidos e podem ser adicionados a um sítio disponível ou a muitos sítios disponíveis em uma fração parental. Grupos substituintes podem também ser substituídos ainda com outros grupos substituintes e podem ser unidos

diretamente ou por um grupo de ligação tal como uma alquila, uma amida ou grupo hidrocarbila a uma fração parental. "Grupos substituintes" acessíveis no presente documento incluem, sem limitação, halogênio, oxigênio, nitrogênio, enxofre, hidroxila, alquila, alquenila, alquinila, acila, carboxila, grupos alifáticos, grupos alicíclicos, alcoxi, oxí substituído, arila, aralquila, amino, imino, compostos amido fluorados etc..

[0021] Como usado no presente documento o termo "alquila," se refere a uma fração de hidrocarboneto de cadeia linear ou ramificada saturado contendo em particular, até 12 átomos de carbono. Exemplos de grupos alquila incluem, sem limitação, metila, etila, propila, butila, isopropila, n-hexila, octila, e semelhantes. Grupos alquila tipicamente incluem de 1 a cerca de 12 átomos de carbono ( $C_1$ - $C_{12}$  alquila).

[0022] Como usado no presente documento o termo "cicloalquila" se refere a um grupo alquila interconectado formando um anel saturado ou insaturado (ou parcialmente insaturado) ou estrutura polianel contendo 3 a 10, particularmente 5 a 10 átomos de carbono. Exemplos de grupos cicloalquila incluem, sem limitação, ciclopropano, ciclopentano, ciclohexano, norbornano, decalina ou adamantano (Triciclo[3.3.1.1]decano), e semelhantes. Grupos cicloalquila tipicamente incluem de 5 a 10 átomos de carbono ( $C_5$ - $C_{10}$  cicloalquila).

[0023] Grupos alquila ou cicloalquila como usado no presente documento podem opcionalmente incluir grupos substituintes adicionais. Uma substituição no grupo cicloalquila também abrange uma arila, um heterociclo ou um substituinte heteroarila, que pode ser conectado ao grupo

cicloalquila via um átomo ou dois átomos do grupo cicloalquila.

[0024] Como usado no presente documento o termo "alquenila," se refere a uma fração de hidrocarboneto de cadeia linear ou ramificada contendo em particular, até 12 átomos de carbono e que tem pelo menos uma ligação dupla carbono-carbono. Exemplos de grupos alquenila incluem, sem limitação, etenila, propenila, butenila, 1- metil-2-buten-1-ila, dienos tais como 1,3-butadieno e semelhantes. Grupos alquenila como usado no presente documento podem opcionalmente incluir grupos substituintes adicionais.

[0025] Como usado no presente documento o termo "alquinila," se refere a uma fração de hidrocarboneto de cadeia linear ou ramificada contendo em particular, até 12 átomos de carbono e que tem pelo menos uma ligação tripla carbono-carbono. Exemplos de grupos alquinila incluem, sem limitação, etinila, 1-propinila, 1-butinila, e semelhantes. Grupos alquinila como usado no presente documento podem opcionalmente incluir grupos substituintes adicionais.

[0026] Como usado no presente documento o termo "alcoxi," se refere a uma fração alquila de oxigênio contendo em particular, 1 a 12 átomos de carbono compreendendo pelo menos uma fração de oxigênio ao invés de uma fração  $\text{CH}_2$ . Exemplos de grupos alcoxi incluem sem limitação, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, n-butoxi, sec-butoxi, terc-butoxi, n-pentoxi, neopentoxi, n-hexoxi e semelhantes. Grupos alcoxi como usado no presente documento podem opcionalmente incluir grupos substituintes adicionais. Além disso, grupos "alcoxi" incluem grupos éter de cadeia linear ou ramificada (por exemplo,  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_3$ ) ou grupos poliéter, que

compreendem diversos grupos alcoxi monoméricos interconectados (por exemplo - O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>).

[0027] Como usado no presente documento o termo "heterociclo" se refere a um grupo alquila interconectado formando um anel saturado ou insaturado ou estrutura polianel contendo 3 a 10, particularmente 5 a 10 átomos de carbono em que pelo menos um átomo de carbono é substituído com um oxigênio, um nitrogênio ou um átomo de enxofre formando uma estrutura não aromática. Grupos heterocíclicos como usado no presente documento podem opcionalmente incluir grupos substituintes adicionais. Uma substituição no grupo heterocíclico também abrange uma arila, uma cicloalquila ou um substituinte heteroarila, que pode ser conectado ao grupo heterocíclico via um átomo ou dois átomos do grupo heterocíclico (comparável a indol).

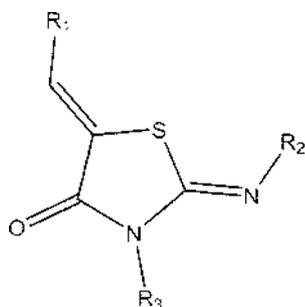
[0028] Como usado no presente documento o termo "arila" se refere a um hidrocarboneto com ligações duplas e simples alternadas entre os átomos de carbono formando uma estrutura de anel aromático, em particular, um anel de seis membros (C<sub>6</sub> a dez (C<sub>10</sub>) ou estrutura polianel. O termo "heteroarila" se refere a estruturas aromáticas compreendendo um anel de cinco a dez membros ou estrutura polianel, comparável a compostos de arila, em que pelo menos um membro é um oxigênio ou um nitrogênio ou um átomo de enxofre. Devido a razões de simplicidade são denominados C<sub>5</sub> a C<sub>10</sub> heteroarila, em que pelo menos um átomo de carbono é substituído com um oxigênio, um nitrogênio ou um átomo de enxofre formando uma estrutura aromática. Por exemplo, uma C<sub>5</sub> heteroarila compreende uma estrutura de anel de cinco membros com pelo menos um átomo de carbono sendo substituído com um oxigênio,

um nitrogênio ou um átomo de enxofre. Grupos arila ou hetero arila como usado no presente documento podem opcionalmente incluir grupos substituintes adicionais. Uma substituição no grupo hetero arila também abrange uma arila, uma cicloalquila ou um substituinte heterociclo, que pode ser conectado à hetero arila via um átomo ou dois átomos do grupo hetero arila (comparável a indol). O mesmo se aplica a um grupo arila.

[0029] Como usado no presente documento "\*" indica um centro de uma estrutura de isômero E ou Z, que está localizado no átomo debaixo do asterisco \*.

[0030] Descrição detalhada da invenção

[0031] De acordo com um primeiro aspecto da invenção, a invenção se refere a um composto caracterizado por uma fórmula geral 1



(fórmula 1)

em que

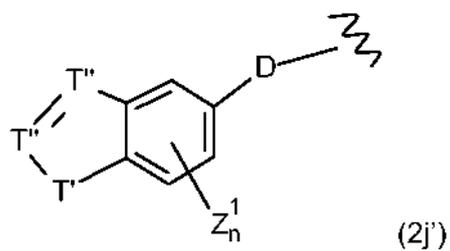
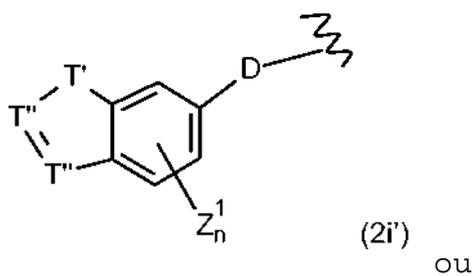
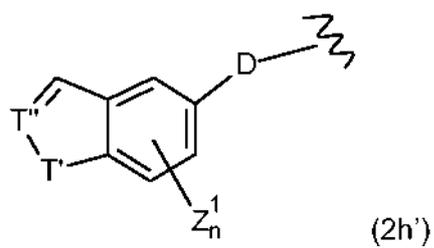
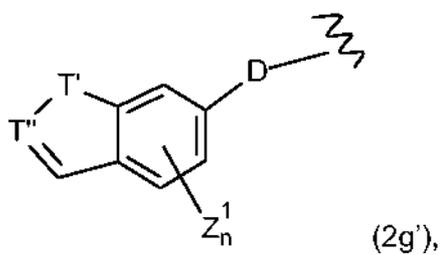
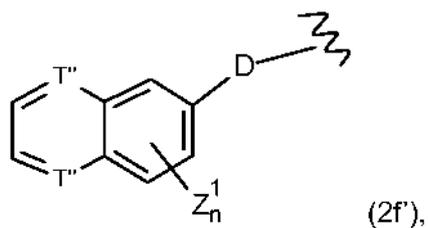
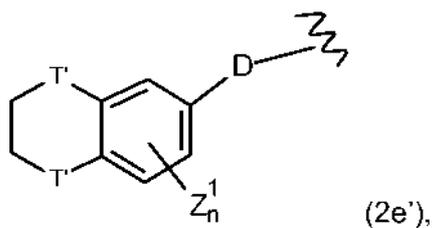
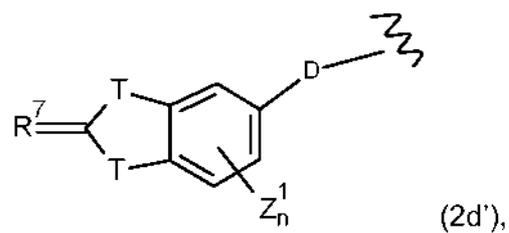
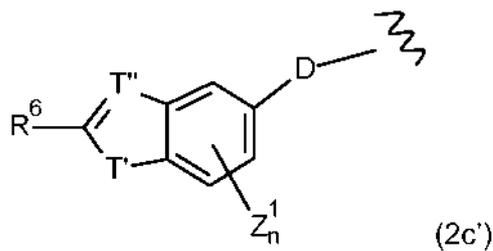
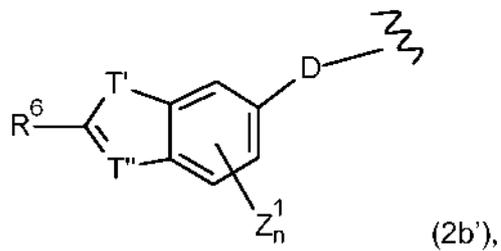
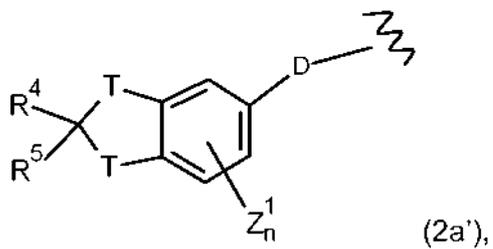
$R^1$  é selecionado de

- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um  $C_3$ - $C_{10}$  heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_5$ - $C_{10}$  heteroarila substituída ou não substituída, e cada de  $R^2$  e  $R^3$  são selecionados independentemente um do outro de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,
- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,
- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,
- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,
- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,
- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,
- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou
- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída.

[0032] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> compreende a fórmula geral 2a' a 2j',



ou

- com D sendo uma C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub> alquila,
- com cada T sendo selecionado independentemente

um do outro de  $-\text{CH}_2$ ,  $-\text{NH}$ ,  $-\text{S}$ ,  $-\text{O}$ ,  $-\text{CHCH}_3$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)_2$  ou  $-\text{NR}^c$ , em particular, de  $\text{NH}$ ,  $-\text{S}$  ou  $-\text{O}$ , e

- com  $\text{T}'$  sendo selecionado de  $-\text{CH}_2$ ,  $-\text{NH}$ ,  $-\text{S}$ ,  $-\text{O}$ ,  $-\text{CHCH}_3$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)_2$  ou  $-\text{NR}^c$ , e

- com cada  $\text{T}''$  sendo selecionado independentemente um do outro sendo selecionado de  $-\text{CH}$  ou  $=\text{N}$ ,

- com  $\text{R}^4$  e  $\text{R}^5$  sendo selecionados independentemente um do outro de  $-\text{H}$ ,  $-\text{F}$ ,  $-\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{OCH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CHF}_2$ ,  $-\text{CF}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CHF}_2$ ,  $-\text{CH}_2\text{F}$  ou  $-\text{CF}_3$ , em particular,

- com  $\text{R}^5$  e  $\text{R}^6$  sendo selecionados independentemente um do outro de  $\text{H}$ ,  $-\text{F}$  ou  $-\text{CH}_3$ , e

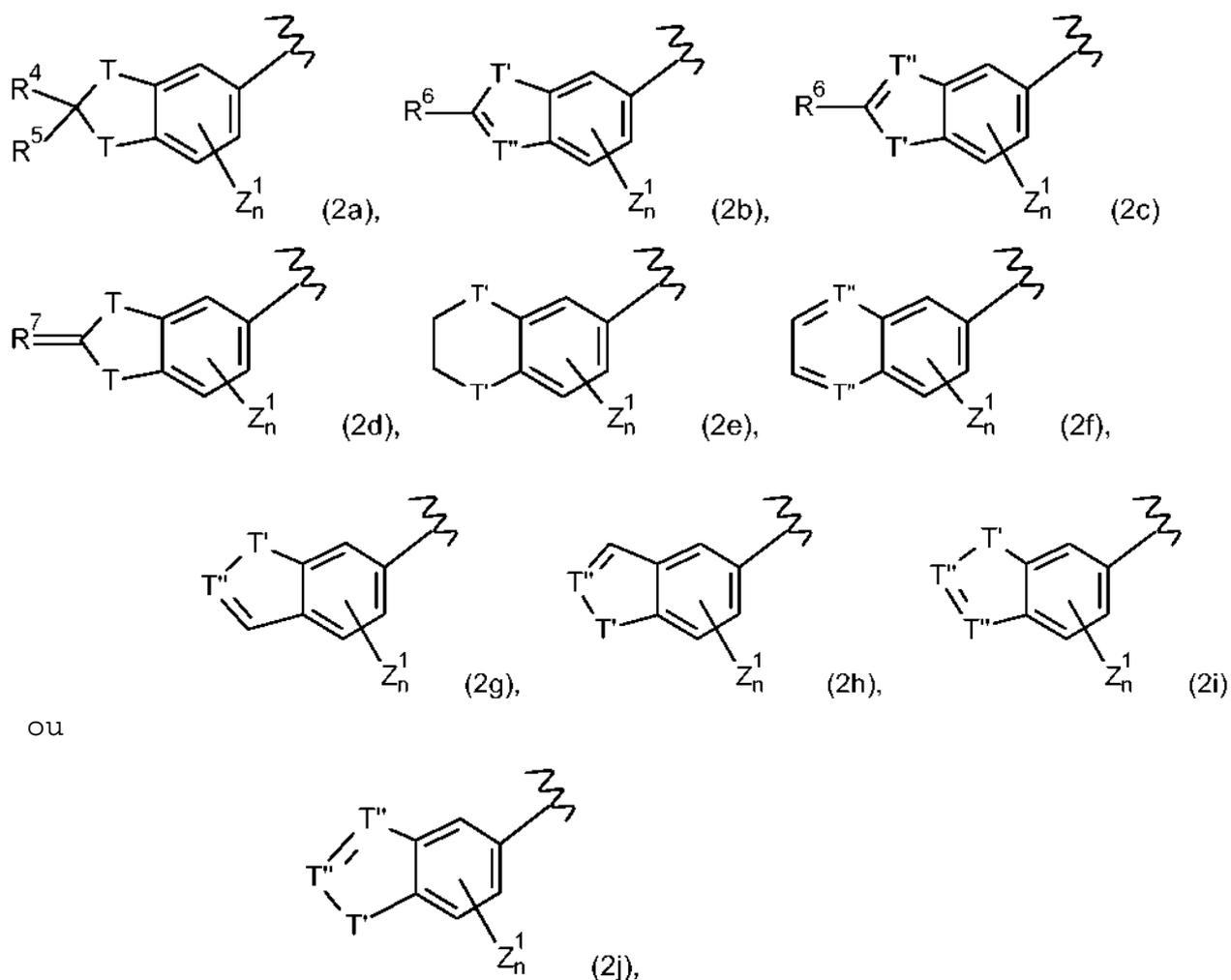
- com  $\text{R}^6$  sendo selecionado de  $-\text{OH}$ ,  $-\text{OCH}_3$ ,  $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_3$  ou  $\text{H}$ ,

- com  $\text{R}^7$  sendo selecionado de  $=\text{NH}$ ,  $=\text{S}$  ou  $=\text{O}$ , em particular, de  $\text{O}$ , e

- com  $n$  de  $\text{Z}_n^1$  sendo 0, 1, 2 ou 3, em particular,  $n$  de  $\text{Z}_n^1$  sendo 0 ou 1, e com cada  $\text{Z}^1$  independentemente de qualquer outro  $\text{Z}^1$  sendo selecionado de  $-\text{F}$ ,  $-\text{Cl}$ ,  $-\text{Br}$ ,  $-\text{I}$ ,  $\text{CN}$ ,  $-\text{R}^a$ ,  $-\text{OR}^a$ ,  $-(\text{CH}_2)_r\text{OR}^a$ ,  $-\text{SR}^a$ ,  $-(\text{CH}_2)_r\text{SR}^a$  ou  $-\text{NR}^a_2$ , com cada  $\text{R}^a$  sendo selecionado independentemente um do outro de  $\text{H}$ , uma  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$  alquila, uma  $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $\text{C}_2$ - $\text{C}_4$  alquenila, ou uma  $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $\text{C}_2$ - $\text{C}_4$  alquinila, com  $r$  sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular,  $r$  é 1,

- com  $\text{R}^c$  sendo  $-\text{CH}_2\text{OH}$ ,  $-\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ,  $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CHF}_2$ ,  $-\text{CF}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CHF}_2$ ,  $-\text{CH}_2\text{F}$ ,  $-\text{CF}_3$ .

[0033] Em algumas modalidades,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2a a 2j,



- com cada  $T$  sendo selecionado independentemente um do outro de  $-\text{CH}_2$ ,  $-\text{NH}$ ,  $-\text{S}$ ,  $-\text{O}$ ,  $-\text{CHCH}_3$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)_2$  ou  $-\text{NR}^c$ , em particular, de  $\text{NH}$ ,  $-\text{S}$  ou  $-\text{O}$ , e

- com  $T'$  sendo selecionado de  $-\text{CH}_2$ ,  $-\text{NH}$ ,  $-\text{S}$ ,  $-\text{O}$ ,  $-\text{CHCH}_3$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)_2$  ou  $-\text{NR}^c$ , e

- com cada  $T''$  sendo selecionado independentemente um do outro sendo selecionado de  $-\text{CH}$  ou  $=\text{N}$ ,

- com  $R^4$  e  $R^5$  sendo selecionados

independentemente um do outro de -H, -F, -CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -OCH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F ou -CF<sub>3</sub>, em particular, com R<sup>5</sup> e R<sup>6</sup> sendo selecionados independentemente um do outro de H, -F ou -CH<sub>3</sub>, e

- com R<sup>6</sup> sendo selecionado de -OH, -OCH<sub>3</sub>, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>3</sub> ou H,

- com R<sup>7</sup> sendo selecionado de =NH, =S ou =O, em particular, de O, e

- com n de Z<sup>1</sup><sub>n</sub> sendo 0, 1, 2 ou 3, em particular, n de Z<sup>1</sup><sub>n</sub> sendo 0 ou 1, e com cada Z<sup>1</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>1</sup> sendo selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>a</sup>, -OR<sup>a</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>a</sup>, -SR<sup>a</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>a</sup> ou -NR<sup>a</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>a</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1,

- com R<sup>c</sup> sendo -CH<sub>2</sub>OH, -CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>3</sub>.

Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> compreende a fórmula geral 2b' to 2i' ou 2b to 2i, em particular, a fórmula geral 2b to 2i, com R<sup>c</sup>, n de Z<sup>1</sup><sub>n</sub> e Z<sup>1</sup><sub>n</sub> tendo o mesmo significado como definido anteriormente, e

- com T' do composto de acordo com a fórmula 2a sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>c</sup>, em que, em particular, T' é O, R<sup>4</sup> e R<sup>5</sup> sendo selecionados independentemente um do outro de -H, -F, -CH<sub>3</sub>, em particular, com R<sup>5</sup> e R<sup>6</sup> sendo H,

- com T' do composto de acordo com a fórmula 2b ou 2c sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>C</sup>, em que, em particular, T' é S ou -NH, e T'' sendo selecionado de -CH ou =N, e com R<sup>6</sup> sendo selecionado de -CH<sub>3</sub> ou H, em particular, R<sup>6</sup> é H,

- com cada T do composto de acordo com a fórmula 2d sendo selecionado independentemente um do outro de -NH, -S, -O ou -NR<sup>C</sup>, em particular, pelo menos um T é selecionado de NH ou -NCH<sub>3</sub>, mais particularmente o T na posição 4, com relação à ligação à fração parental, é -NH, e com R<sup>7</sup> sendo selecionado de =NH, =S ou =O, em particular, de O, e

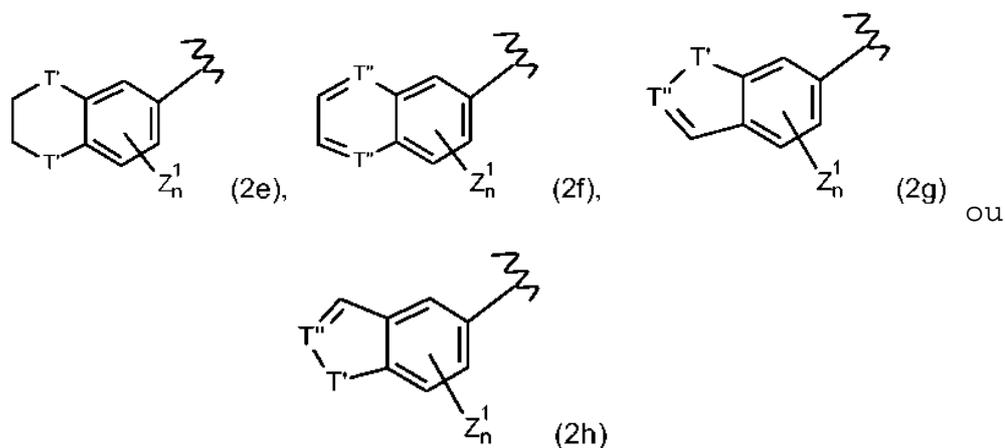
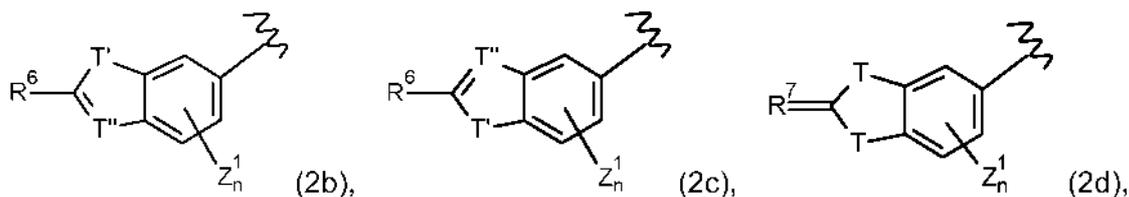
- com T' do composto de acordo com a fórmula 2e sendo selecionado de -CH<sub>2</sub>, -NH, -S ou -O, em particular, T' sendo -NH ou -O,

- com cada T'' do composto de acordo com a fórmula 2f sendo selecionado independentemente um do outro de -CH ou =N, em particular, cada T'' é =N,

- com T' do composto de acordo com a fórmula 2g ou 2h sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>C</sup>, em que, em particular, T' é -NR<sup>C</sup> ou -NH, e T'' sendo selecionado de -CH ou =N, em particular, T'' é =N,

- com T' do composto de acordo com a fórmula 2i ou 2j sendo selecionado de -NH ou -NR<sup>C</sup>, em que, em particular, T' é -NH, e T'' é =N.

[0034] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> compreende a fórmula geral 2b a 2h,



com T, T', T'', n de  $Z_n^1$ ,  $Z_n^1$ ,  $R^6$  e  $R^7$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente.

[0035] Em algumas modalidades,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2b' a 2h' ou 2b a 2h, em particular, a fórmula geral 2b a 2h, com  $R^c$ , n de  $Z_n^1$  e  $Z_n^1$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente, e

- com T' do composto de acordo com a fórmula 2b ou 2c sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>c</sup>, em que, em particular, T' é S ou -NH, e T'' sendo selecionado de -CH ou =N, e com  $R^6$  sendo selecionado de -CH<sub>3</sub> ou H, em particular,  $R^6$  é H,

- com cada T do composto de acordo com a fórmula 2d sendo selecionado independentemente um do outro de -NH, -S, -O ou -NR<sup>c</sup>, em particular, pelo menos um T é selecionado de NH ou -NCH<sub>3</sub>, mais particularmente o T na

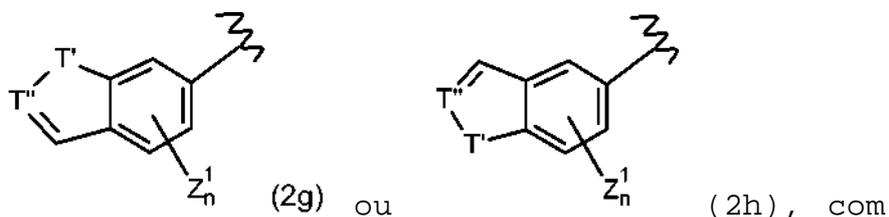
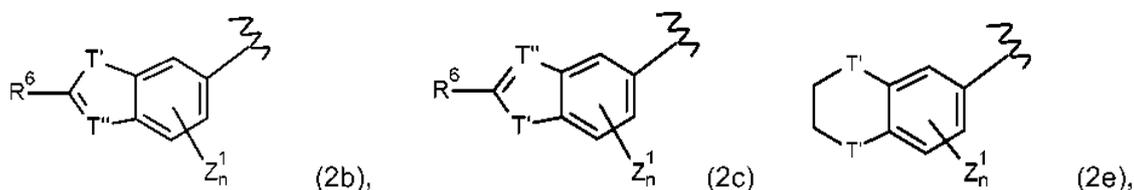
posição 4, com relação à ligação à fração parental, é -NH, e com  $R^7$  sendo selecionado de =NH, =S ou =O, em particular, de O, e

- com  $T'$  do composto de acordo com a fórmula 2e sendo selecionado de -CH<sub>2</sub>, -NH, -S ou -O, em particular,  $T'$  sendo -O,

- com cada  $T''$  do composto de acordo com a fórmula 2f sendo selecionado independentemente um do outro de -CH ou =N, em particular, cada  $T''$  é =N,

- com  $T'$  do composto de acordo com a fórmula 2g ou 2h sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>C</sup>, em que, em particular,  $T'$  é -NR<sup>C</sup> ou -NH, e  $T''$  sendo selecionado de -CH ou =N, em particular,  $T''$  é =N.

[0036] Em algumas modalidades,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2b, 2c, 2e, 2g ou 2h



$T, T', T'', n$  de  $Z_n^1, Z_n^1, R^6$  e

[0037]  $R^7$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente.

[0038] Em algumas modalidades,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2b', 2c', 2e', 2g' ou 2h' ou 2b, 2c, 2e, 2g ou

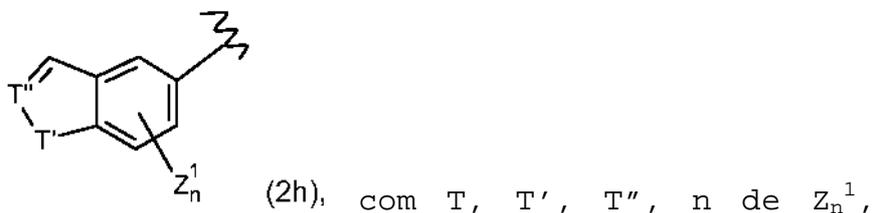
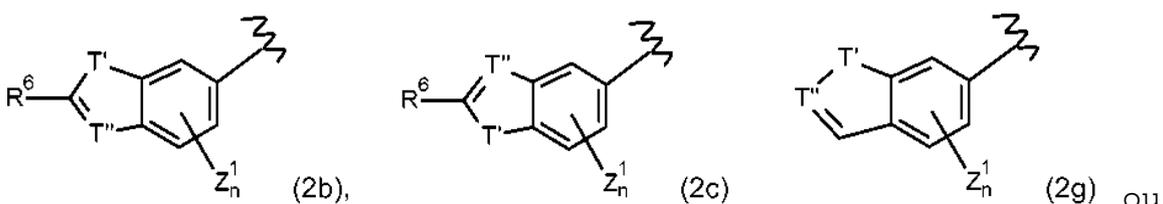
2h, em particular, a fórmula geral 2b, 2c, 2e, 2g ou 2h, com  $R^c$ , n de  $Z_n^1$  e  $Z_n^1$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente e

- com T' do composto de acordo com a fórmula 2b ou 2c sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>c</sup>, em que, em particular, T' é S ou -NH, e T'' sendo selecionado de -CH ou =N, e com R<sup>6</sup> sendo selecionado de -CH<sub>3</sub> ou H, em particular, R<sup>6</sup> é H,

- com T' do composto de acordo com a fórmula 2e sendo selecionado de -CH<sub>2</sub>, -NH, -S ou -O, em particular, T' sendo -O,

- com T' do composto de acordo com a fórmula 2g ou 2h sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>c</sup>, em que, em particular, T' é -NR<sup>c</sup> ou -NH, e T'' sendo selecionado de -CH ou =N, em particular, T'' é =N.

[0039] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> compreende a fórmula geral 2b, 2c, 2g ou 2h,



$Z_n^1$ , R<sup>6</sup> e R<sup>7</sup> tendo o mesmo significado

como definido anteriormente.

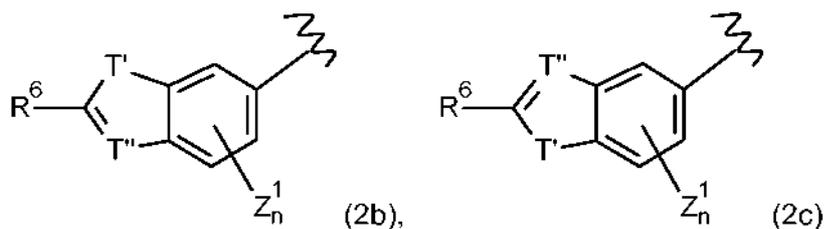
[0040] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> compreende a fórmula geral 2b', 2c', 2g' ou 2h' ou 2b, 2c, 2g ou 2h, em

particular, a fórmula geral 2b, 2c, 2g ou 2h, com  $R^c$ , n de  $Z_n^1$  e  $Z_n^1$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente e

- com  $T'$  do composto de acordo com a fórmula 2b ou 2c sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>C</sup>, em que, em particular,  $T'$  é S ou -NH, e  $T''$  sendo selecionado de -CH ou =N, e com  $R^6$  sendo selecionado de -CH<sub>3</sub> ou H, em particular,  $R^6$  é H,

- com  $T'$  do composto de acordo com a fórmula 2g ou 2h sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>C</sup>, em que, em particular,  $T'$  é -NR<sup>C</sup> ou -NH, e  $T''$  sendo selecionado de -CH ou =N, em particular,  $T''$  é =N.

[0041] Em algumas modalidades,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2b ou 2c



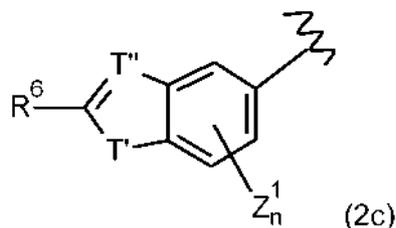
com  $T$ ,  $T''$ , n de  $Z_n^1$ ,  $Z_n^1$  e  $R^6$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente.

[0042] Em algumas modalidades,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2b' ou 2c' ou 2b ou 2c, em particular, a fórmula geral 2b ou 2c, com  $R^c$ , n de  $Z_n^1$  e  $Z_n^1$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente,

- com  $T'$  do composto de acordo com a fórmula 2b ou 2c sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>C</sup>, em que, em particular,  $T'$  é S ou -NH, e  $T''$  sendo selecionado de -CH ou =N, e com  $R^6$  sendo selecionado de -CH<sub>3</sub> ou H, em particular,  $R^6$  é H.

[0043] Em algumas modalidades,  $R^1$  compreende a

fórmula geral 2c



com  $T'$ ,  $T''$ ,  $n$  de  $Z_n^1$ ,  $Z_n^1$  e  $R^6$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente.

[0044] Em algumas modalidades,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2c' ou 2c, em particular, a fórmula geral 2c, com  $R^c$ ,  $n$  de  $Z_n^1$  e  $Z_n^1$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente,

- com  $T'$  do composto de acordo com a fórmula 2c sendo selecionado de  $-NH$ ,  $-S$ ,  $-O$  ou  $-NR^c$ , em que, em particular,  $T'$  é  $-NH$ , e  $T''$  sendo selecionado de  $-CH$  ou  $=N$ , em particular, de  $=N$ , e com  $R^6$  sendo selecionado de  $-CH_3$  ou  $H$ , em particular,  $R^6$  é  $H$ .

[0045] Em algumas modalidades,  $R^c$  é selecionado de  $-CH_2OH$ ,  $-CH_3$ ,  $-CH_2CH_3$ ,  $-CH_2CH_2CH_3$  ou  $-CH(CH_3)_2$ , em particular, de  $-CH_3$ ,  $-CH_2CH_3$  ou  $-CH(CH_3)_2$ , mais particularmente  $R^c$  é  $CH_3$ .

[0046] Em algumas modalidades,  $n$  de  $Z_n^1$  é 0, 1 ou 2, em particular,  $n$  é 0 ou 1.

[0047] Em algumas modalidades,  $n$  de  $Z_n^1$  é 1.

[0048] Em algumas modalidades,  $n$  de  $Z_n^1$  é 0.

[0049] Em algumas modalidades, cada  $Z^1$  independentemente de qualquer outro  $Z^1$  é selecionado de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-I$ ,  $CN$ ,  $-R^a$ ,  $-OR^a$ ,  $CH_2OR^a$ , com cada  $R^a$  sendo selecionado independentemente um do outro de  $H$ , uma  $C_1-C_8$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$

alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila.

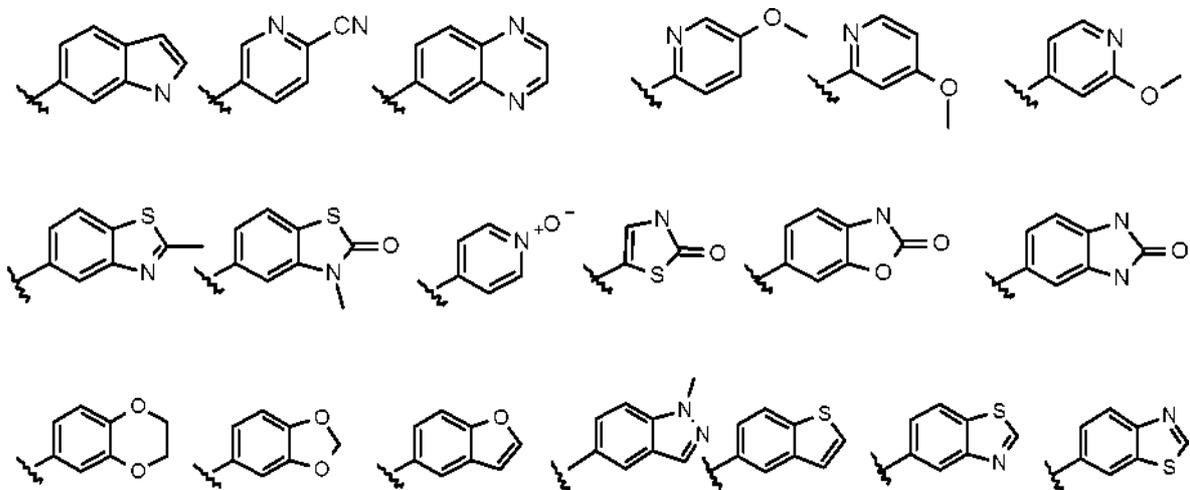
[0050] Em algumas modalidades, cada Z<sup>1</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>1</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, CH<sub>2</sub>OR<sup>a</sup> ou -OR<sup>a</sup>, com cada R<sup>a</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila.

[0051] Em algumas modalidades, cada Z<sup>1</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>1</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, OH, CH<sub>2</sub>OH, CH<sub>2</sub>OR<sup>a</sup> ou -OR<sup>a</sup> com R<sup>a</sup> sendo selecionado de uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, em particular, de uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila.

[0052] Em algumas modalidades, cada Z<sup>1</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>1</sup> é selecionado de CN, OH, -OCH<sub>3</sub>, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -O(CH<sub>2</sub>)CCH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> ou -CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)CCH<sub>3</sub>, em particular, de CN, OH, -OCH<sub>3</sub> ou -CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, mais particularmente de -OCH<sub>3</sub> ou -CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>.

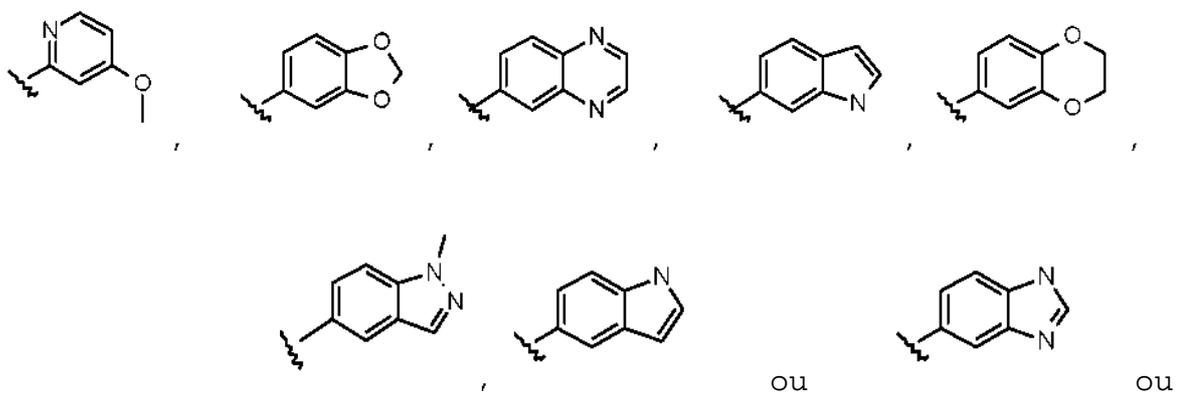
[0053] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> é selecionado de





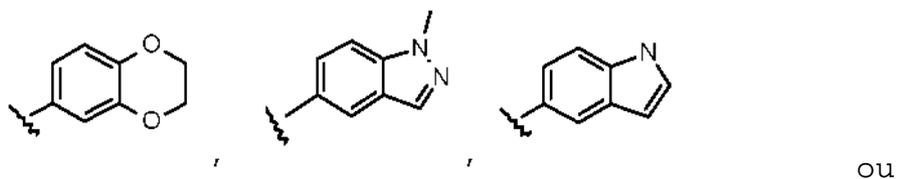
ou derivados dos mesmos.

[0054] Em algumas modalidades,  $R^1$  é selecionado de

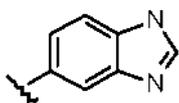


derivados dos mesmos.

[0055] Em algumas modalidades,  $R^1$  é selecionado de

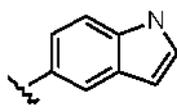
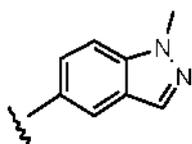


ou

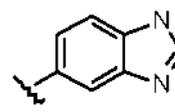


ou derivados dos mesmos.

[0056] Em algumas modalidades,  $R^1$  é selecionado de



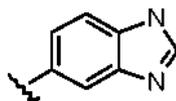
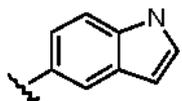
ou



ou

derivados dos mesmos.

[0057] Em algumas modalidades,  $R^1$  é selecionado de

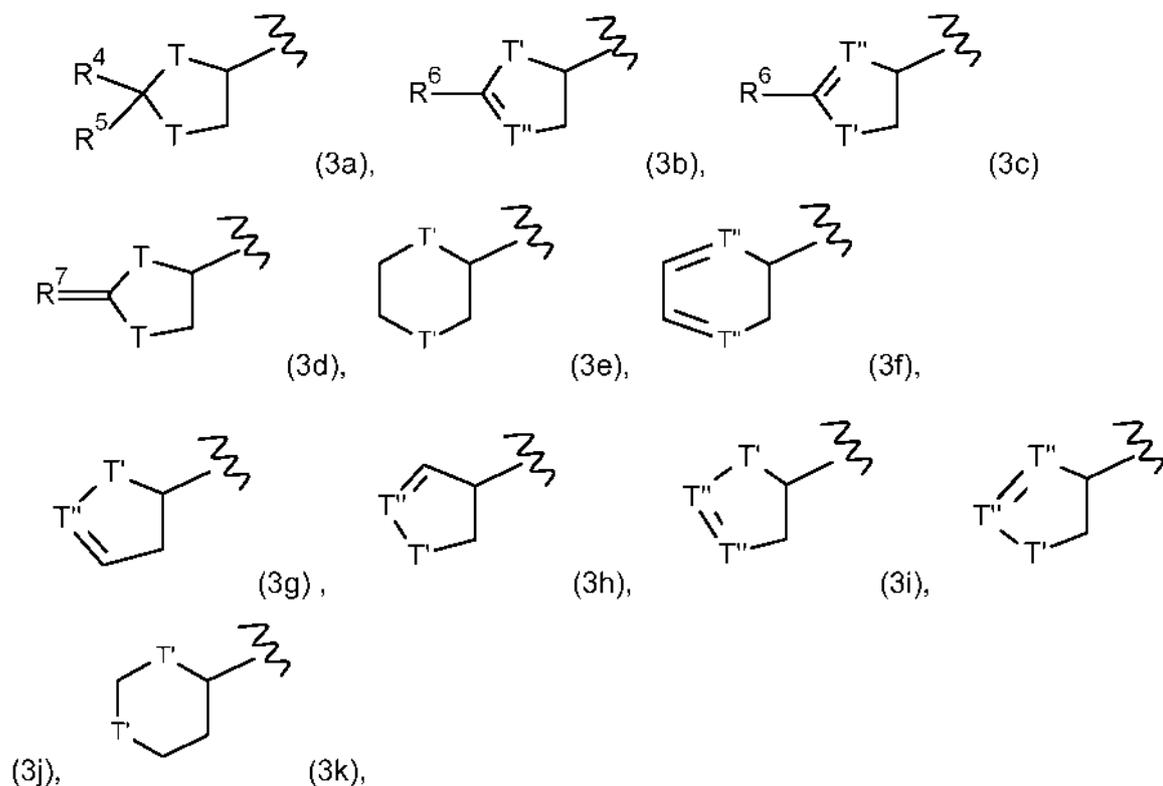


ou

ou derivados dos

mesmos.

[0058] Em algumas modalidades  $R^1$  compreende a fórmula geral 3a a 3k



- com cada T sendo selecionado independentemente um do outro de  $-\text{CH}_2$ ,  $-\text{NH}$ ,  $-\text{S}$ ,  $-\text{O}$ ,  $-\text{CHCH}_3$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)_2$  ou  $-\text{NR}^c$ , em particular, de  $\text{NH}$ ,  $-\text{S}$  ou  $-\text{O}$ , e

- com  $\text{T}'$  sendo selecionado de  $-\text{CH}_2$ ,  $-\text{NH}$ ,  $-\text{S}$ ,  $-\text{O}$ ,  $-\text{CHCH}_3$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)_2$  ou  $-\text{NR}^c$ , e

- com cada  $\text{T}''$  sendo selecionado independentemente um do outro sendo selecionado de  $-\text{CH}$  ou  $=\text{N}$ ,

- com  $\text{R}^4$  e  $\text{R}^5$  sendo selecionados independentemente um do outro de  $-\text{H}$ ,  $-\text{F}$ ,  $-\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{OCH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CHF}_2$ ,  $-\text{CF}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CHF}_2$ ,  $-\text{CH}_2\text{F}$  ou  $-\text{CF}_3$ , em particular, com  $\text{R}^5$  e  $\text{R}^6$  sendo selecionados independentemente um do outro de  $\text{H}$ ,  $-\text{F}$  ou  $-\text{CH}_3$ , e

- com  $\text{R}^6$  sendo selecionado de  $-\text{OH}$ ,  $-\text{OCH}_3$ ,  $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_3$  ou  $\text{H}$ ,

- com  $\text{R}^7$  sendo selecionado de  $=\text{NH}$ ,  $=\text{S}$  ou

=O, em particular, de O, e

- com R<sup>c</sup> sendo -CH<sub>2</sub>OH, -CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>3</sub>.

2. Em algumas modalidades R<sup>1</sup> compreende a fórmula geral 3a a 3k

- com T' do composto de acordo com a fórmula 3a sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>c</sup>, em que, em particular, T' é O, R<sup>4</sup> e R<sup>5</sup> sendo selecionados independentemente um do outro de -H, -F, -CH<sub>3</sub>, em particular, com R<sup>5</sup> e R<sup>6</sup> sendo H,

- com T' do composto de acordo com a fórmula 3b ou 3c sendo selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>c</sup>, em que, em particular, T' é -NH, e T'' sendo selecionado de -CH ou =N, e com R<sup>6</sup> sendo selecionado de -CH<sub>3</sub> ou H, em particular, R<sup>6</sup> é H,

- com cada T do composto de acordo com a fórmula 3d sendo selecionados independentemente um do outro de -NH, -S, -O ou -NR<sup>c</sup>, em particular, pelo menos um T é selecionado de NH ou -NCH<sub>3</sub>, mais particularmente o T na posição 4, com relação à ligação à fração parental, é -NH, e com R<sup>7</sup> sendo selecionado de =NH, =S ou =O, em particular, de O, e

- com T' do composto de acordo com a fórmula 3e sendo selecionado de -CH<sub>2</sub>, -NH, -S ou -O, em particular, T' sendo -NH ou -O,

- com cada T'' do composto de acordo com a fórmula 3f sendo selecionados independentemente um do outro de -CH ou =N, em particular, cada T'' é =N,

- com T' do composto de acordo com a

fórmula 3g ou 3h sendo selecionado de -NH ou -NR<sup>c</sup>, em que, em particular, T' é -NCH<sub>3</sub>, e T" sendo selecionado de -CH ou =N, em particular, de =N,

- com T' do composto de acordo com a fórmula 3i ou 3j sendo selecionado de -NH ou -NR<sup>c</sup>, em que, em particular, T' é -NH, e T" é =N.

[0059] Em algumas modalidades R<sup>1</sup> é selecionado de um C<sub>5</sub> heterociclo substituído ou não substituído ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub> heteroarila substituída ou não substituída, em que, em particular, o C<sub>5</sub> heterociclo substituído ou a C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub> heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>1</sup>

[0060] Em algumas modalidades R<sup>1</sup> é selecionado de um pirano substituído ou não substituído, furano, imidazol, tiofeno, pirrol, piridina, pirazina, tiazol, oxazol, cumarina, benzoimidazol, indol, Isoindol, benzodiazol, benzotriazol, benzoxazol, benzotiazol ou pirazian e derivados dos mesmos, em que, em particular, os compostos substituídos compreendem pelo menos um substituinte Z<sup>1</sup>.

[0061] Em algumas modalidades, R<sup>c</sup> é selecionado de -CH<sub>2</sub>OH, -CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> ou -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, em particular, de -CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> ou -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, mais particularmente R<sup>c</sup> é CH<sub>3</sub>.

[0062] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,

- uma alquenila substituída ou não

substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída.

[0063] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, um substituído ou não substituído C<sub>5</sub>- C<sub>10</sub> heteroarila.

[0064] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila substituída ou não substituída,
- uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila substituída ou não substituída,
- uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila substituída ou não substituída,
- uma C<sub>6</sub> arila substituída ou não substituída, ou
- uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída.

[0065] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula -L-Ar,
- com L sendo
- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,
- uma alquenila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, uma alquinila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>alquinila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>alquinila, e
- Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, ou
- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída,

em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída ou a C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída compreende pelo menos um

substituente  $Z^2$ .

[0066] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de

- uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula  $-L-Ar$ ,

- com L sendo

- uma alquila, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquila, mais particularmente uma  $C_1-C_4$  alquila, e

- Ar sendo uma  $C_5-C_6$ - arila substituída ou não substituída ou uma  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída ou não substituída, ou

- uma  $C_6$ - arila substituída ou não substituída ou uma  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída ou não substituída

[0067] em que, em particular, a  $C_6$ - arila substituída ou a  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte  $Z^2$ .

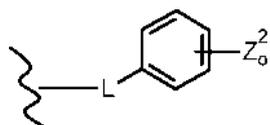
[0068] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula  $-L-Ar$ , com L sendo uma alquila, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquila, mais particularmente uma  $C_1-C_4$  alquila, e Ar sendo uma  $C_5-C_6$ - arila substituída ou não substituída ou uma  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída ou não substituída, em que, em particular, a  $C_6$ - arila substituída ou a  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte  $Z^2$ .

[0069] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de uma  $C_6$ - arila substituída ou não substituída ou uma  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída ou não substituída, em que, em particular, a  $C_6$ - arila substituída ou a  $C_5-C_6$ - heteroarila

substituída compreende pelo menos um substituinte  $Z^2$ .

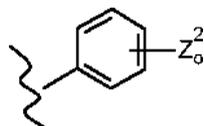
[0070] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula 4a



(fórmula 4a) ou

- uma  $C_6$ -arila substituída ou não substituída, em que a  $C_6$  arila substituída compreende a fórmula 4b



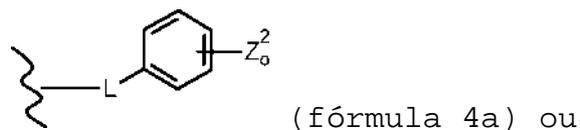
(fórmula 4b)

- com L sendo
- uma alquila, em particular, uma  $C_1$ - $C_{12}$  alquila, mais particularmente uma  $C_1$ - $C_4$  alquila,
- uma alquenila, em particular, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquenila, mais particularmente uma  $C_2$ - $C_4$  alquenila,
- uma alquinila, em particular, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquinila, mais particularmente uma  $C_2$ - $C_4$  alquinila, e
- o de  $Z^2$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e
- cada  $Z^2$  independentemente um do outro  $Z^2$  é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN,  $-R^b$ ,  $-OR^b$ ,  $-(CH_2)_rOR^b$ ,  $-SR^b$ ,  $-(CH_2)_rSR^b$  ou  $-NR^b_2$ , com cada  $R^b$  sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma  $C_1$ - $C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1$ - $C_4$  alquila, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2$ - $C_4$  alquenila, ou uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquinila

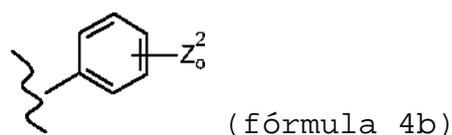
substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[0071] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída em que a alquila substituída compreende a fórmula 4a



- uma C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída compreende a fórmula 4b



- com L sendo uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, e

- o de Z<sup>2</sup><sub>0</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e

- cada Z<sup>2</sup> independentemente um do outro Z<sup>2</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>b</sup>, -SR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[0072] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída

compreende a fórmula 4a, com L sendo uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, e o de Z<sup>2</sup> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada Z<sup>2</sup> independentemente um do outro Z<sup>2</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[0073] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 4a, com L sendo uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, e o de Z<sup>2</sup> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada Z<sup>2</sup> independentemente um do outro Z<sup>2</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[0074] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 4a, com L sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila,

mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,

- uma alquenila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,

- uma alquinila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila,

[0075] e o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 1 e Z<sup>2</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[0076] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 4a, com L sendo uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, e o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 0.

[0077] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 4b, com o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> sendo 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada Z<sup>2</sup> independentemente um do outro Z<sup>2</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[0078] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 4b, com o de  $Z^2_o$  sendo 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^2$  independentemente um do outro  $Z^2$  é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN,  $-R^b$ ,  $-OR^b$ ,  $-(CH_2)_rOR^b$  ou  $-NR^b_2$ , com cada  $R^b$  sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[0079] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 4b, com o de  $Z^2_o$  sendo 1 e  $Z^2$  é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN,  $-R^b$ ,  $-OR^b$ ,  $-(CH_2)_rOR^b$  ou  $-NR^b_2$ , com cada  $R^b$  sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[0080] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 4b, com o de  $Z^2_o$  sendo 0.

[0081] Em algumas modalidades, o de  $Z^2_o$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^2$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^2$  de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -

$R^b$ ,  $-OR^b$ ,  $CH_2OR^b$  ou  $-NR^b_2$ , em particular, de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-R^b$ ,  $-OR^b$ ,  $CH_2OR^b$  ou  $-NR^b_2$ , mais particularmente de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-R^b$ , com cada  $R^b$  sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila.

[0082] Em algumas modalidades, o de  $Z^2_o$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^2$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^2$  de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-I$  ou  $-R^b$ , em particular, de  $R^b$ , com  $R^b$  sendo selecionado de uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila.

[0083] Em algumas modalidades, o de  $Z^2_o$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^2$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^2$  de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-I$  ou  $-R^b$ , em particular, de  $R^b$ , com  $R^b$  sendo selecionado de uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila.

[0084] Em algumas modalidades, o de  $Z^2_o$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^2$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^2$  é selecionado de  $-R^b$ , com  $R^b$  sendo selecionado de uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não

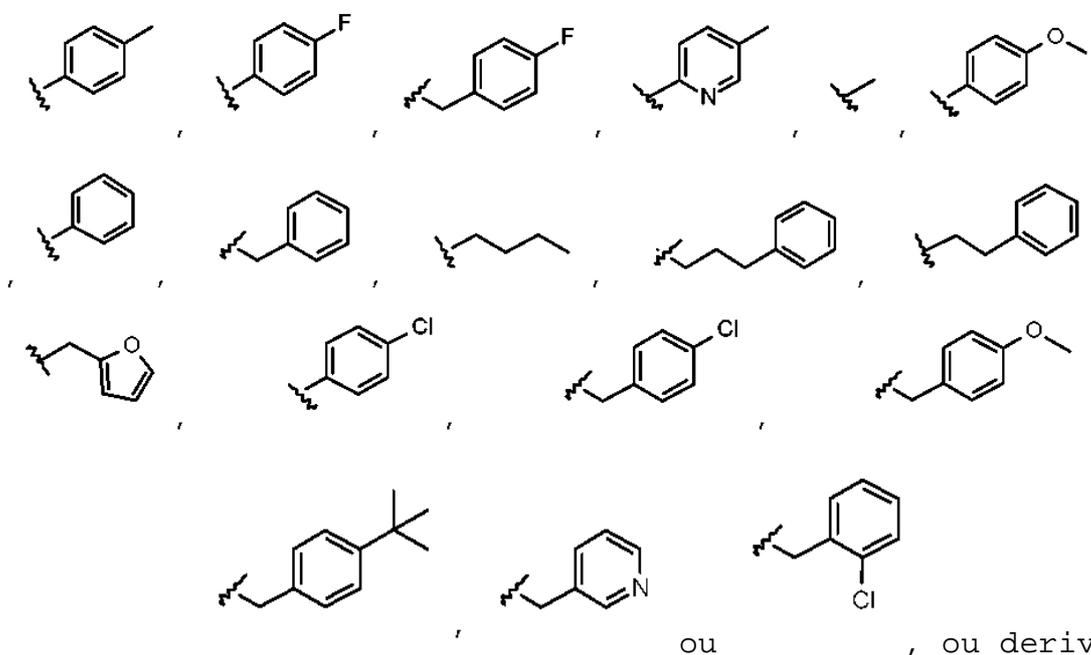
substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila.

[0085] Em algumas modalidades, o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 0 ou 1.

[0086] Em algumas modalidades, o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 1.

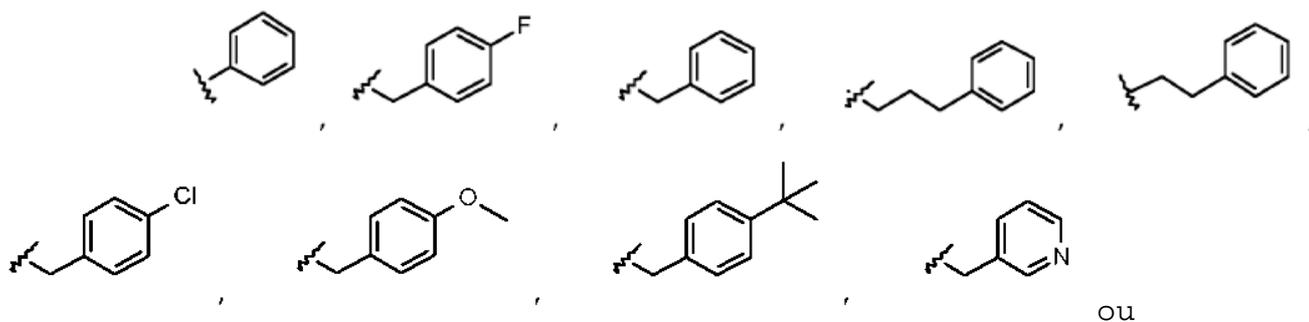
[0087] Em algumas modalidades, o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 0.

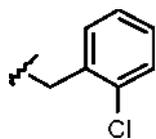
[0088] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de



dos mesmos.

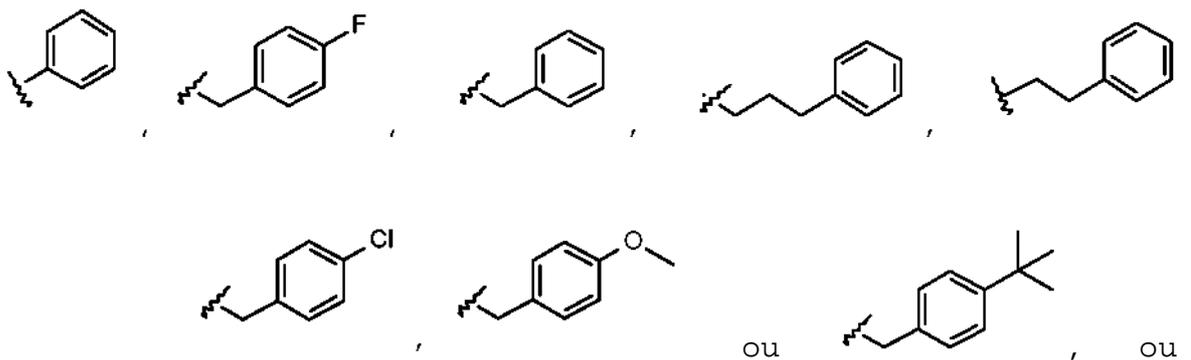
[0089] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de





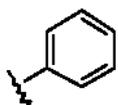
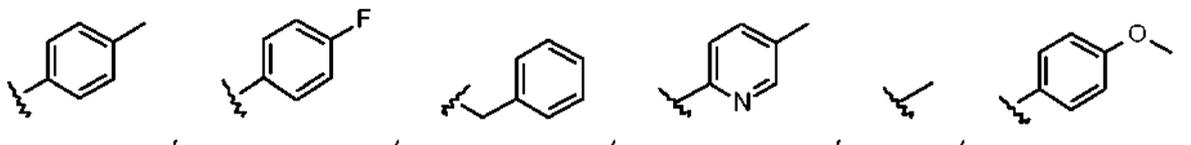
Cl , ou derivados dos mesmos.

[0090] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de



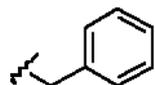
derivados dos mesmos.

[0091] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de



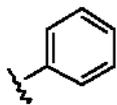
, ou derivados dos mesmos.

[0092] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de



ou derivados dos mesmos.

[0093] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de



ou derivados dos mesmos.

[0094] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1$ - $C_{12}$  alquila substituída ou não substituída,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_3$ - $C_{10}$  cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_6$ - $C_{10}$  arila substituída ou não substituída.

[0095] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1$ - $C_{12}$  alquila substituída ou não substituída,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquinila substituída

ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, um substituído ou não substituído C<sub>5</sub>- C<sub>10</sub> heteroarila.

[0096] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de

- uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila substituída ou não substituída,

- uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma C<sub>6</sub> arila substituída ou não substituída, ou

- uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída.

[0097] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula -D-Ar,

- com D sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma alquenila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, uma alquinila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-

C<sub>4</sub> alquinila, e

- Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, ou

- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída ou a C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>3</sup>.

[0098] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula -D-Ar,

- com D sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, e

- Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, ou

- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída ou a C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>3</sup>.

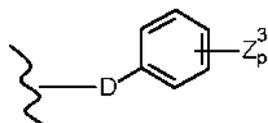
[0099] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula -D-Ar, com L sendo uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, e Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não

substituída, em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída ou a C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>3</sup>.

[00100] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída ou a C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>3</sup>.

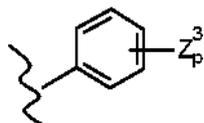
[00101] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula 5a



(fórmula 5a) ou

- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída compreende a fórmula 5b



(fórmula 5b)

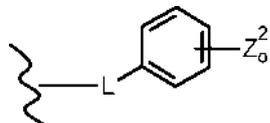
- com D sendo
- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,
- uma alquenila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,
- uma alquinila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e

- p de  $Z^3_p$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e

- cada  $Z^3$  independentemente um do outro  $Z^3$  é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>d</sup>, -OR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>d</sup>, -SR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>d</sup> ou -NR<sup>d</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>d</sup> sendo selecionados independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

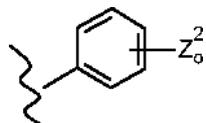
[00102] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída em que a alquila substituída compreende a fórmula 5a



(fórmula 5a) ou

- uma C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída compreende a fórmula 5b



(fórmula 5b)

- com D sendo uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, e

- p de  $Z^3_p$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e

- cada  $Z^3$  independentemente um do outro  $Z^3$  é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>d</sup>, -OR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>d</sup>, -

$SR^d$ ,  $-(CH_2)_rSR^d$  ou  $-NR^d_2$ , com cada  $R^d$  sendo selecionados independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[00103] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 5a, com D sendo uma alquila, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquila, mais particularmente uma  $C_1-C_4$  alquila, e p de  $Z^3_p$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^3$  independentemente um do outro  $Z^3$  é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN,  $-R^d$ ,  $-OR^d$ ,  $-(CH_2)_rOR^d$ ,  $-SR^d$ ,  $-(CH_2)_rSR^d$  ou  $-NR^d_2$ , com cada  $R^d$  sendo selecionados independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[00104] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 5a, com D sendo uma alquila, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquila, mais particularmente uma  $C_1-C_4$  alquila, e p de  $Z^3_p$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^3$  independentemente um do outro  $Z^3$  é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN,  $-R^d$ ,  $-OR^d$ ,  $-(CH_2)_rOR^d$ ,  $-SR^d$ ,  $-(CH_2)_rSR^d$  ou  $-NR^d_2$ , com cada  $R^d$  sendo selecionados independentemente um do outro

de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[00105] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 5a, com D sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,
- uma alquenila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,
- uma alquinila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila,

[00106] e p de Z<sup>3</sup><sub>p</sub> é 1 e Z<sup>3</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>d</sup>, -OR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>d</sup>, -SR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>d</sup> ou -NR<sup>d</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>d</sup> sendo selecionados independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[00107] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 5a, com D sendo uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, e p de Z<sup>3</sup><sub>p</sub> é 0.

[00108] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída

compreende a fórmula 5b, com  $p$  de  $Z^3_p$  sendo 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^3$  independentemente um do outro  $Z^3$  é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN,  $-R^d$ ,  $-OR^d$ ,  $-(CH_2)_rOR^d$ ,  $-SR^d$ ,  $-(CH_2)_rSR^d$  ou  $-NR^d_2$ , com cada  $R^d$  sendo selecionados independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com  $r$  sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular,  $r$  é 1.

[00109] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 5b, com  $p$  de  $Z^3_p$  sendo 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^3$  independentemente um do outro  $Z^3$  é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN,  $-R^d$ ,  $-OR^d$ ,  $-(CH_2)_rOR^d$ ,  $-SR^d$ ,  $-(CH_2)_rSR^d$  ou  $-NR^d_2$ , com cada  $R^d$  sendo selecionados independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com  $r$  sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular,  $r$  é 1.

[00110] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 5b, com  $p$  de  $Z^3_p$  sendo 1 e  $Z^3$  é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN,  $-R^d$ ,  $-OR^d$ ,  $-(CH_2)_rOR^d$ ,  $-SR^d$ ,  $-(CH_2)_rSR^d$  ou  $-NR^d_2$ , com cada  $R^d$  sendo selecionados independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila

substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com  $r$  sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular,  $r$  é 1.

[00111] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 5b,  $p$  de  $Z^3_p$  sendo 0.

[00112] Em algumas modalidades,  $p$  de  $Z^3_p$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^3$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^3$  de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-I$ ,  $CN$ ,  $-R^d$ ,  $-OR^d$ ,  $CH_2OR^d$  ou  $-NR^d_2$ , em particular, de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-R^d$ ,  $-OR^d$ ,  $CH_2OR^d$  ou  $-NR^d_2$ , mais particularmente de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-R^d$ , com cada  $R^d$  sendo selecionados independentemente um do outro de  $H$ , uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila.

[00113] Em algumas modalidades,  $p$  de  $Z^3_p$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^3$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^3$  de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-I$  ou  $-R^d$ , em particular, de  $R^d$ , com  $R^d$  sendo selecionado de uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila.

[00114] Em algumas modalidades,  $p$  de  $Z^3_p$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^3$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^3$  de -F, -Cl, -Br, -I ou  $-R^d$ , em particular, de  $R^d$ , com  $R^d$  sendo selecionado de uma  $C_1$ - $C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1$ - $C_4$  alquila.

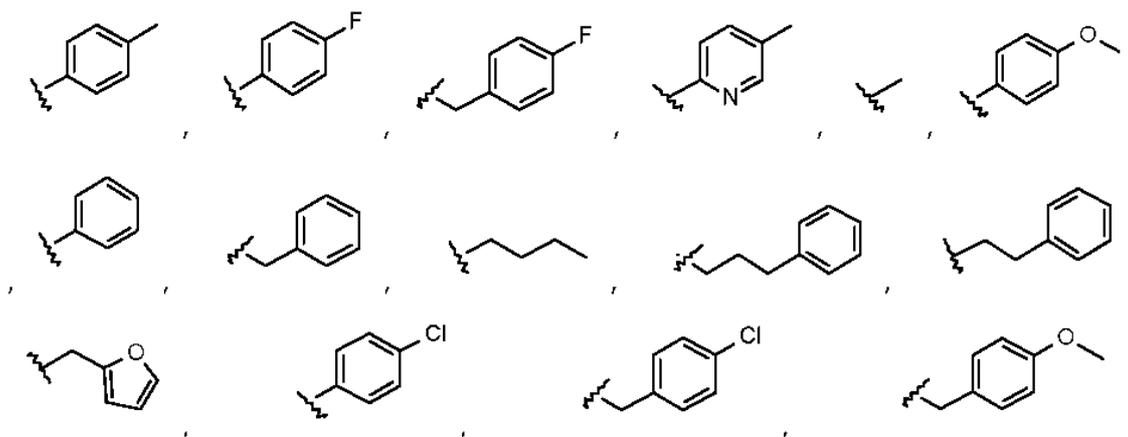
[00115] Em algumas modalidades,  $p$  de  $Z^3_p$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^3$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^3$  é selecionado de  $-R^d$ , com  $R^d$  sendo selecionado de uma  $C_1$ - $C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1$ - $C_4$  alquila.

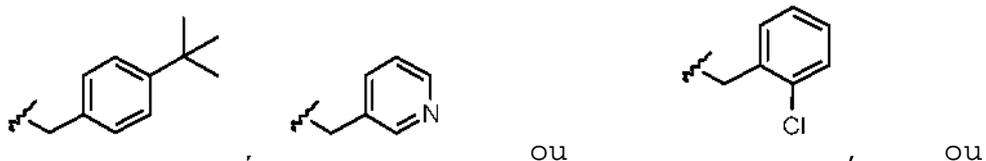
[00116] Em algumas modalidades,  $p$  de  $Z^3_p$  é 0 ou 1.

[00117] Em algumas modalidades,  $p$  de  $Z^3_p$  é 1.

[00118] Em algumas modalidades,  $p$  de  $Z^3_p$  é 0.

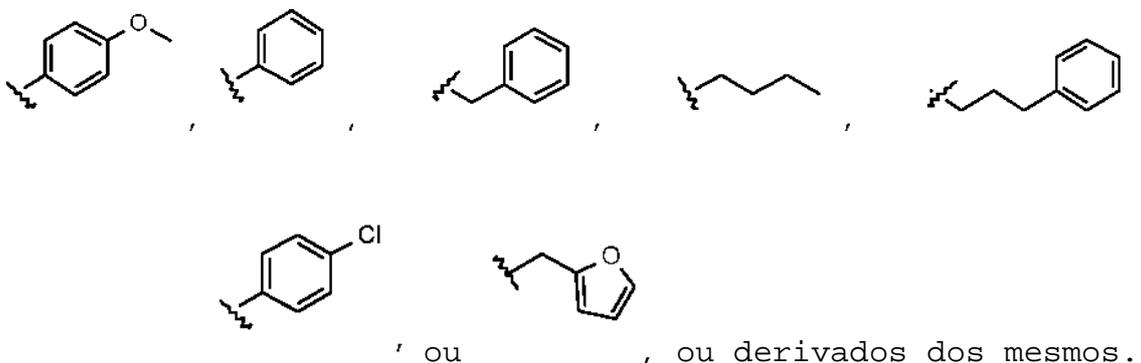
[00119] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de





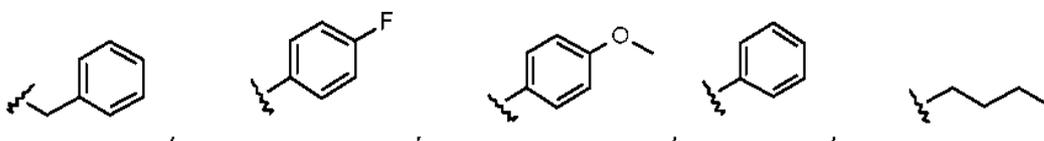
derivados dos mesmos.

[00120] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de

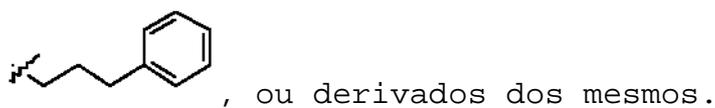


, ou , ou derivados dos mesmos.

[00121] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de



ou



, ou derivados dos mesmos.

[00122] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de

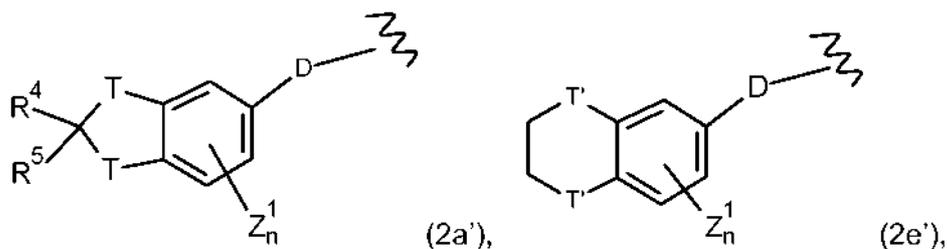


ou derivados dos mesmos.

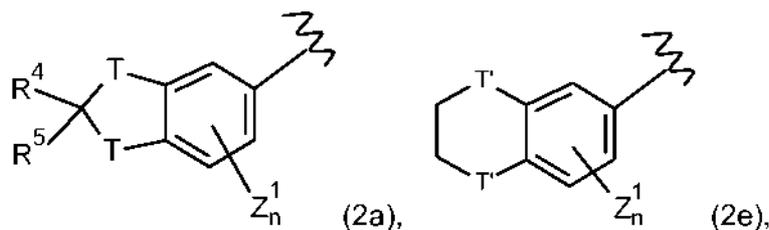
[00123] Qualquer modalidade descrita para  $R^2$  ou  $R^3$  de acordo com o primeiro aspecto da invenção pode ser combinada com qualquer modalidade descrita para  $R^1$  de acordo

com o primeiro aspecto da invenção.

[00124] Em algumas modalidades de um primeiro subaspecto do primeiro aspecto,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2a' ou 2e',



- com D sendo uma C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub> alquila,  
3. ou a fórmula geral 2a ou 2e,



- com cada T sendo selecionado independentemente um do outro de -CH<sub>2</sub>, -NH, -S, -O, -CHCH<sub>3</sub>, -C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> ou -NR<sup>c</sup>, em particular, de NH, -S ou -O, com R<sup>c</sup> sendo -CH<sub>2</sub>OH, -CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>3</sub> e

- com T' sendo selecionado de -CH<sub>2</sub>, -NH, -S, -O, -CHCH<sub>3</sub>, ou -C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> e

- com R<sup>4</sup> e R<sup>5</sup> sendo selecionados independentemente um do outro de -H, -F, -CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -OCH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>F ou -CF<sub>3</sub>, em particular, com R<sup>5</sup> e R<sup>6</sup> sendo selecionados independentemente um do outro de H, -F ou -CH<sub>3</sub>, e

- com n de Z<sub>n</sub><sup>1</sup> sendo 0, 1, 2 ou 3, em

particular,  $n$  de  $Z_n^1$  sendo 0 ou 1, e com cada  $Z^1$  independentemente de qualquer outro  $Z^1$  sendo selecionado de - F, -Cl, -Br, -I, CN,  $-R^a$ ,  $-OR^a$ ,  $-(CH_2)_rOR^a$ ,  $-SR^a$ ,  $-(CH_2)_rSR^a$  ou  $-NR^a_2$ , com cada  $R^a$  sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_8$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_8$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_8$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com  $r$  sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular,  $r$  é 1,

4.  $R^2$  é selecionado de

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_3-C_{10}$  cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_6-C_{10}$  arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo saturado substituído ou não substituído, em particular, um  $C_3-C_{10}$  heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_5-C_{10}$  heteroarila substituída ou não substituída, e

e  $R^3$  é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída,

- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um  $C_1-C_{12}$  alcoxi substituído ou não substituído,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquenila substituída ou não

substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída,

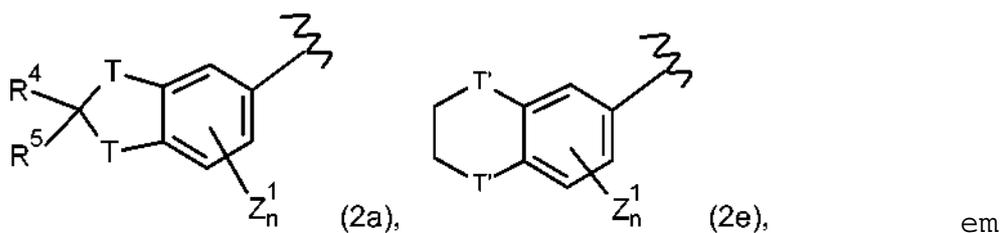
- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_3-C_{10}$  cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_6-C_{10}$  arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo saturado substituído ou não substituído, em particular, um  $C_3-C_{10}$  heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_5-C_{10}$  heteroarila substituída ou não substituída.

[00125] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2a ou 2e,



particular, 2e, com D, T, T', n de  $Z_n^1$ ,  $Z_n^1$ ,  $R^4$  e  $R^5$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente.

[00126] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, T do composto de acordo com a fórmula 2a é selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>c</sup>, em que, em particular, T é O,  $R^4$  e  $R^5$  sendo selecionados independentemente um do outro de -H, -F, -CH<sub>3</sub>, em particular,

com  $R^5$  e  $R^6$

[00127] sendo H, e T' do composto de acordo com a fórmula 2e é selecionado de  $-CH_2$ ,  $-NH$ ,  $-S$  ou  $-O$ , em particular, T' é  $-NH$  ou  $-O$ , mais particularmente O.

[00128] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, n de  $Z_n^1$  é 0, 1 ou 2, em particular, n é 0 ou 1. Em algumas modalidades, n de  $Z_n^1$  é 1. Em algumas modalidades, n de  $Z_n^1$  é 0.

[00129] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, cada  $Z^1$  independentemente de qualquer outro  $Z^1$  é selecionado de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-I$ ,  $CN$ ,  $-R^a$ ,  $-OR^a$ ,  $CH_2OR^a$ , com cada  $R^a$  sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_8$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_8$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_8$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinil

[00130] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, cada  $Z^1$  independentemente de qualquer outro  $Z^1$  é selecionado de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-I$ ,  $CN$ ,  $CH_2OR^a$  ou  $-OR^a$ , com cada  $R^a$  sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_8$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_8$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_8$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila.

[00131] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, cada  $Z^1$  independentemente de qualquer outro  $Z^1$  é selecionado de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-I$ ,  $CN$ ,  $OH$ ,  $CH_2OH$ ,  $CH_2OR^a$  ou  $-OR^a$  com  $R^a$  sendo selecionado de uma  $C_1-C_4$  alquila,

C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, em particular, de uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila.

[00132] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, cada Z<sup>1</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>1</sup> é selecionado de CN, OH, -OCH<sub>3</sub>, -OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -O(CH<sub>2</sub>)CCH, -CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> ou -CH<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)CCH, em particular, de CN, OH, -OCH<sub>3</sub> ou -CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, mais particularmente de -OCH<sub>3</sub> ou -CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>.

[00133] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, R<sup>2</sup> é selecionado de uma C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila substituída ou não substituída, uma C<sub>6</sub> arila substituída ou não substituída, ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-heteroarila substituída ou não substituída.

[00134] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula -L-Ar,

- com L sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,

- uma alquenila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,

- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e

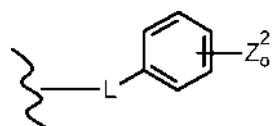
- Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-heteroarila substituída ou não substituída, ou

- uma C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-heteroarila substituída ou não

substituída, em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída ou a C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>2</sup>.

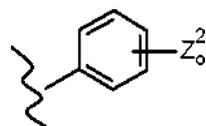
[00135] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula 4a



(fórmula 4a) ou

- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída compreende a fórmula 4b



(fórmula 4b)

- com L sendo
- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,
- uma alquenila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,
- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e
- o de Z<sup>2</sup> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e

cada Z<sup>2</sup> independentemente um do outro Z<sup>2</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>b</sup>, -SR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila

substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[00136] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada Z<sup>2</sup> é selecionado independentemente um do outro Z<sup>2</sup> de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, em particular, de -F, -Cl, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, mais particularmente de -F, -Cl, -R<sup>b</sup>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila,

[00137] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada Z<sup>2</sup> é selecionado independentemente um do outro Z<sup>2</sup> de -F, -Cl, -Br, -I ou -R<sup>b</sup>, em particular, de R<sup>b</sup>, com R<sup>b</sup> sendo selecionado de uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila.

[00138] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 0

[00139] Em algumas modalidades, particularmente

do primeiro subaspecto,  $R^3$  é selecionado de uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{10}$  alquila substituída ou não substituída, uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{10}$  alquenila substituída ou não substituída, uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{10}$  alquinila substituída ou não substituída, uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_3-C_{10}$  cicloalquila substituída ou não substituída, uma arila substituída ou não substituída, em particular, um substituído ou não substituído  $C_6-C_{10}$  arila, uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_5-C_{10}$  heteroarila substituída ou não substituída.

[00140] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto,  $R^3$  é selecionado de uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{10}$  alquila substituída ou não substituída, uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{10}$  alquenila substituída ou não substituída, uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{10}$  alquinila substituída ou não substituída, uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_6-C_{10}$  arila substituída ou não substituída, ou uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_5-C_{10}$  heteroarila substituída ou não substituída.

[00141] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto,  $R^3$  é selecionado de uma  $C_1-C_4$  alquila substituída ou não substituída, uma  $C_1-C_4$  alquenila substituída ou não substituída, uma  $C_1-C_4$  alquinila substituída ou não substituída, uma  $C_6$  arila substituída ou

não substituída, uma C<sub>6</sub>-cicloalquila substituída ou não substituída; ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-cicloalquila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída.

[00142] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, R<sup>3</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula -D-Ar,

- com D sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,

- uma alquenila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,

- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e

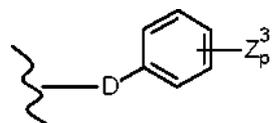
- Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, ou

- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída ou a C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>3</sup>.

[00143] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto, R<sup>3</sup> é selecionado de

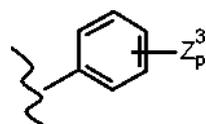
- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou

alquinila compreende a fórmula 5a



(fórmula 5a) ou

- uma C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída compreende a fórmula 5b



(fórmula 5b), em particular, a

fórmula 5b,

- com D sendo
- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,
- uma alquenila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,
- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e
- p de Z<sup>3</sup><sub>p</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e
- cada Z<sup>3</sup> independentemente um do outro Z<sup>3</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>d</sup>, -OR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>d</sup> - SR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>d</sup> ou -NR<sup>d</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>d</sup> sendo selecionados independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

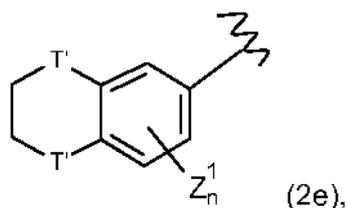
[00144] Em algumas modalidades, particularmente

do primeiro subaspecto,  $p$  de  $Z^3_p$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^3$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^3$  de -F, -Cl, -Br, -I, CN,  $-R^d$ ,  $-OR^d$ ,  $CH_2OR^d$  ou  $-NR^d_2$ , em particular, de -F, -Cl,  $-R^d$ ,  $-OR^d$ ,  $CH_2OR^d$  ou  $-NR^d_2$ , mais particularmente de -F, -Cl,  $-R^d$ , com cada  $R^d$  sendo selecionados independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila.

[00145] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto,  $p$  de  $Z^3_p$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^3$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^3$  de -F, -Cl, -Br, -I ou  $-R^d$ , em particular, de  $R^d$ , com  $R^d$  sendo selecionado de uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila.

[00146] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto,  $p$  de  $Z^3_p$  é 0.

[00147] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro subaspecto,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2e,



[00148] com  $T'$  sendo 0 e  $n$  de  $Z_n^1$  sendo 0, e

[00149]  $R^3$  é selecionado de uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_3-C_{10}$  cicloalquila substituída ou não substituída, mais particularmente ciclohexano  $Z_n^1$ ,  $R^4$  e  $R^5$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente, e

[00150]  $R^2$  é selecionado de

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_3-C_{10}$  cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_6-C_{10}$  arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo saturado substituído ou não substituído, em particular, um  $C_3-C_{10}$  heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_5-C_{10}$  heteroarila substituída ou não substituída, ou

$R^2$  é selecionado de

- uma  $C_3-C_6$  cicloalquila substituída ou não substituída, uma  $C_6$  arila substituída ou não substituída, ou uma  $C_5-C_6$  heteroarila substituída ou não substituída, ou

$R^2$  é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula  $-L-Ar$ ,

- com L sendo

- uma alquila, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquila, mais particularmente uma  $C_1-C_4$  alquila,

- uma alquenila, em particular, uma  $C_1-C_{12}$

alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,

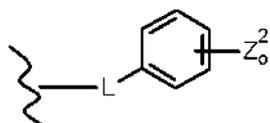
- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e

- Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, ou

- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída ou a C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>2</sup>, ou

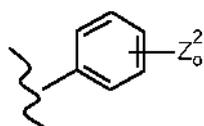
[00151] R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula 4a



(fórmula 4a) ou

- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída compreende a fórmula 4b



(fórmula 4b)

- com L sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,

- uma alquenila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,

- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e

- o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e

- cada Z<sup>2</sup> independentemente um do outro Z<sup>2</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>b</sup>, -SR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1, ou

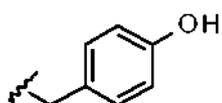
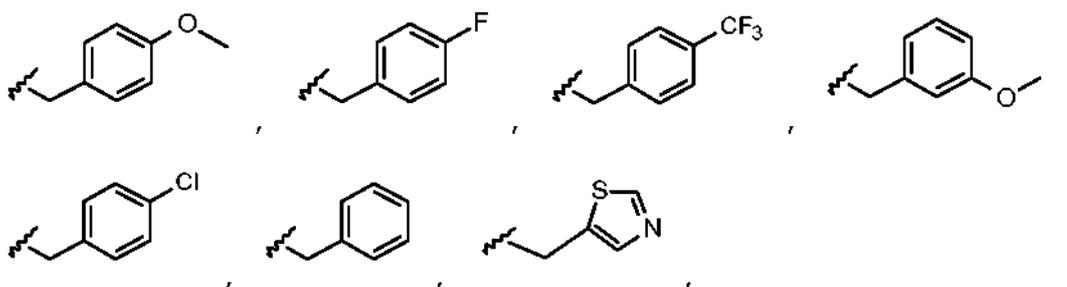
- o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada Z<sup>2</sup> é selecionado independentemente um do outro Z<sup>2</sup> de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, em particular, de -F, -Cl, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, mais particularmente de -F, -Cl, -R<sup>b</sup>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, ou

- o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada Z<sup>2</sup> é selecionado independentemente um do outro Z<sup>2</sup> de -F, -Cl, -Br, -I ou -R<sup>b</sup>, em particular, de R<sup>b</sup>, com R<sup>b</sup> sendo selecionado de uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em

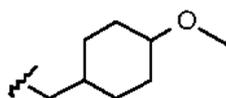
particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila,

- o de Z<sup>2</sup> é O, ou

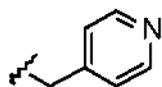
[00152] R<sup>2</sup> é selecionado de



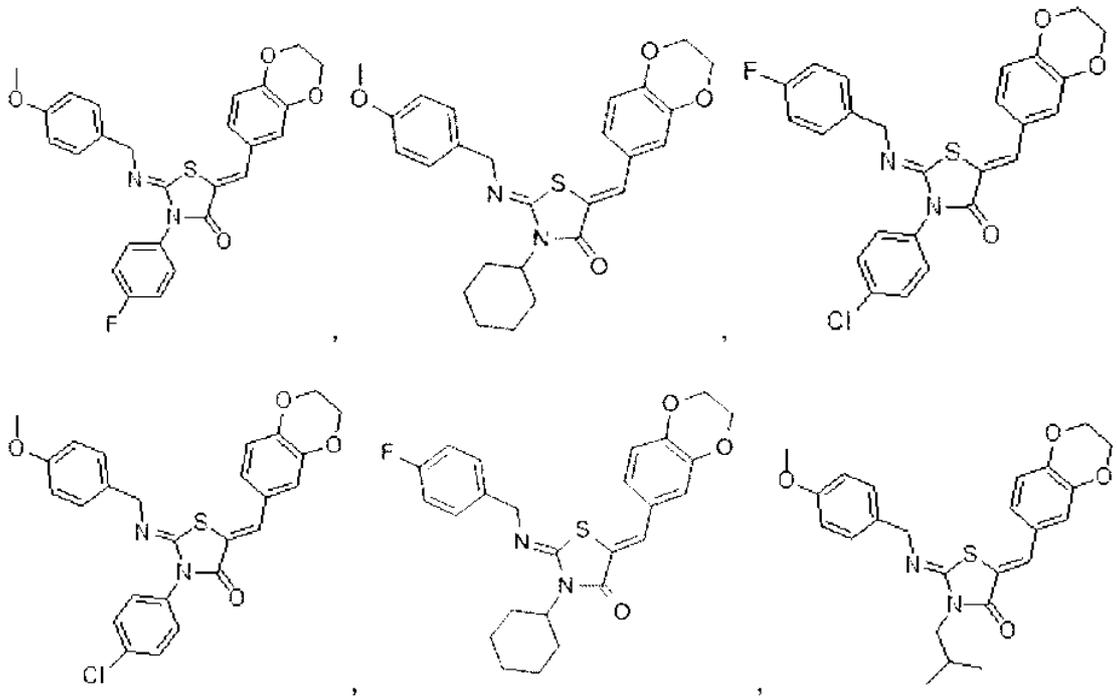
, em que a estrutura é exploratória e OH é na posição orto, para ou meta à posição de união à fração parental,

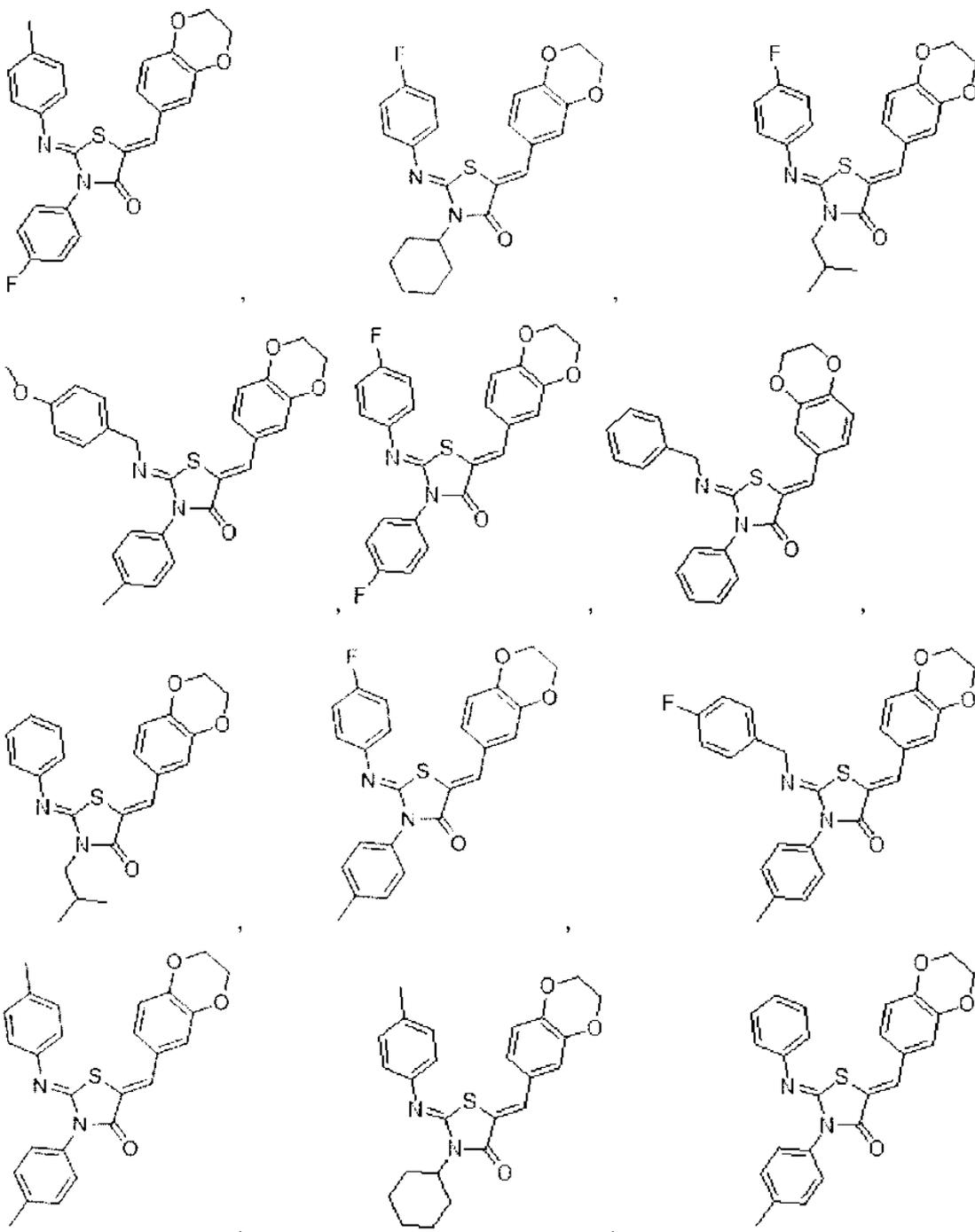


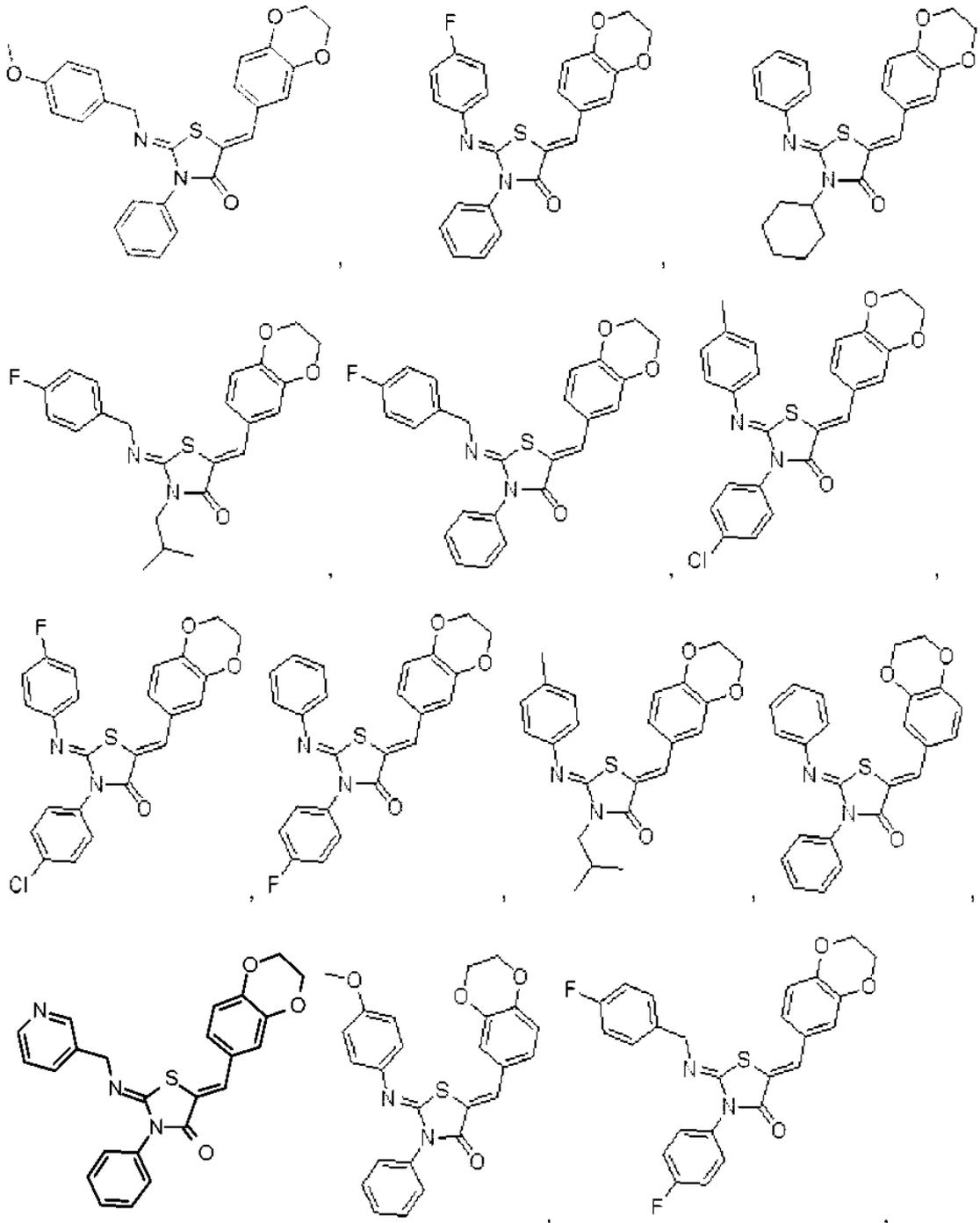
em que a estrutura é exploratória e OCH<sub>3</sub> é na posição orto, para ou meta à posição de união à fração parental,

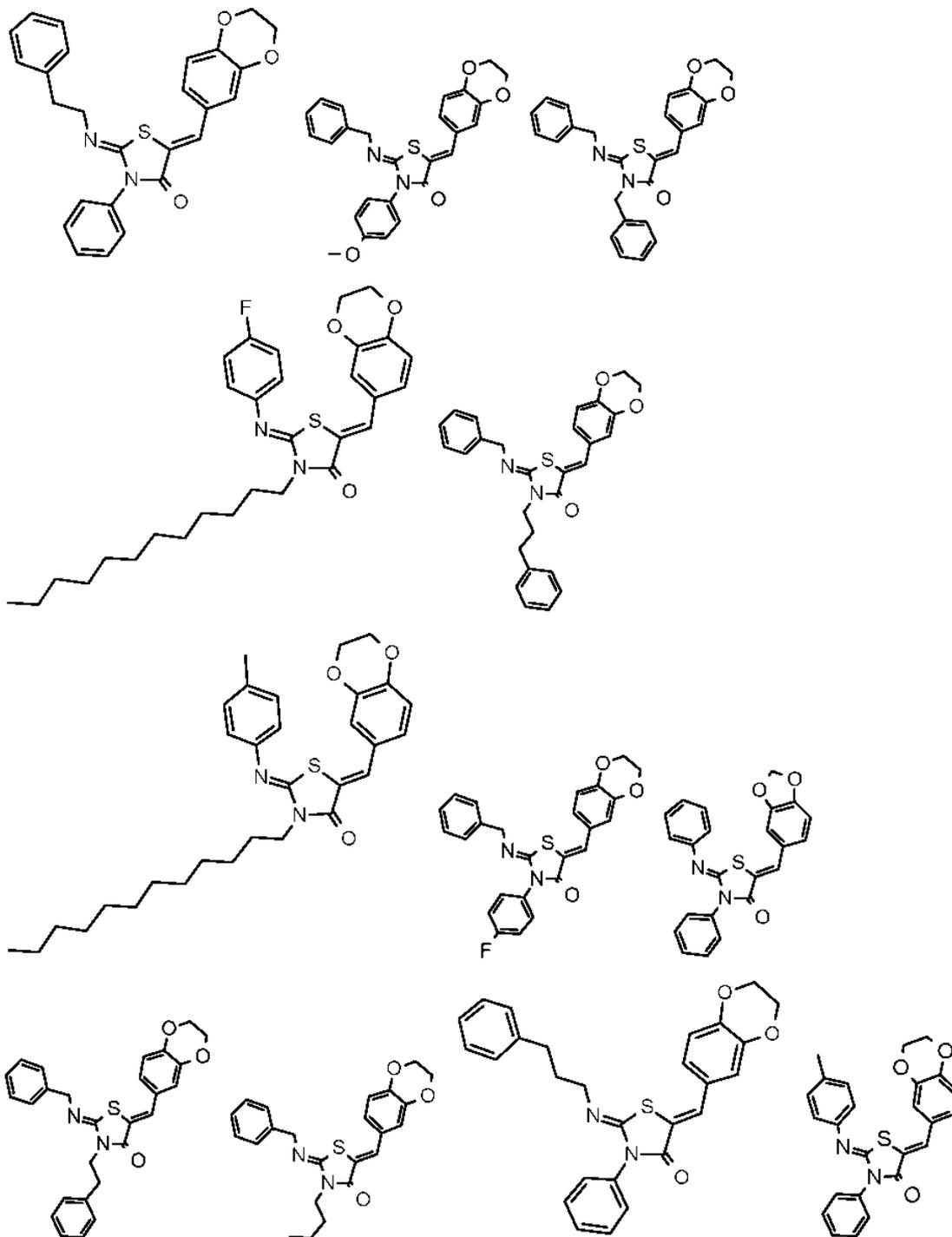


em que a estrutura é exploratória e N é na posição orto, para ou meta à posição de união à fração parental, Modalidades particulares do primeiro subaspecto são:









O nome IUPAC é dado a seguir:

ETI-T-composto	nome IUPAC
----------------	------------

24_Q_B	(2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-3-(4-fluorofenil)-5-((2,3- di hidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_Q_I	(2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-3-ciclohexil-5-((2,3- di hidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_P_L	(2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-3-(4-Clorofenil)-5-((2,3- di hidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_Q_L	(2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-3-(4-Clorofenil)-5-((2,3- di hidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_P_I	(2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-3-ciclohexil-5-((2,3- di hidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_Q_X	(2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzili mino)-5-((2,3-di hidrobenzo[b][1,4]dioxin-6- il)metileno)-3-isobutiltiazolidin-4-ona
24_A_B	(2Z,5Z)-5-(2,3-di hidro-1,4-benzodioxin-6-ilmetileno)-3-(4- fluorofenil)-2-(p-tolilimino)tiazolidin-4-ona
24_B_I	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-3-ciclohexil-5-((2,3- di hidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_B_X	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenili mino)-5-((2,3-di hidrobenzo[b][1,4]dioxin-6- il)metileno)-3-isobutiltiazolidin-4-ona
24_Q_A	(2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzili mino)-5-((2,3-di hidrobenzo[b][1,4]dioxin-6- il)metileno)-3-p-toliltiazolidin-4-ona
24_B_B	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-3-(4-fluorofenil)-5-((2,3- di hidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_C_N	(2Z, 5Z)-2-(benzilimino)-5-((2,3-di hidro benzo[b] [1,4]dioxin-6- il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona
24_N_X	(2Z,5Z)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-isobutil-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona

24_B_A	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenili mino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-p-toliltiazolidin-4-ona
24_P_A	(2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-p-toliltiazolidin-4-ona
24_A_A	(2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-p-toliltiazolidin-4-ona
24_A_I	(2Z,5Z)-3-ciclohexil-5-(2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-ilmetileno)-2-(p-tolilimino)tiazolidin-4-ona
24_N_A	(2Z,5Z)-5-((2,3-dihidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-2-(fenilimino)-3-p-toliltiazolidin-4-ona
24_Q_N	(2Z, 5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-5-((2,3-dihidro benzo[b][1,4]dioxin-7-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona
24_B_N	(2Z, 5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-5-((2,3-dihidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona
24_N_I	(2Z,5Z)-3-ciclohexil-5-((2,3-dihidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
24_P_X	(2Z, 5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-5-((2,3-dihidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-isobutiltiazolidin-4-ona
24_P_N	(2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona
24_A_L	(2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-3-(4-Clorofenil)-5-((2,3-dihidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_B_L	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-3-(4-Clorofenil)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_N_B	(2Z, 5Z)-3-(4-fluorofenil)-5-((2,3-dihidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
24_A_X	(2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-isobutiltiazolidin-4-ona

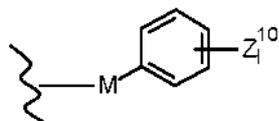
24	(2Z, 5Z)-5-((2,3-di hidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-fenil-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
24_F_N	(2Z,5Z)-2-(4-metoxifenilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona
24_P_B	(2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-3-(4-fluorofenil)-5-((2,3-di hidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_S_N	(2Z,5Z)-2-((piridin-3-il)metilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-7-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona
24_A_N	(2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona
24_K_N	(2Z,5Z)-2-(3-fenilpropilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-7-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona
24_C_G	(2Z,5Z)-2-(benzilimino)-3-butil-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-7-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_C_0	(2Z,5Z)-2-(benzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-7-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona
25	(2Z,5Z)-5-((benzo[d][1,3]dioxol-5-il)metileno)-3-fenil-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
24_C_B	(2Z,5Z)-2-(benzilimino)-3-(4-fluorofenil)-5-((2,3-di hidro benzo[b][1,4]dioxin-7-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_A_V	(2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-3-dodecil-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_C_K	(2Z,5Z)-2-(benzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-7-il)metileno)-3-(3-fenilpropil)tiazolidin-4-ona
24_B_V	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-3-dodecil-5-((2,3-di hidro benzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
24_C_C	(2Z,5Z)-3-benzil-2-(benzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-7-il)metileno)tiazolidin-4-ona

24_C_F	(2Z,5Z)-2-(benzilimino)-5-((2,3-di hidrobenczo[b][1,4]dioxin-7-il)metileno)-3-(4-metoxifenil)tiazolidin-4-ona
24_U_N	(2Z,5Z)-5-((2,3-di hidrobenczo[b][1,4]dioxin-7-il)metileno)-2-(fenetilimino)-3-feniltiazolidin-4-ona

[00153] Qualquer modalidade descrita para R<sup>2</sup> ou R<sup>3</sup> de acordo com o primeiro aspecto da invenção pode ser combinada com qualquer modalidade descrita para R<sup>1</sup> de acordo com o primeiro subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00154] Em algumas modalidades de um segundo subaspecto do primeiro aspecto, R<sup>1</sup> é selecionado de

[00155] - uma alquila substituída, em particular, uma alquila, alquenila ou alquinila substituída, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula 6a

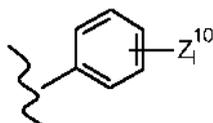


(fórmula 6a) ou

- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída,

- uma C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída compreende a fórmula 6b



(fórmula 6b)

- com M sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,

- uma alquenila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,

- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>alquinila, e

- I de Z<sup>10</sup><sub>1</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e

- cada Z<sup>10</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>10</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>e</sup>, -SR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>e</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

e

R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,

- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo saturado substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

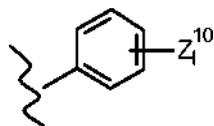
- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída, e

[00156] R<sup>3</sup> é selecionado de uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída, mais particularmente ciclohexano

[00157] Em relação às modalidades de R<sub>1</sub> com relação a um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída, é feita referência às modalidades específicas do primeiro aspecto e o primeiro e terceiro subaspectos da invenção.

[00158] Em algumas modalidades, particularmente do segundo subaspecto, R<sup>1</sup> é selecionado de

- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila compreende a fórmula 6b



(fórmula 6b)

- com M sendo uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, e

- I de Z<sup>10</sup><sub>1</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e

cada Z<sup>10</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>10</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>e</sup>, -SR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>e</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquênica substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquênica, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

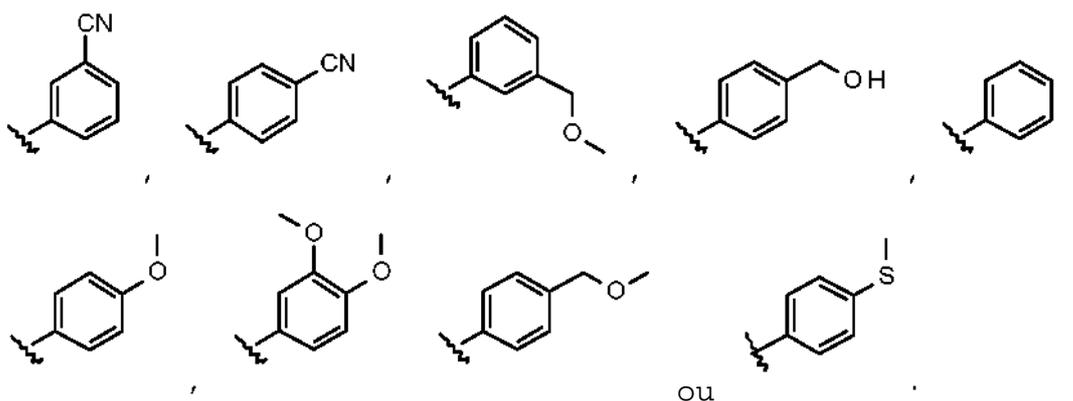
[00159] Em algumas modalidades, particularmente do segundo subaspecto, I de Z<sup>10</sup> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada Z<sup>10</sup> é selecionado independentemente um do outro Z<sup>10</sup> de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>e</sup>, -SR<sup>e</sup>, -CH<sub>2</sub>SR<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, em particular, de -F, -Cl, CN, -R<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, -CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, mais particularmente de CN, -OR<sup>e</sup> ou CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup>, com cada R<sup>e</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquênica substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquênica, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila.

[00160] Em algumas modalidades, particularmente do segundo subaspecto, I de Z<sup>10</sup> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada Z<sup>3</sup> é selecionado independentemente um do outro Z<sup>3</sup> de -F, -Cl,

-Br, -I, CN, -OR<sup>e</sup> ou -CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup>, em particular, de R<sup>e</sup>, com R<sup>e</sup> sendo selecionado de uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila.

[00161] Em algumas modalidades, particularmente do segundo subaspecto, I de Z<sup>1°</sup> é 0, 1 ou 2, em particular, 0 ou 1.

[00162] Em algumas modalidades, particularmente do segundo subaspecto, R<sup>1</sup> é selecionado de.



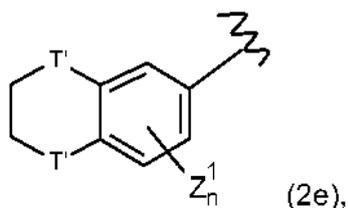
[00163] Em algumas modalidades, particularmente do segundo subaspecto, R<sup>2</sup> é selecionado de uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila substituída ou não substituída, uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquenila substituída ou não substituída, uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquinila substituída ou não substituída, uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída, uma arila

substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída, uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída.

[00164] Em algumas modalidades, particularmente do segundo subaspecto, R<sup>2</sup> é selecionado de uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila substituída ou não substituída, uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquenila substituída ou não substituída, uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquinila substituída ou não substituída, uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída, ou uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída.

[00165] Em algumas modalidades, particularmente do segundo subaspecto, R<sup>2</sup> é selecionado de uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila substituída ou não substituída, uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila substituída ou não substituída, uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila substituída ou não substituída, uma C<sub>6</sub> arila substituída ou não substituída, ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída.

[00166] Em algumas modalidades, particularmente do segundo subaspecto, R<sup>1</sup> compreende a fórmula geral 2e,



[00167] com T' sendo 0 e n de Z<sub>n</sub><sup>1</sup> sendo 0, e

[00168]  $R^3$  é selecionado de uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_3-C_{10}$  cicloalquila substituída ou não substituída, mais particularmente ciclohexano  $Z_n^1$ ,  $R^4$  e  $R^5$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente, e

[00169]  $R^2$  é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída,
- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um  $C_1-C_{12}$  alcoxi substituído ou não substituído,
- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída,
- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída,
- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_3-C_{10}$  cicloalquila substituída ou não substituída,
- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_6-C_{10}$  arila substituída ou não substituída,
- um heterociclo saturado substituído ou não substituído, em particular, um  $C_3-C_{10}$  heterociclo substituído ou não substituído, ou
- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_5-C_{10}$  heteroarila substituída ou não substituída, ou

[00170]  $R^2$  é selecionado de

- uma cicloalquila substituída ou não

substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo saturado substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída, ou

[00171] R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila substituída ou não substituída, uma C<sub>6</sub> arila substituída ou não substituída, ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, ou

[00172] R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula -L-Ar,

- com L sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,

- uma alquenila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,

- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e

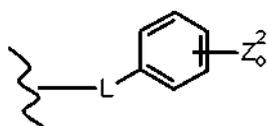
- Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, ou

- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída

ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída ou a C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>2</sup>, ou

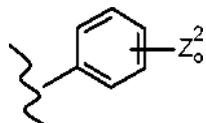
[00173] R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula 4a



(fórmula 4a) ou

- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída compreende a fórmula 4b



(fórmula 4b)

- com L sendo
- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,
- uma alquenila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,
- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e
- o de Z<sup>2</sup> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e
- cada Z<sup>2</sup> independentemente um do outro Z<sup>2</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>b</sup>, -SR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila

substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com  $r$  sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular,  $r$  é 1, ou

- o de  $Z^2_o$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^2$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^2$  de -F, -Cl, -Br, -I, CN,  $-R^b$ ,  $-OR^b$ ,  $CH_2OR^b$  ou  $-NR^b_2$ , em particular, de -F, -Cl,  $-R^b$ ,  $-OR^b$ ,  $CH_2OR^b$  ou  $-NR^b_2$ , mais particularmente de -F, -Cl,  $-R^b$ , com cada  $R^b$  sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, ou

- o de  $Z^2_o$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^2$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^2$  de -F, -Cl, -Br, -I ou  $-R^b$ , em particular, de  $R^b$ , com  $R^b$  sendo selecionado de uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila,

- o de  $Z^2_o$  é 0, ou

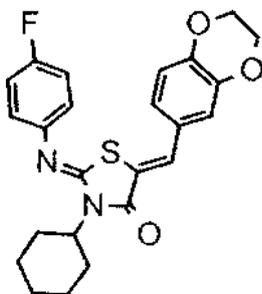
[00174]  $R^2$  é selecionado de



com A sendo  $-(CH)(CH_3)_3$ ,  $-(CH_2)CN$ ,  $-(CH_2)C(=O)ONH_2$ .

$-(\text{CH}_2)\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{CH}_2\text{OH}$ ,  $-(\text{CH}_2)\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ .

[00175] Uma modalidade particular é dada a seguir:



[00176] Em relação às modalidades adicionais de  $\text{R}^2$  é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao primeiro subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00177] Em relação às modalidades adicionais do de  $\text{Z}^2$ , e  $\text{Z}^2$  é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao primeiro subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00178] Em algumas modalidades de um terceiro subaspecto do primeiro aspecto,

[00179] cada de  $\text{R}^2$  e  $\text{R}^3$  são selecionados independentemente um do outro de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $\text{C}_1$ - $\text{C}_{12}$  alquila substituída ou não substituída,
- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um  $\text{C}_1$ - $\text{C}_{12}$  alcoxi substituído ou não substituído,
- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma  $\text{C}_1$ - $\text{C}_{12}$  alquenila substituída ou não substituída,
- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma  $\text{C}_1$ - $\text{C}_{12}$  alquinila substituída ou não

substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

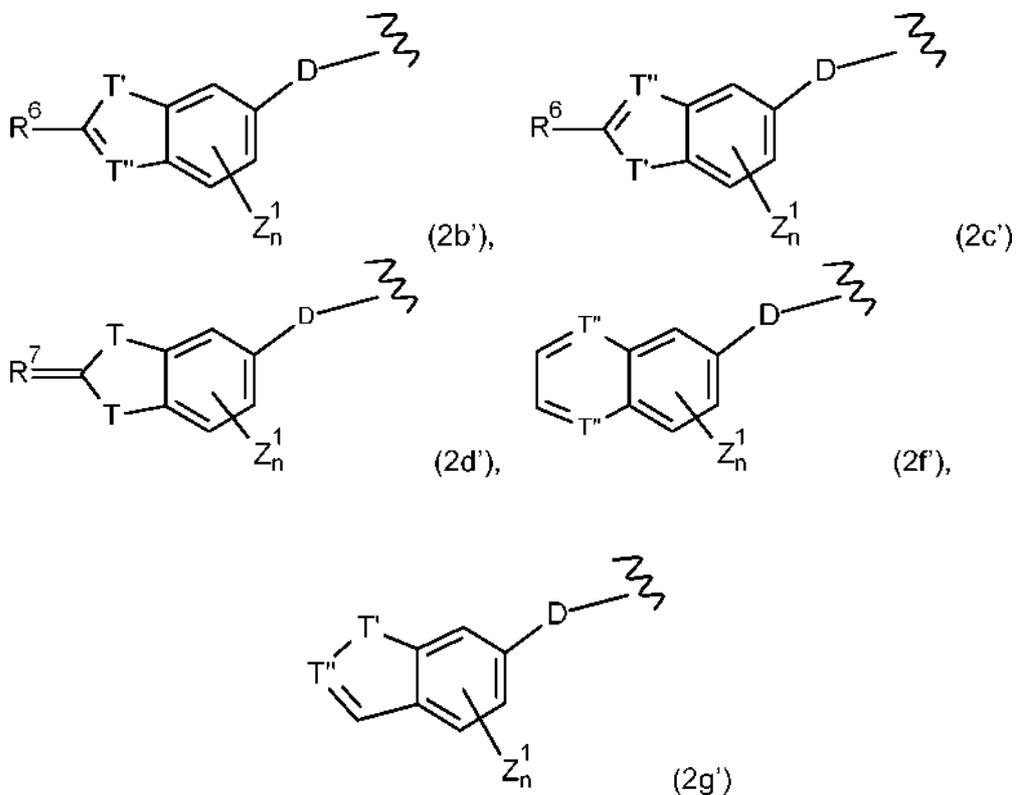
- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo saturado substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

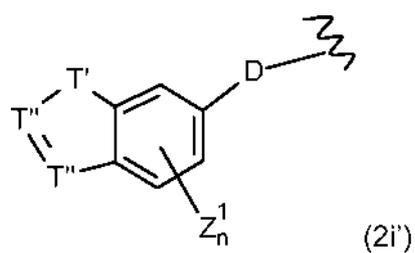
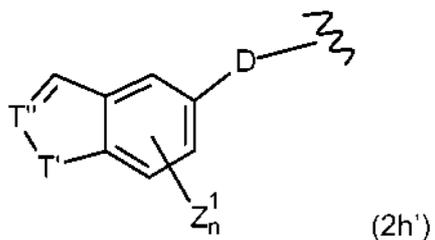
- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída, e

R<sup>1</sup> compreende

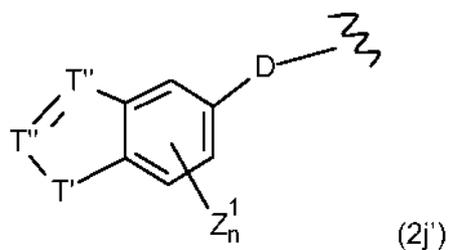
a. a fórmula geral 2b' a 2d' e 2f a 2j',



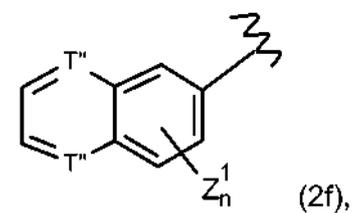
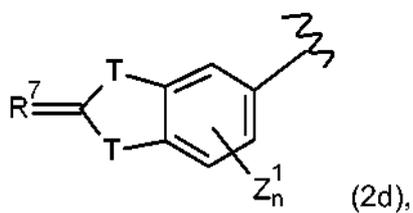
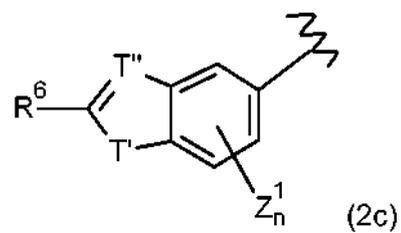
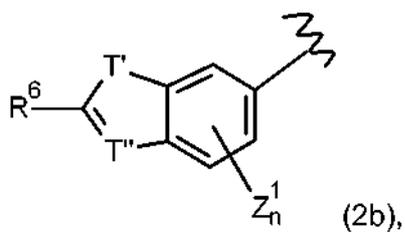
ou

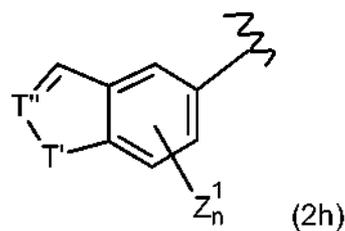
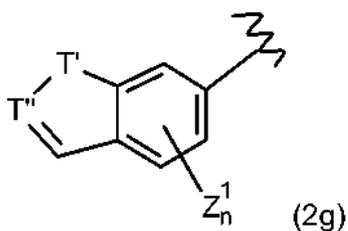


ou

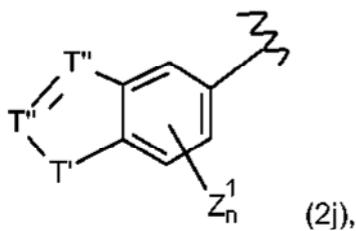
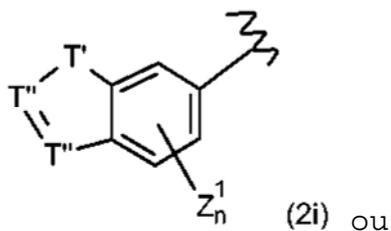


com D sendo uma C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub> alquila, ou R<sup>1</sup> compreende a fórmula geral 2b a 2d e 2f a 2j





ou



- com cada T sendo selecionado independentemente um do outro de  $-\text{CH}_2$ ,  $-\text{NH}$ ,  $-\text{S}$ ,  $-\text{O}$ ,  $-\text{CHCH}_3$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)_2$  ou  $-\text{NR}^c$ , em particular, de  $\text{NH}$ ,  $-\text{S}$  ou  $-\text{O}$ , e

- com  $\text{T}'$  sendo selecionado de  $-\text{CH}_2$ ,  $-\text{NH}$ ,  $-\text{S}$ ,  $-\text{O}$ ,  $-\text{CHCH}_3$ ,  $-\text{C}(\text{CH}_3)_2$  ou  $-\text{NR}^c$ , e

- com cada  $\text{T}''$  sendo selecionado independentemente um do outro sendo selecionado de  $-\text{CH}$  ou  $=\text{N}$ ,

- com  $\text{R}^4$  e  $\text{R}^5$  sendo selecionados independentemente um do outro de  $-\text{H}$ ,  $-\text{F}$ ,  $-\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{OCH}_3$ ,  $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CHF}_2$ ,  $-\text{CF}_2\text{CF}_3$ ,  $-\text{CHF}_2$ ,  $-\text{CH}_2\text{F}$  ou  $-\text{CF}_3$ , em particular, com  $\text{R}^5$  e  $\text{R}^6$  sendo selecionados independentemente um do outro de  $\text{H}$ ,  $-\text{F}$  ou  $-\text{CH}_3$ , e

- com  $\text{R}^6$  sendo selecionado de  $-\text{OH}$ ,  $-\text{OCH}_3$ ,  $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ,  $-\text{CH}_3$  ou  $\text{H}$ ,

- com  $\text{R}^7$  sendo selecionado de  $=\text{NH}$ ,  $=\text{S}$  ou  $=\text{O}$ , em particular, de  $\text{O}$ , e

- com  $n$  de  $\text{Z}_n^1$  sendo 0, 1, 2 ou 3, em particular,  $n$  de  $\text{Z}_n^1$  sendo 0 ou 1, e com cada  $\text{Z}^1$  independentemente de qualquer outro  $\text{Z}^1$  sendo selecionado de  $-\text{F}$ ,  $-\text{Cl}$ ,  $-\text{Br}$ ,  $-\text{I}$ ,  $\text{CN}$ ,  $-\text{R}^a$ ,  $-\text{OR}^a$ ,  $-(\text{CH}_2)_r\text{OR}^a$ ,  $-\text{SR}^a$ ,  $-(\text{CH}_2)_r\text{SR}^a$  ou

$-NR^a_2$ , com cada  $R^a$  sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_8$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_8$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_8$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com  $r$  sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular,  $r$  é 1,

[00180] com  $R^c$  sendo  $-CH_2OH$ ,  $-CH_3$ ,  $-CH_2CH_3$ ,  $-CH_2CH_2CH_3$ ,  $-CH(CH_3)_2$ ,  $-CH_2CF_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CF_2CF_3$ ,  $-CF_3$ .

[00181] Em algumas modalidades, particularmente do terceiro subaspecto,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2b a 2h, em particular, a fórmula 2b, 2c, 2g ou 2h, mais particularmente a fórmula 2b, 2c, 2g ou 2h.

[00182] Em algumas modalidades, particularmente do terceiro subaspecto,  $R^1$  compreende a fórmula geral 2b ou 2c, em particular, 2c.

[00183] Em algumas modalidades, particularmente do terceiro subaspecto,

-  $T'$  do composto de acordo com a fórmula 2b ou 2c é selecionado de  $-NH$ ,  $-S$ ,  $-O$  ou  $-NR^c$ , em que, em particular,  $T'$  é  $S$  ou  $-NH$ , e  $T''$  sendo selecionado de  $-CH$  ou  $=N$ , e com  $R^6$  sendo selecionado de  $-CH_3$  ou  $H$ , em particular,  $R^6$  é  $H$ ,

[00184] cada  $T$  do composto de acordo com a fórmula 2d sendo selecionados independentemente um do outro de  $-NH$ ,  $-S$ ,  $-O$  ou  $-NR^c$ , em particular, pelo menos um  $T$  é selecionado de  $NH$  ou  $-NCH_3$ , mais particularmente o  $T$  na posição 4, com relação à ligação à fração parental, é  $-NH$ , e com  $R^7$  sendo selecionado de  $=NH$ ,  $=S$  ou  $=O$ , em particular, de

O, e

- cada T'' do composto de acordo com a fórmula 2f é selecionado independentemente um do outro de -CH ou =N, em particular, cada T'' é =N,

- T' do composto de acordo com a fórmula 2g ou 2h é selecionado de -NH, -S, -O ou -NR<sup>c</sup>, em que, em particular, T' é -NR<sup>c</sup> ou -NH, e T'' sendo selecionado de -CH ou =N, em particular, T'' é =N,

- T' do composto de acordo com a fórmula 2i ou 2j é selecionado de -NH ou -NR<sup>c</sup>, em que, em particular, T' é -NH, e T'' é =N.

[00185] Em algumas modalidades, particularmente do terceiro subaspecto, R<sup>c</sup> é selecionado de -CH<sub>2</sub>OH, -CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> ou -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, em particular, de -CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> ou -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, mais particularmente R<sup>c</sup> é CH<sub>3</sub>.

[00186] Em relação às modalidades adicionais de n de Z<sup>1</sup><sub>n</sub> e Z<sup>1</sup><sub>n</sub> é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao primeiro subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00187] Em relação às modalidades adicionais de R<sup>2</sup> é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao segundo subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00188] Em relação às modalidades adicionais do de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> e Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao primeiro subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00189] Em relação às modalidades adicionais de R<sup>3</sup> é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao segundo subaspecto de primeiro aspecto da

invenção.

[00190] Em algumas modalidades, particularmente do terceiro subaspecto,  $R^3$  é selecionado de

- uma  $C_1-C_4$  alquila substituída ou não substituída,
- uma  $C_1-C_4$  alquenila substituída ou não substituída,
- uma  $C_1-C_4$  alquinila substituída ou não substituída,
- uma  $C_6$  arila substituída ou não substituída,
- uma  $C_6$ -cicloalquila substituída ou não substituída ou

[00191] uma  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_6$ -cicloalquila substituída ou não substituída ou uma  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída ou não substituída.

[00192] Em relação às modalidades adicionais mais específicas de  $R^3$  é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao segundo subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00193] Em relação às modalidades adicionais de p de  $Z^3_p$  e  $Z^3_p$  é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao primeiro subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00194] Modalidades particulares deste subaspecto são dadas a seguir:

ETI-T-composto	nome IUPAC
04_A_N	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(p-tolilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona

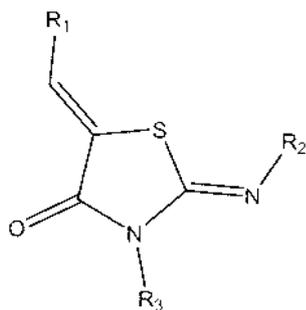
04_B_I	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(4- fluorofenilimino)-3-ciclohexiltiazolidin-4-ona
04_A_X	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(p-tolilimino)-3- isobutiltiazolidin-4-ona
04_F_N	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(4- metoxifenilimino)-3-feniltiazolidin-4-ona
04	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-fenil-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona
03_T_N	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(2- Clorobenzilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
32	(2Z,5Z)-5-((benzo[d]tiazol-6-il)metileno)-3- fenil-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona
03_A_A	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(p- tolilimino)-3-p-toliltiazolidin- 4-ona
32_A_X	(2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-((benzo[d]tiazol-6- il)metileno)-3- isobutiltiazolidin-4-ona
32_A_I	(2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-((benzo[d]tiazol-6- il)metileno)-3- ciclohexiltiazolidin-4-ona
28_A_X	(2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-3-isobutil-5-((1- metil-1H-indazol-5- il)metileno)tiazolidin-4- ona
28_A_I	(2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-3-ciclohexil-5-((1- metil-1H-indazol-5- il)metileno)tiazolidin-4- ona
04_A_A	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(p-tolilimino)-3-p- toliltiazolidin-4-ona
03_P_N	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(4-fluoro benzilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
03_B_X	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(4- fluorofenilimino)-3- isobutiltiazolidin-4-ona
04_C_F	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3-(4- metoxifenil)tiazolidin-4- ona
03_U_N	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2- (fenetilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
28	(2Z,5Z)-5-((1-metil-1H-indazol-5-il)metileno)-3-fenil-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona
04_B_A	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(4- fluorofenilimino)-3-p-toliltiazolidin-4- ona
04_N_G	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-butil-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona

03_C_K	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3-(3- fenilpropil)tiazolidin-4-ona
03_N_K	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(fenilimino)-3-(3- fenilpropil)tiazolidin-4-ona
04_B_X	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(4- fluorofenilimino)-3-isobutiltiazolidin-4-ona
03_N_C	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-benzil-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona
32_B_A	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(4- fluorofenilimino)-3-p-toliltiazolidin-4-ona
03_N_G	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-butil-2- (fenilimino)tiazolidin-4-
03_C_O	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3- fenetiltiazolidin-4-ona
04_N_K	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(fenilimino)-3-(3- fenilpropil)tiazolidin-4-ona
03	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-3-fenil-2-(fenilimino)tiazolidin- 4-ona
03_B_A	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(4- fluorofenilimino)-3-p- toliltiazolidin-4-ona
04_C_B	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3-(4- fluorofenil)tiazolidin-4-ona
04_S_N	(2Z,5Z)-2-((piridin-3-il)metilimino)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5- il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona
03_N_M	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-3-((fu ran-2-il)metil)-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona
32_B_X	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-5-((benzo[d]tiazol-6-il)metileno)-3-isobutiltiazolidin-4-ona
04_P_N	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(4- fluorobenzilimino)-3-feniltiazolidin-4-ona
04_C_G	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3- butiltiazolidin-4-ona
03_F_N	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(4- metoxifenilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
04_C_O	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3- fenetiltiazolidin-4-ona

04_C_K	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3-(3- fenilpropil)tiazolidin-4-ona
04_U_N	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(fenetilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
04_D_N	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(5-metilpiridin-2- ilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
28_B_I	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-3-ciclohexil-5-((1-metil-1H-indazol-5- il)metileno)tiazolidin-4-ona
04_N_M	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-((fu ran-2-il)metil)- 2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona
04_C_N	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
04_C_C	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-benzil-2- (benzilimino)tiazolidin-4-ona
04_N_C	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-benzil-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona
09	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-6-il)metileno)-3-fenil-2- (fenilimino)tiazolidin- 4-ona
03_C_B	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2- (benzilimino)-3-(4- fluorofenil)tiazolidin-4-ona
03_D_N	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(5- metilpiridin-2-ilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
04_C_N	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
28_B_A	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-5-((1-metil-1H-indazol-5- il)metileno)-3-p-toliltiazolidin-4-ona
26	(2Z,5Z)-5-((benzofuran-5-il)metileno)-3-fenil-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona
28_A_A	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-5-((1-metil-1H-indazol-5- il)metileno)-3-p-toliltiazolidin-4-ona
30	(2Z,5Z)-5-((benzo[b]tiofen-5-il)metileno)-3- fenil-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona
03_C_G	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2- (benzilimino)-3-butiltiazolidin- 4-ona

20	6-((13Z)-((Z)-4-oxo-3-fenil-2-(fenilimino)tiazolidin-5-ilideno)metil)benzo[d]oxazol-2(3H)-ona
11	(2Z,5Z)-3-fenil-2-(fenilimino)-5-((quinoxalin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona
04_R_N	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(4-terc-butylbenzilimino)-3-feniltiazolidin-4-ona
31	(2Z,5Z)-5-((benzo[d]tiazol-5-il)metileno)-3-fenil-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
03_E_N	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(metilimino)-3-feniltiazolidin-4-ona
03_A_V	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(p-tolilimino)-3-dodeciltiazolidin-4-ona
16	(2Z,5Z)-5-((2-metilbenzo[d]tiazol-6-il)metileno)-3-fenil-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
17	3-metil-6-((18Z)-((Z)-4-oxo-3-fenil-2-(fenilimino)tiazolidin-5-ilideno)metil)benzo[d]tiazol-2(3H)-ona
21	5-((18Z)-((Z)-4-oxo-3-fenil-2-(fenilimino)tiazolidin-5-ilideno)metil)-1H-benzo[d]imidazol-2(3H)-ona
03_N_F	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-3-(4-metoxifenil)-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
03_Q_N	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(4-metoxibenzilimino)-3-feniltiazolidin-4-ona
03_R_N	(2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(4-terc-butylbenzilimino)-3-feniltiazolidin-4-
04_E_N	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(metilimino)-3-feniltiazolidin-4-ona
04_N_F	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-(4-metoxifenil)-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
04_T_N	(2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(2-clorobenzilimino)-3-feniltiazolidin-4-ona

[00195] De acordo com o segundo aspecto a invenção se refere a um composto caracterizado por uma fórmula geral 1



(fórmula 1)

[00196] em que,  $R^2$  é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1$ - $C_{12}$  alquila substituída ou não substituída,
- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um  $C_1$ - $C_{12}$  alcoxi substituído ou não substituído,
- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída,
- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída,
- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_3$ - $C_{10}$  cicloalquila substituída ou não substituída,
- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_6$ - $C_{10}$  arila substituída ou não substituída,
- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um  $C_3$ - $C_{10}$  heterociclo substituído ou não substituído, ou
- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_5$ - $C_{10}$  heteroarila substituída ou não substituída, e

cada de  $R^1$  e  $R^3$  são selecionados

independentemente um do outro de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,
- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,
- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,
- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,
- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,
- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,
- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou
- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída.

[00197] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de uma fração descrita nas modalidades do primeiro aspecto da invenção em relação ao substituinte R<sup>2</sup>. Referência feita à descrição detalhada acima, com a finalidade de evitar repetição.

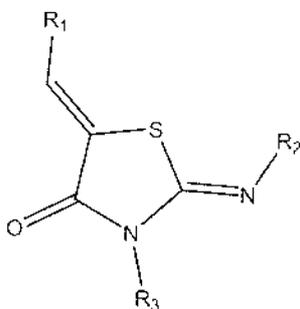
[00198] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> é selecionado de uma fração descrita nas modalidades do primeiro aspecto da

invenção em relação ao substituinte  $R^1$ . Referência feita à descrição detalhada acima, com a finalidade de evitar repetição.

[00199] Em algumas modalidades,  $R^3$  é selecionado de uma fração descrita nas modalidades do primeiro aspecto da invenção em relação ao substituinte  $R^3$ . Referência feita à descrição detalhada acima, com a finalidade de evitar repetição.

[00200] Qualquer modalidade descrita para  $R^1$  ou  $R^3$  de acordo com o segundo aspecto da invenção pode ser combinada com qualquer modalidade descrita para  $R^2$  de acordo com o segundo aspecto da invenção.

[00201] De acordo com o terceiro aspecto a invenção se refere a um composto caracterizado por uma fórmula geral 1



(fórmula 1)

[00202] em que,  $R^3$  é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1$ - $C_{12}$  alquila substituída ou não substituída,
- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um  $C_1$ - $C_{12}$  alcoxi substituído ou não substituído,
- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída,
- uma alquinila substituída ou não substituída,

em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída, e

- cada de R<sup>1</sup> e R<sup>2</sup> são selecionados independentemente um do outro de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,

- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em

particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,  
- um heterociclo substituído ou não substituído,  
em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou  
- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída.

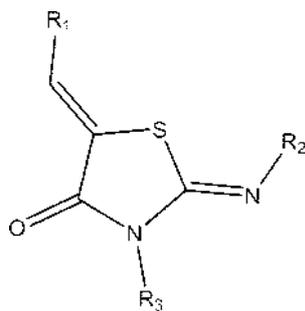
[00203] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de uma fração descrita nas modalidades do primeiro aspecto da invenção em relação ao substituinte R<sup>3</sup>. Referência feita à descrição detalhada acima, com a finalidade de evitar repetição.

[00204] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> é selecionado de uma fração descrita nas modalidades do primeiro aspecto da invenção em relação ao substituinte R<sup>1</sup>. Referência feita à descrição detalhada acima, com a finalidade de evitar repetição.

[00205] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é selecionado de uma fração descrita nas modalidades do primeiro aspecto da invenção em relação ao substituinte R<sup>2</sup>. Referência feita à descrição detalhada acima, com a finalidade de evitar repetição.

[00206] Qualquer modalidade descrita para R<sup>1</sup> ou R<sup>2</sup> de acordo com o terceiro aspecto da invenção pode ser combinada com qualquer modalidade descrita para R<sup>3</sup> de acordo com o terceiro aspecto da invenção.

[00207] De acordo com o quarto aspecto a invenção se refere a um composto compreendendo a seguinte fórmula geral (1)



(fórmula 1)

[00208] em que,  $R^1$  é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1$ - $C_{12}$  alquila substituída ou não substituída,
- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um  $C_1$ - $C_{12}$  alcoxi substituído ou não substituído,
- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída,
- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_2$ - $C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída,
- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_3$ - $C_{10}$  cicloalquila substituída ou não substituída,
- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_6$ - $C_{10}$  arila substituída ou não substituída, e cada de  $R^2$  e  $R^3$  são selecionados independentemente um do outro de
  - uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_1$ - $C_{12}$  alquila substituída ou não substituída,
  - um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um  $C_1$ - $C_{12}$  alcoxi substituído ou não substituído,
  - uma alquenila substituída ou não substituída,

em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída.

[00209] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,

- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, um substituído ou não substituído C<sub>12</sub>-C<sub>12</sub> alquenila,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída

ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída.

5. Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula -M-Ar,

- com M sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,

- uma alquenila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,

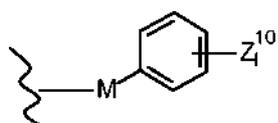
- uma alquinila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e

- Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, ou

- - uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída, em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>10</sup>.

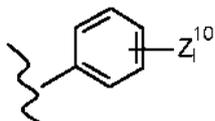
[00210] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula 6a



(fórmula 6a) ou

- uma C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída compreende a fórmula 6b

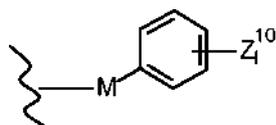


(fórmula 6b)

- com M sendo
- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,
- uma alquenila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,
- uma alquinila, em particular, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>alquinila, mais particularmente uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>alquinila, e
- I de Z<sup>10</sup><sub>1</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e
- cada Z<sup>10</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>10</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>e</sup>, -SR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>e</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

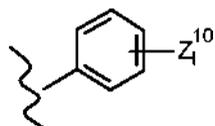
[00211] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 6a



(fórmula 6a) ou

- uma C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila compreende a fórmula 6b

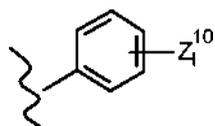


(fórmula 6b)

- com M sendo
- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, e
  - I de Z<sup>10</sup><sub>1</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e
    - cada Z<sup>10</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>10</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>e</sup>, -SR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>e</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> é selecionado de

- uma C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila compreende a fórmula 6b



(fórmula 6b)

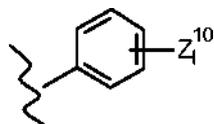
- com I de Z<sup>10</sup><sub>1</sub> sendo 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em

particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e

- cada  $Z^{10}$  independentemente de qualquer outro  $Z^{10}$  é selecionado de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-I$ ,  $CN$ ,  $-R^e$ ,  $-OR^e$ ,  $-(CH_2)_rOR^e$ ,  $-SR^e$ ,  $-(CH_2)_rSR^e$  ou  $-NR^e_2$ , com cada  $R^e$  sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[00212] Em algumas modalidades,  $R^1$  é selecionado de

[00213] - uma  $C_6$ - arila substituída ou não substituída, em que a  $C_6$  arila substituída compreende a fórmula 6b



(fórmula 6b)

- I de  $Z^{10}_1$  é 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 1, 2 ou 3, mais particularmente 1, e

- cada  $Z^{10}$  independentemente de qualquer outro  $Z^{10}$  é selecionado de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-I$ ,  $CN$ ,  $-R^e$ ,  $-OR^e$ ,  $-(CH_2)_rOR^e$ ,  $-SR^e$ ,  $-(CH_2)_rSR^e$  ou  $-NR^e_2$ , com cada  $R^e$  sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma  $C_1-C_{12}$  alquila substituída ou não substituída, em particular,  $C_1-C_4$  alquila, uma  $C_2-C_{12}$  alquenila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquenila, ou uma  $C_2-C_{12}$  alquinila substituída ou não substituída, em particular,  $C_2-C_4$  alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1, em que pelo menos um  $Z^{10}$  é  $-(CH_2)_rOR^e$ , em particular, na posição

3.

[00214] Em algumas modalidades, I de  $Z^{1^{\circ}}$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^{1^{\circ}}$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^{1^{\circ}}$  de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>e</sup>, -SR<sup>e</sup>, -CH<sub>2</sub>SR<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, em particular, de -F, -Cl, CN, -R<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, -CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, mais particularmente de CN, -OR<sup>e</sup> ou CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup>, com cada R<sup>e</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila.

[00215] Em algumas modalidades, I de  $Z^{1^{\circ}}$  é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e cada  $Z^3$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^3$  de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -OR<sup>e</sup> ou -CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup>, em particular, de R<sup>e</sup>, com R<sup>e</sup> sendo selecionado de uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila.

[00216] Em algumas modalidades, I de  $Z^{1^{\circ}}$  é 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 1, 2 ou 3, mais particularmente 1, e cada  $Z^{1^{\circ}}$  é selecionado independentemente um do outro  $Z^{1^{\circ}}$  de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>e</sup>, -SR<sup>e</sup>, -CH<sub>2</sub>SR<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, em particular, de -F, -Cl, CN, -R<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, -CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, mais particularmente de CN, -OR<sup>e</sup> ou CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup>, com cada R<sup>e</sup> sendo

selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila.

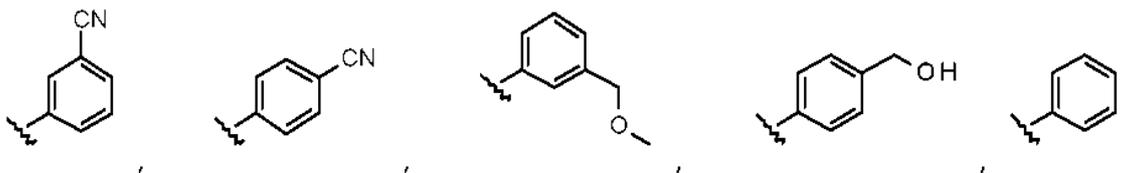
[00217] Em algumas modalidades, I de Z<sup>1°</sup> é 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 1, 2 ou 3, mais particularmente 1, e cada Z<sup>3</sup> é selecionado independentemente um do outro Z<sup>3</sup> de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -OR<sup>e</sup> ou -CH<sub>2</sub>OR<sup>e</sup>, em particular, de R<sup>e</sup>, com R<sup>e</sup> sendo selecionado de uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila.

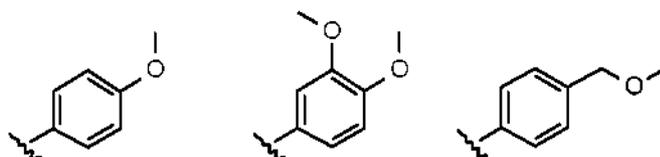
[00218] Em algumas modalidades, I de Z<sup>1°</sup> é 1 ou 2, em particular, 1.

[00219] Em algumas modalidades, I de Z<sup>1°</sup> o pelo menos um Z<sup>1°</sup> é -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>e</sup>, em particular, na posição 3, com R<sup>e</sup> sendo H ou CH<sub>3</sub>, com r sendo selecionado de 1, 2, 3, em particular, com r sendo 1.

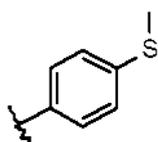
[00220] Em algumas modalidades, I de Z<sup>1°</sup> é 0, 1 ou 2, em particular, 0 ou 1.

[00221] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> é selecionado de.



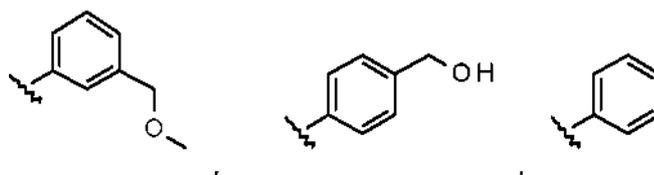


ou

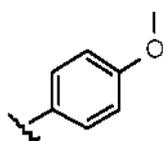


, ou derivados dos mesmos.

[00222] Em algumas modalidades,  $R^1$  é selecionado de.

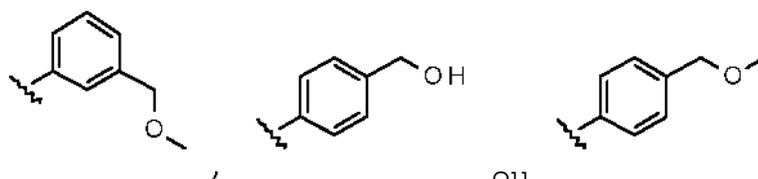


ou



, ou derivados dos mesmos.

[00223] Em algumas modalidades,  $R^1$  é selecionado de



ou

[00224] Em algumas modalidades,  $R^2$  é selecionado de uma fração descrita nas modalidades do primeiro aspecto da invenção em relação ao substituinte  $R^2$ . Referência feita à descrição detalhada acima, com a finalidade de evitar

repetição.

[00225] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> é selecionado de uma fração descrita nas modalidades do primeiro aspecto da invenção em relação ao substituinte R<sup>3</sup>. Referência feita à descrição detalhada acima, com a finalidade de evitar repetição.

[00226] Qualquer modalidade descrita para R<sup>2</sup> ou R<sup>3</sup> de acordo com o quarto aspecto da invenção pode ser combinada com qualquer modalidade descrita para R<sup>1</sup> de acordo com o quarto aspecto da invenção. Modalidades particulares são dadas a seguir:

ETI-T-composto	nome IUPAC
22_K_N	(2Z,5Z)-2-(3-fenilpropilimino)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-3- feniltiazolidin-4-ona
22_A_N	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(p-tolilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
22_B_X	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(4-fluorofenilimino)-3- isobutiltiazolidin-4-ona
22_F_N	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(4-metoxifenilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
22_A_X	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(p-tolilimino)-3- isobutiltiazolidin-4-
22_A_A	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(p-tolilimino)-3-p- toliltiazolidin-4-ona
15_Q_N	(2Z,5Z)-5-(3-(metoximetil)benzilideno)-2-(4-metoxibenzilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
22_B_A	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(4-fluorofenilimino)-3-p- toliltiazolidin-4-ona
22_P_N	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(4-fluorobenzilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
22_C_F	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(benzilimino)-3-(4- metoxifenil)tiazolidin-4-ona
22_N_C	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-3-benzil-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona

15_C_K	(2Z,5Z)-5-(3-(metoximetil)benzilideno)-2-(benzilimino)-3-(3- fenilpropil)tiazolidin-4-ona
22_Q_N	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(4-metoxibenzilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
22	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-3-fenil-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
22_U_N	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(fenetilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
22_N_K	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(fenilimino)-3-(3- fenilpropil)tiazolidin-4-
15	(2Z,5Z)-5-(3-(metoximetil)benzilideno)-3-fenil-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
22_N_G	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-3-butiril-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
22_C_0	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(benzilimino)-3- feniltiazolidin-4-
22_C_G	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(benzilimino)-3- butiltiazolidin-4-ona
22_N_M	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-3-((furan-2-il)metil)-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
22_C_K	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(benzilimino)-3-(3- fenilpropil)tiazolidin-4-
22_D_N	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(5-metilpiridin-2-ilimino)- 3-feniltiazolidin-4-ona
15_C_0	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(benzilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
22_C_N	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(benzilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
15_C_N	(2Z,5Z)-5-(3-(metoximetil)benzilideno)-2-(benzilimino)-3- feniltiazolidin-4-
22_C_B	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(benzilimino)-3-(4- fluorofenil)tiazolidin-4-ona
15_T_N	(2Z,5Z)-2-(2-Clorobenzilimino)-5-(3-(metoximetil)benzilideno)-3- feniltiazolidin-4-ona
22_R_N	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(4-terc-butirilbenzilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
22_C_C	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-3-benzil-2-(benzilimino)tiazolidin-4-ona
23_A_V	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(4-fluorofenilimino)-3- dodeciltiazolidin-4-ona

22_B_V	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(4-fluorofenilimino)-3- dodeciltiazolidin-4-ona
15_U_N	(2Z,5Z)-5-(3-(metoximetil)benzilideno)-2-(fenetilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
34	(2Z,5Z)-5-(4-(metoximetil)benzilideno)-3-fenil-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona
04_A_V	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(p-tolilimino)-3- dodeciltiazolidin-4-ona
15_R_N	(2Z,5Z)-5-(3-(metoximetil)benzilideno)-2-(4-terc-butilbenzilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
22_A_V	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(p-tolilimino)-3- dodeciltiazolidin-4-ona
22_E_N	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-2-(metilimino)-3- feniltiazolidin-4-ona
22_N_F	(2Z,5Z)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-3-(4-metoxifenil)-2- (fenilimino)tiazolidin-4-ona
22_T_N	(2Z,5Z)-2-(2-Clorobenzilimino)-5-(4-(hidroximetil)benzilideno)-3- feniltiazolidin-4-ona

[00227] Em algumas modalidades de um primeiro subaspecto de o quarto aspecto da invenção

[00228] R<sup>1</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,
- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,
- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,
- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,
- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída, e

- cada de R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> são selecionados independentemente um do outro de

- uma alquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída,

- um alcoxi substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alcoxi substituído ou não substituído,

- uma alquenila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída,

- uma alquinila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída,

- uma cicloalquila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila substituída ou não substituída,

- uma arila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> arila substituída ou não substituída,

- um heterociclo saturado substituído ou não substituído, em particular, um C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> heterociclo substituído ou não substituído, ou

- uma heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub> heteroarila substituída ou não substituída,

em que pelo menos um de R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> e R<sub>3</sub> é selecionado de, no caso de R<sub>1</sub>, de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou

alquinila compreende a fórmula -M-Ar,

- com M sendo
- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,
- uma alquenila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,
- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e
- Ar sendo uma C<sub>6</sub>- arila, em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>10</sup>,

no caso de R<sub>2</sub> de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula -L-Ar,
- com L sendo
- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,
- uma alquenila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,
- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e
- Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, ou
- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, em que, em particular, a C<sub>6</sub>- arila substituída ou a C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída compreende pelo menos um

substituente  $Z^2$ , e

no caso de  $R_3$  de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula  $-D-Ar$ ,

- com D sendo

- uma alquila, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquila, mais particularmente uma  $C_1-C_4$  alquila,

- uma alquenila, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquenila, mais particularmente uma  $C_1-C_4$  alquenila,

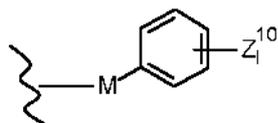
- uma alquinila, em particular, uma  $C_1-C_{12}$  alquinila, mais particularmente uma  $C_1-C_4$  alquinila, e

- Ar sendo uma  $C_5-C_6$ - arila substituída ou não substituída ou uma  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída ou não substituída, ou

- uma  $C_6$ - arila substituída ou não substituída ou uma  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída ou não substituída, em que, em particular, a  $C_6$ - arila substituída ou a  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte  $Z^3$

[00229] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro aspecto de o quarto invenção,  $R^1$  é selecionado de

- uma alquila substituída, alquenila ou alquinila, em que a alquila substituída, alquenila ou alquinila compreende a fórmula 6a



(fórmula 6a) ou

- com M sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,

- uma alquenila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,

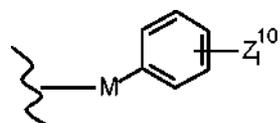
- uma alquinila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>alquinila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>alquinila, e

- I de Z<sup>10</sup><sub>1</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e

cada Z<sup>10</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>10</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>e</sup>, -SR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>e</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1.

[00230] Em algumas modalidades, particularmente do primeiro aspecto de o quarto invenção, R<sup>1</sup> é selecionado de em que R<sup>1</sup> é selecionado de

- uma alquila substituída, em que a alquila substituída compreende a fórmula 6a



(fórmula 6a)

com M sendo

- uma alquila, em particular, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, mais particularmente uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, e

- I de Z<sup>10</sup><sub>1</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, em particular, 0, 1, 2 ou 3, mais particularmente 0 ou 1, e

- cada  $Z^{10}$  independentemente de qualquer outro  $Z^{10}$  é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>e</sup>, -OR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>e</sup>, -SR<sup>e</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>e</sup> ou -NR<sup>e</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>e</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquênica substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquênica, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, em particular, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, em particular, r é 1

Em relação às modalidades adicionais de I de  $Z^{10}$  e  $Z^{10}$  é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao primeiro subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00231] Em relação às modalidades adicionais de  $R^2$  é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao segundo subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00232] Em relação às modalidades adicionais de  $Z^2$  e  $Z^2$  é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao primeiro subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00233] Em relação às modalidades adicionais de  $R^3$  é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao segundo subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00234] Em algumas modalidades, particularmente do terceiro subaspecto,  $R^3$  é selecionado de

- uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila substituída ou não substituída,
- uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquênica substituída ou não

substituída,

- uma  $C_1-C_4$  alquinila substituída ou não substituída,

- uma  $C_6$  arila substituída ou não substituída,

- uma  $C_6$ -cicloalquila substituída ou não substituída ou

- uma  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída ou não substituída, em particular, uma  $C_6$ -cicloalquila substituída ou não substituída ou uma  $C_5-C_6$ - heteroarila substituída ou não substituída.

[00235] Em relação às modalidades adicionais mais específicas de  $R^3$  é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao segundo subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

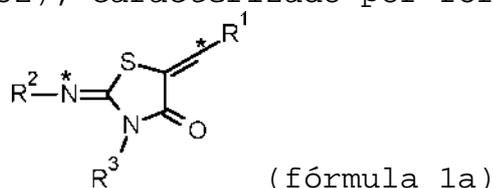
[00236] Em relação às modalidades adicionais de  $p$  de  $Z_p^3$  e  $Z_p^3$  é feita referência ao primeiro aspecto da invenção, particularmente ao primeiro subaspecto de primeiro aspecto da invenção.

[00237] Modalidades particulares são dadas a seguir:

ETI-T-composto	nome IUPAC
23_C_N	(2Z,5Z)-5-benzilideno-2-(benzilimino)-3-feniltiazolidin-4-ona
23_T_N	(2Z,5Z)-2-(2-Clorobenzilimino)-5-benzilideno-3-feniltiazolidin-4-ona
23_Q_N	(2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-5-benzilideno-3-feniltiazolidin-4-ona
23_C_G	(2Z,5Z)-5-benzilideno-2-(benzilimino)-3-butiltiazolidin-4-ona
23_N_K	(2Z,5Z)-5-benzilideno-2-(fenilimino)-3-(3-fenilpropil)tiazolidin-4-ona
23_B_X	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-5-benzilideno-3-isobutiltiazolidin-4-ona
23_C_0	(2Z,5Z)-5-benzilideno-2-(benzilimino)-3-fenetiltiazolidin-4-ona
23_N_M	(2Z,5Z)-5-benzilideno-3-((furan-2-il)metil)-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
23_F_N	(2Z,5Z)-2-(4-metoxifenilimino)-5-benzilideno-3-feniltiazolidin-4-ona
23_A_A	(2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-benzilideno-3-p-toliltiazolidin-4-ona
23	(2Z,5Z)-5-benzilideno-3-fenil-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
23_K_N	(2Z,5Z)-2-(3-fenilpropilimino)-5-benzilideno-3-feniltiazolidin-4-ona
23_A_N	(2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-benzilideno-3-feniltiazolidin-4-ona
23_N_G	(2Z,5Z)-5-benzilideno-3-butil-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
23_N_C	(2Z,5Z)-3-benzil-5-benzilideno-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona
23_P_N	(2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-5-benzilideno-3-feniltiazolidin-4-ona
23_C_B	(2Z,5Z)-5-benzilideno-2-(benzilimino)-3-(4-fluorofenil)tiazolidin-4-ona
23_E_N	(2Z,5Z)-5-benzilideno-2-(metilimino)-3-feniltiazolidin-4-ona
23_C_K	(2Z,5Z)-5-benzilideno-2-(benzilimino)-3-(3-fenilpropil)tiazolidin-4-ona
23_B_V	(2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-5-benzilideno-3-dodeciltiazolidin-4-ona

23_D_N	(2Z,5Z)-2-(5-metilpiridin-2-ilimino)-5-benzilideno-3-feniltiazolidin-4-ona
23_N_L	(2Z,5Z)-5-benzilideno-3-(4-Clorofenil)-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona

[00238] Em algumas modalidades o composto da invenção de acordo com o primeiro, segundo, terceiro ou quarto aspecto da invenção compreende uma forma de isômero (2Z,5Z), (2Z,5E), (2E,5Z) ou (2E,5E), em particular, uma (2Z,5Z) ou (2Z,5E), mais particularmente uma forma de isômero (2Z,5Z), caracterizado por fórmula 1a

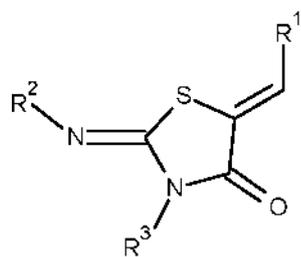


[00239] com o centro de isômero sendo indicado pelo asterisco (\*), com R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> tendo o mesmo significado como definido anteriormente, em que o composto da invenção compreende os isômeros mencionados antes em uma forma essencialmente pura, com R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> tendo o mesmo significado como definido anteriormente.

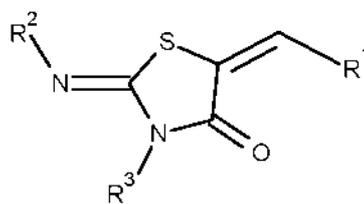
[00240] Como usado no presente documento o termo "essencialmente pura" se refere a uma pureza de > 90 %, em particular, de > 95 %.

[00241] Em algumas modalidades o composto da invenção compreende uma mistura das formas de isômero (2Z,5Z), (2Z,5E), (2E,5Z) ou (2E,5E), em particular, uma mistura de (2Z,5Z) e (2Z,5E). caracterizado pela fórmula 1a como representado acima.

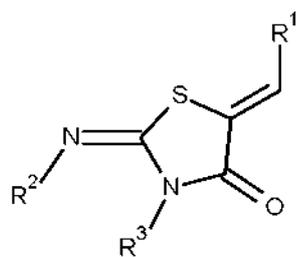
[00242] As seguintes fórmulas mostram a respectiva configuração:



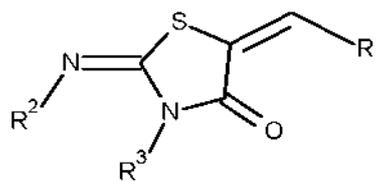
(2Z, 5Z) ;



(2Z, 5E)

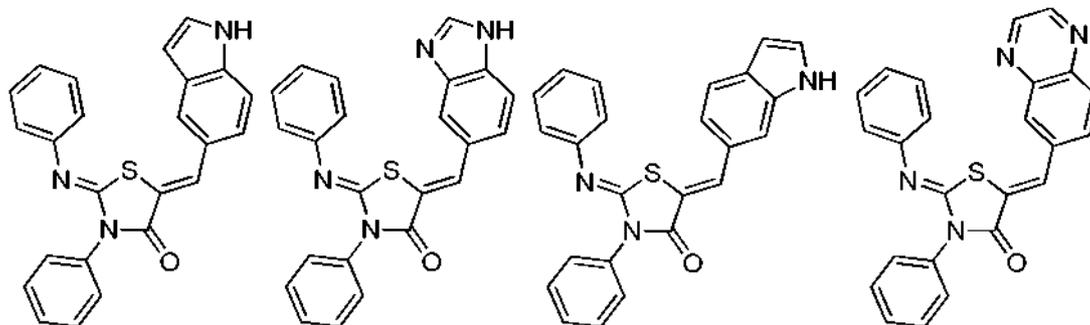


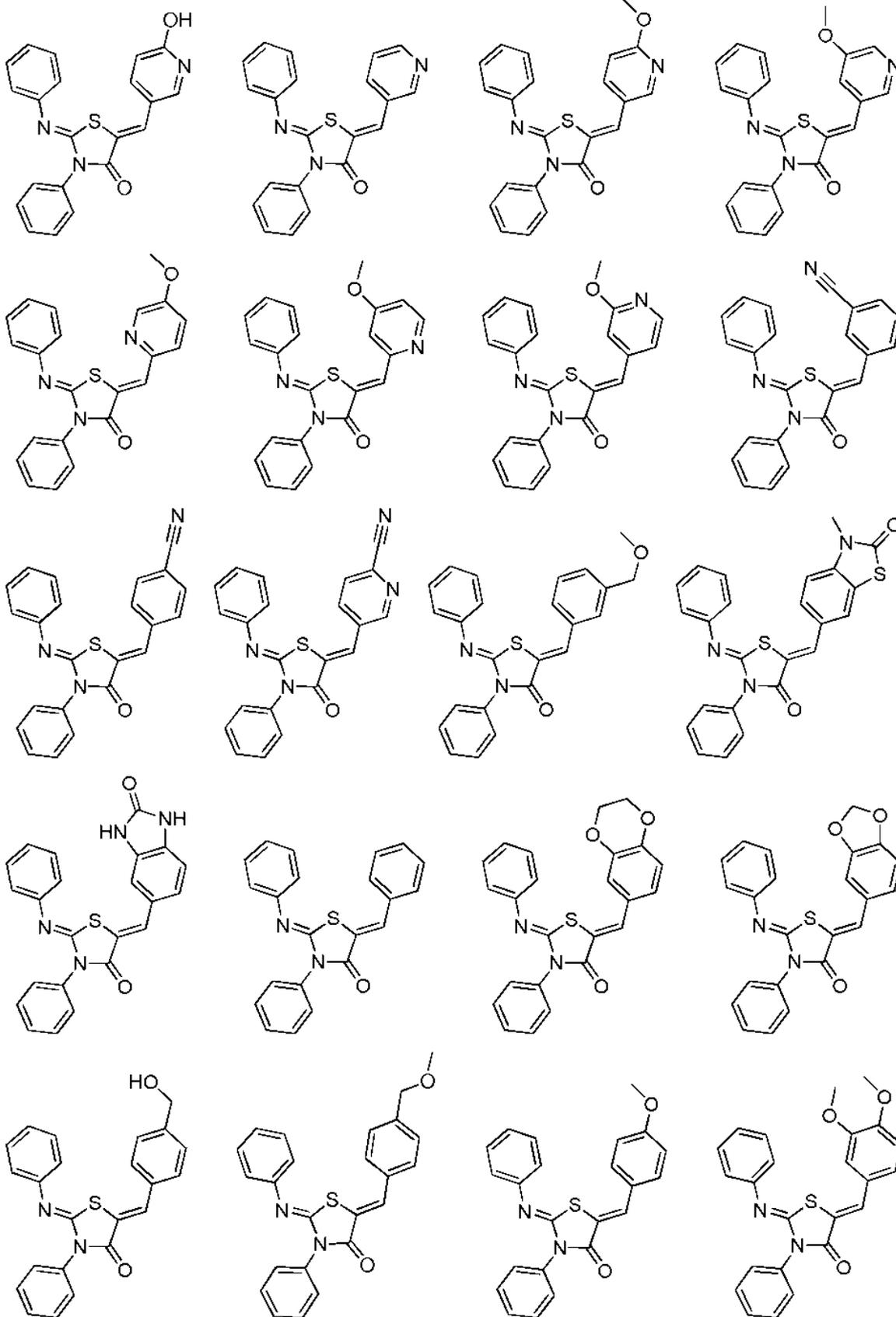
(2E, 5Z),



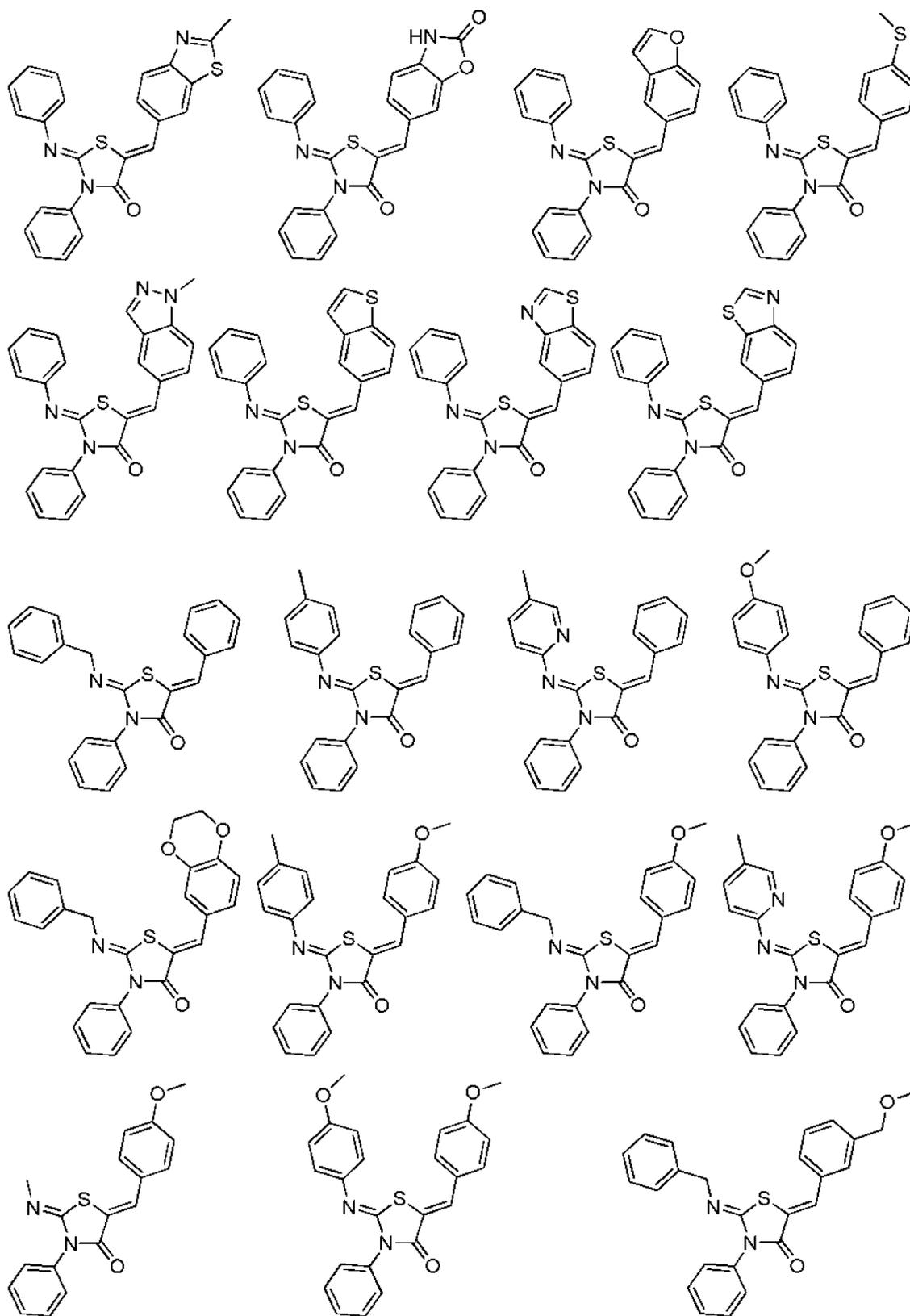
(2E, 5E)

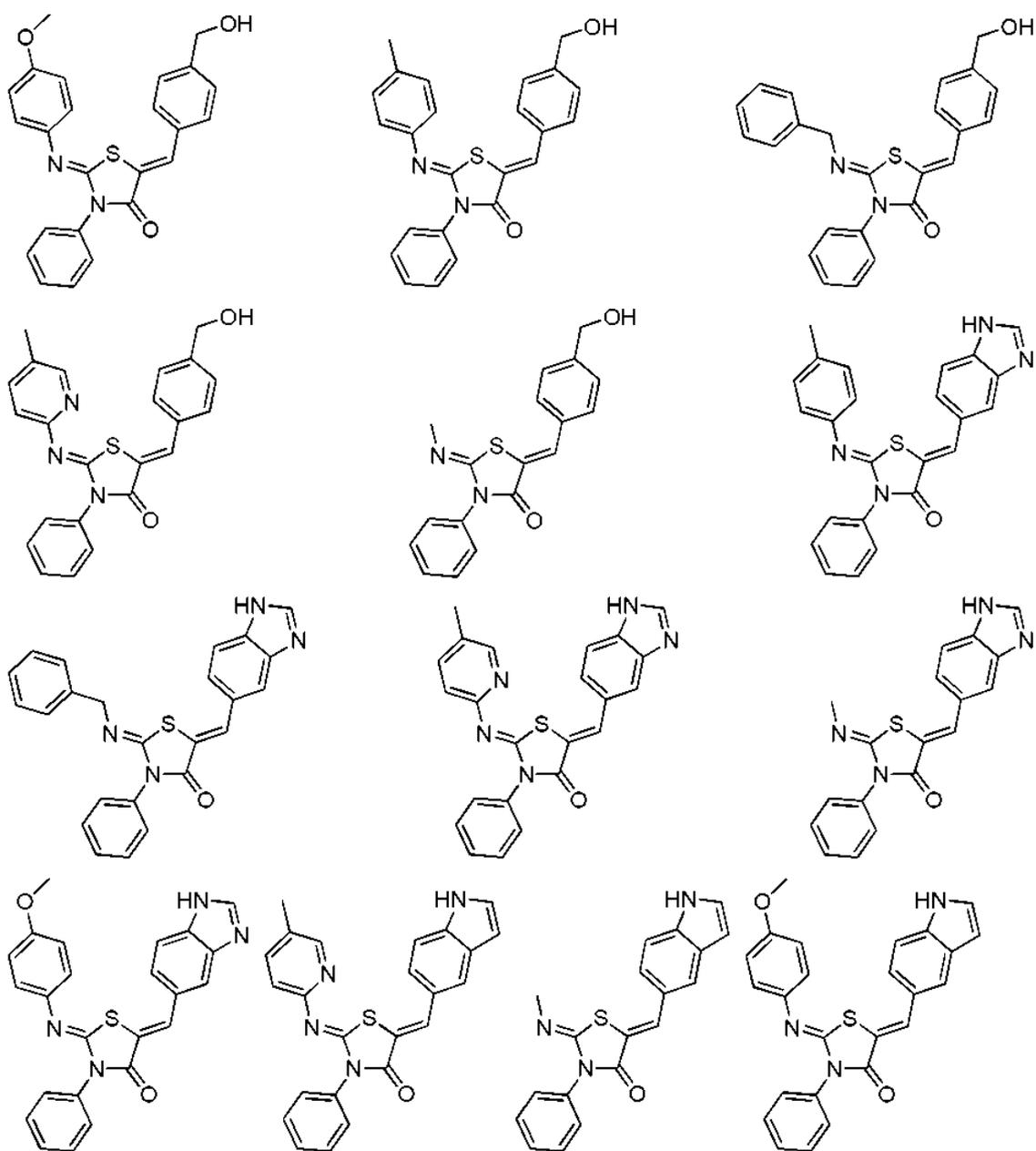
[00243] com  $R^1$ ,  $R^2$  e  $R^3$  tendo o mesmo significado como definido anteriormente. Modalidades particulares da invenção são:

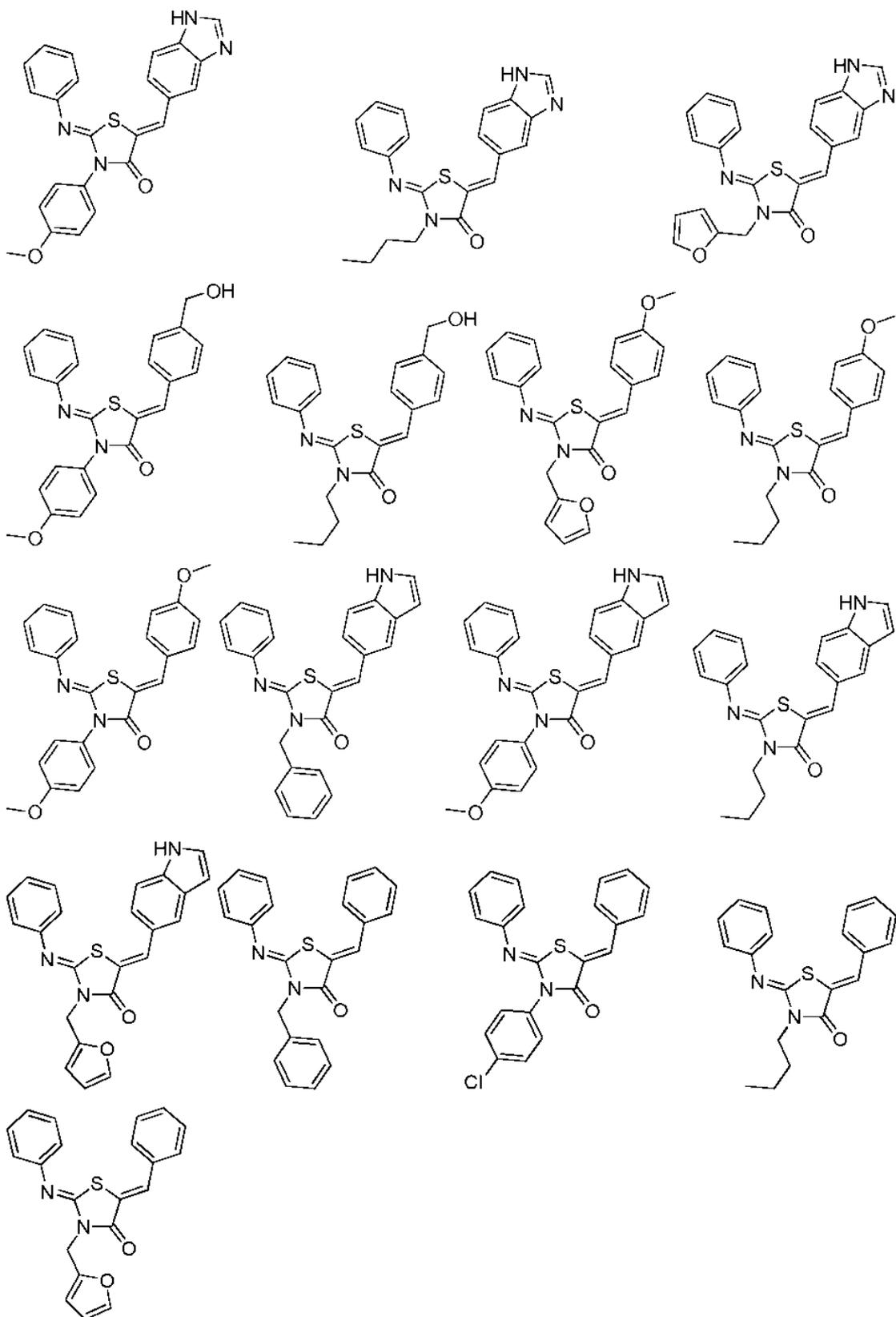












[00244] Um quinto aspecto da invenção se refere a um composto de acordo com o primeiro, segundo, terceiro ou quarto aspecto da invenção para uso como um medicamento.

[00245] Um sexto aspecto da invenção se refere a um composto de acordo com o primeiro, segundo, terceiro ou quarto aspecto da invenção para uso no tratamento de transtornos psiquiátricos ou neurológicos e inflamação, em particular, neuroinflamação.

[00246] Um sétimo aspecto da invenção se refere a uma preparação farmacêutica para uso no tratamento de transtornos psiquiátricos ou neurológicos e inflamação, em particular, neuroinflamação, compreendendo pelo menos um composto de acordo com o primeiro, segundo, terceiro ou quarto aspecto da invenção.

[00247] Os compostos da invenção são potentes inibidores de transporte de membrana celular de AEA e não inibem a enzima metabólica de AEA FAAH. Os compostos da invenção mostram ambos efeitos comportamentais canabimiméticos e efeitos anti-inflamatórios, em particular, um efeito anti-neuroinflamatório, como exemplificado na seção experimental.

[00248] Pela inibição da absorção de AEA o ECS podem ser modulado em uma maneira única, levando a diversas ações farmacológicas como efeitos de analgesia, anti-inflamatórios e sobre o CNS exemplificado pelo efeito tetrad (Nicolussi & Gertsch, 2015, Vitam Horm. 98:441-85.).

[00249] O uso dos compostos da invenção em um método para o tratamento de transtornos psiquiátricos ou neurológicos é relacionado à atenuação de neuroinflamação e sinalização retrógrada neuronal mediada via endocanabinoides

incluindo AEA. Tais doenças incluem doenças bipolares, esquizofrenia, transtornos do sono, esclerose múltipla e doença de Alzheimer (Ashton e Moore Acta Psychiatr Scand. 2011, 124, 250-61.; Aso e Ferrer I, Front Pharmacol. 2014, 5:37.; Correa et al. Vitam Horm. 2009, 81,207-30.)

[00250] Em algumas modalidades, os compostos da fórmula geral (1) podem ser isolados na forma de sais, em particular, na forma de sais farmacologicamente aceitáveis. O mesmo se aplica a todas as modalidades mencionadas antes. Em algumas modalidades, os compostos da fórmula geral (1) podem ser isolados na forma de um tautômero, um hidrato ou um solvato.

[00251] Tais sais são formados, por exemplo, como sais de adição de ácido, preferivelmente com ácidos orgânicos ou inorgânicos, a partir dos compostos da fórmula geral (1) com um átomo de nitrogênio básico, em particular, os sais farmacologicamente aceitáveis são formados de tal modo. Ácidos inorgânicos adequados são, sem estarem limitados a, ácidos de halogênio, tais como ácido clorídrico, ácido sulfúrico, ou ácido fosfórico e semelhantes. Ácidos orgânicos adequados são, sem estarem limitados a, ácidos carboxílico, fosfônico, sulfônico ou sulfâmico e semelhantes. Tais ácidos orgânicos podem ser, sem estarem limitados a, ácido acético, ácido glicólico, ácido láctico, ácido málico, ácido tartárico, ou ácido cítrico. Sais podem também ser formados, por exemplo, como sais com bases orgânicas ou inorgânicas, a partir dos compostos da fórmula geral (1) com um átomo de nitrogênio que carrega um hidrogênio ácido. Exemplos de cátions adequados são - sem estarem limitados a - cátions de sódio, potássio, cálcio ou magnésio, ou cátions de bases de nitrogênio

orgânico, por exemplo, mono, di ou tri-(2- hidroxetil)amina protonada.

[00252] Em vista da estreita relação entre os novos compostos na sua forma livre e aqueles na forma dos seus sais, qualquer referência aos compostos livres acima no presente documento e a seguir no presente documento é para ser entendido como referindo também aos correspondentes sais, como apropriado e expediente. De modo similar, em vista da estreita relação entre os novos compostos da fórmula geral (1) e seus tautômeros, qualquer referência aos compostos da fórmula geral (1) é para ser entendida como referindo também aos correspondentes tautômeros. O mesmo se aplica a um hidrato ou um solvato.

[00253] Em algumas modalidades, a preparação farmacêutica compreende pelo menos um composto de acordo com a invenção como um ingrediente ativo e pelo menos um carreador farmacêuticamente aceitável. Em algumas modalidades, a preparação farmacêutica compreende pelo menos um composto de acordo com a invenção na sua forma livre como um ingrediente ativo. Em algumas modalidades, a preparação farmacêutica compreende pelo menos um composto de acordo com a invenção na sua forma livre como um ingrediente ativo e pelo menos um carreador farmacêuticamente aceitável.

[00254] Em algumas modalidades, a preparação farmacêutica compreende pelo menos um composto de acordo com a invenção na forma de um sal, um tautômero, um sal farmacêuticamente aceitável, um hidrato ou um solvato. Em algumas modalidades, a preparação farmacêutica compreende pelo menos um composto de acordo com a invenção na forma de um sal, um tautômero, um sal farmacêuticamente aceitável, um

hidrato ou um solvato e pelo menos um carreador farmacêuticamente aceitável.

[00255] Além disso, a invenção se refere a preparações farmacêuticas compreendendo pelo menos um composto mencionado antes no presente documento como ingrediente ativo, que pode ser usado especialmente no tratamento das doenças mencionadas. As preparações farmacêuticas podem ser usadas em particular, para um método para o tratamento de transtornos psiquiátricos.

[00256] Em algumas modalidades, as preparações farmacêuticas é para administração enteral, tal como administração nasal, bucal, retal, local ou, especialmente, oral, e para administração parenteral, tal como administração intravenosa, intramuscular ou subcutânea, são especialmente preferidas. As preparações compreendem o ingrediente ativo em separado ou, em particular, juntamente com um carreador farmacêuticamente aceitável. A dosagem do ingrediente ativo depende da doença a ser tratada e da espécie, sua idade, peso, e condição individual, os dados farmacocinéticos individuais, e o modo de administração. Em particular, a aplicação oral do ingrediente ativo é preferida.

[00257] Em algumas modalidades, as preparações farmacêuticas compreendem de aproximadamente 1 % a aproximadamente 95 % ingrediente ativo. Formas farmacêuticas unitária são, por exemplo, comprimidos revestidos e não revestidos, ampolas, viais, supositórios, ou cápsulas. Formas farmacêuticas adicionais são, por exemplo, pomadas, cremes, pastas, espumas, tinturas, batons, gotas, sprays, dispersões, etc. Exemplos são cápsulas contendo de cerca de 0,005 g a cerca de 1,0 g de ingrediente ativo.

[00258] Em algumas modalidades, as preparações farmacêuticas da presente invenção são preparadas de um modo conhecido por si mesmo, por exemplo, por meio de processos convencionais de mistura, granulação, revestimento, dissolução ou liofilização.

[00259] Em algumas modalidades, as preparações farmacêuticas estão na forma de soluções do ingrediente ativo, e também suspensões ou dispersões, especialmente soluções aquosas isotônicas, dispersões ou suspensões que, por exemplo, no caso de preparações liofilizadas compreendendo o ingrediente ativo em separado ou juntamente com um carreador, por exemplo, manitol, podem ser constituídas antes do uso.

[00260] Em algumas modalidades, as preparações farmacêuticas podem ser esterilizadas e/ou podem compreender excipientes, por exemplo, conservantes, estabilizantes, agentes molhantes e/ou emulsificantes, solubilizantes, sais para regular a pressão osmótica e/ou tampões e são preparadas de um modo conhecido por si mesmo, por exemplo, por meio de processos convencionais de dissolução e liofilização. As ditas soluções ou suspensões podem compreender agentes de aumento de viscosidade, tipicamente carboximetilcelulose de sódio, carboximetilcelulose, dextrana, polivinilpirrolidona, ou gelatinas, ou também solubilizantes, por exemplo, Tween 80® (mono-oleato de polioxietileno(20)sorbitano).

[00261] Em algumas modalidades, a preparação farmacêutica compreende suspensões em óleo, que compreendem como o componente óleo um óleo vegetal, sintético, ou semissintético de costume para propósitos de injeção. Em algumas modalidades, a preparação farmacêutica compreende uma

mistura de ésteres de ácido graxo, óleos vegetais tais como, sem estarem limitados a, óleo de semente de algodão, óleo de amêndoa, azeite de oliva, óleo de palma, óleo de sésamo, óleo de soja e óleo amendoim. A fabricação de preparações injetáveis é usualmente levada a cabo sob condições estéreis, como é o enchimento, por exemplo, de ampolas ou viais, e a vedação dos recipientes.

[00262] Carreadores adequados são especialmente cargas, tais como açúcares, por exemplo, lactose, sacarose, manitol ou sorbitol, preparações de celulose, e/ou fosfatos de cálcio, por exemplo, fosfato de tricálcio ou fosfato de hidrogênio e cálcio, e também ligantes, tais como amidos, por exemplo, milho, trigo, arroz ou amido de batata, metilcelulose, hidroxipropil metilcelulose, carboximetilcelulose de sódio, e/ou polivinilpirrolidona, e/ou, se for desejado, desintegrantes, tais como os amidos mencionados acima, também amido de carboximetila, polivinil pirrolidona reticulada, ácido algínico ou um sal do mesmo, tal como alginato de sódio. Excipientes adicionais são especialmente condicionadores de fluxo e lubrificantes, por exemplo, ácido silícico, talco, ácido esteárico ou sais dos mesmos, tais como estearato de magnésio ou cálcio, e/ou polietileno glicol, ou derivados dos mesmos.

[00263] Núcleos de comprimido podem ser proporcionados com revestimentos adequados, opcionalmente entéricos, através do uso de, entre outros, soluções de açúcar concentradas que podem compreender goma arábica, talco, polivinilpirrolidona, polietileno glicol e/ou dióxido de titânio, ou soluções de revestimento em solventes orgânicos adequados ou misturas de solventes, ou, para a

preparação de revestimentos entéricos, soluções de preparações de celulose adequadas, tais como ftalato de acetilcelulose ou ftalato de hidroxipropilmetilcelulose. Corantes ou pigmentos podem ser adicionados aos comprimidos ou revestimentos de comprimido, por exemplo, para propósitos de identificação ou para indicar diferentes doses de ingrediente ativo.

[00264] Em algumas modalidades, a preparação farmacêutica que é adequada para administração oral também incluem cápsulas duras que consistem em gelatina, e também cápsulas moles, vedadas que consistem em gelatina e um plastificante, tal como glicerol ou sorbitol. As cápsulas duras podem conter o ingrediente ativo na forma de grânulos, por exemplo, em mistura com cargas, tais como amido de milho, ligantes, e/ou deslizantes, tais como talco ou estearato de magnésio, e opcionalmente estabilizantes. Em cápsulas moles, o ingrediente ativo é preferivelmente dissolvido ou suspenso em excipientes líquidos adequados, tais como óleos graxos, óleo de parafina ou polietileno glicóis líquidos ou ésteres de ácido graxo de etileno ou propileno glicol, aos quais estabilizantes e detergentes, por exemplo, do tipo éster de ácido graxo de polioxi etileno sorbitano, podem também ser adicionados.

[00265] Em algumas modalidades, a preparação farmacêutica que é adequada para administração retal são, por exemplo, supositórios que consistem em uma combinação do ingrediente ativo e um base de supositório. Bases de supositório adequadas são, por exemplo, triglicerídeos naturais ou sintéticos, hidrocarbonetos de parafina, polietileno glicóis ou alcanóis de cadeia longa.

[00266] Em algumas modalidades, a preparação farmacêutica é adequada para administração parenteral, soluções aquosas de um ingrediente ativo na forma solúvel em água ou suspensões aquosas de injeção que contêm substâncias de aumento de viscosidade, por exemplo, carboximetilcelulose de sódio, sorbitol e/ou dextrana, e, se for desejado, estabilizantes, são especialmente adequados. O ingrediente ativo, opcionalmente juntamente com excipientes, pode também ser na forma de um liofilizado e pode ser feito em uma solução antes da administração parenteral pela adição de solventes adequados. Soluções tais como são usados, por exemplo, para administração parenteral pode também ser utilizado como soluções de infusão. Conservantes preferidos são, por exemplo, antioxidantes, tais como ácido ascórbico, ou microbicidas, tais como ácido sórbico ou ácido benzoico.

[00267] Métodos Gerais e Materiais

[00268] Compostos e produtos químicos eram do grau de pureza mais alto possível. Anandamida (AEA), (R)-N-(1-(4-hidroxifenil)-2-hidroxietil)oleamida (OMDM-2), N-(3-furanilmetil)-(5Z,8Z,11Z,14Z)-eicosatetraenamida (UCM707), [etanolamina-1-3H]-AEA (60 Ci/mmol) foi comprado de American Radiolabeled Chemicals. Albumina de soro bovino essencialmente livre de ácido graxo (BSA) (A7030), soro bovino fetal (F7524), RPMI-1640 foram comprados de Sigma-Aldrich, Alemanha. O fluido de siliconização AquaSil™ foi comprado de Thermo Scientific.

#### Absorção celular de [<sup>3</sup>H]-AEA

[00269] O rastreamento para inibição de absorção celular de AEA foi realizado em um procedimento semi-automatizado: Etapas de pipetagem e lavagem foram realizadas

por uma estação de trabalho de laboratório Biomek3000. Primeiro, quantidades requeridas de células U937 foram centrifugadas a 100 x g por 5 min e ressuspensas em RPMI (37 °C) a uma concentração final de  $2 \times 10^6$  células/ml. Então, 250  $\mu$ l de suspensão de células ( $0,5 \times 10^6$  células por amostra) foram transferidos em viais de vidro silanizados AquaSil™ (Chromacol 1,1- MTV) em formato de 96 poços. Após a adição de 5  $\mu$ l de veículo (DMSO) ou compostos as células foram incubadas a 37 °C por 15 min. Como controles positivos OMDM-2 e UCM707 foram usados a 10  $\mu$ M em cada execução. Os compostos ETI-T foram medidos até 7 concentrações em triplicatas a partir de 100 pM - 100  $\mu$ M. Após a pre-incubação, uma mistura de 0,5 nM[etanolamina-1-<sup>3</sup>H]-AEA, (60 Ci/mmol) e 99,5 nM de AEA frio (100 nM final) foi adicionada e as amostras foram incubadas a 37 °C por outros 15 min. A reação foi interrompida pela rápida filtração em filtros UniFilter-96 GF/C (PerkinElmer) pré-embebidos com PBS 0,25 % de BSA. As células foram lavadas três vezes com 100  $\mu$ l de tampão PBS resfriado com gelo contendo 1 % de BSA livre de ácido graxo. Após a secagem, 45  $\mu$ l de coquetel de cintilação MicroScint 20 (PerkinElmer, Waltham, MA, EUA) foram adicionados aos poços e a placa foi vedada. A radioatividade foi medida pela contagem de cintilação de líquidos em um PerkinElmer Wallac Trilux MicroBeta 1450 durante 2 min. A ligação não específica de [<sup>3</sup>H]AEA (100 nM) aos viais de vidro nunca foi superior a 10 %. Os valores de IC<sub>50</sub> foram calculados por GraphPad® por meio de regressão não linear usando a função de log(inibidor) incorporado vs. declínio de variável de resposta (quatro parâmetros).

#### Atividade de FAAH

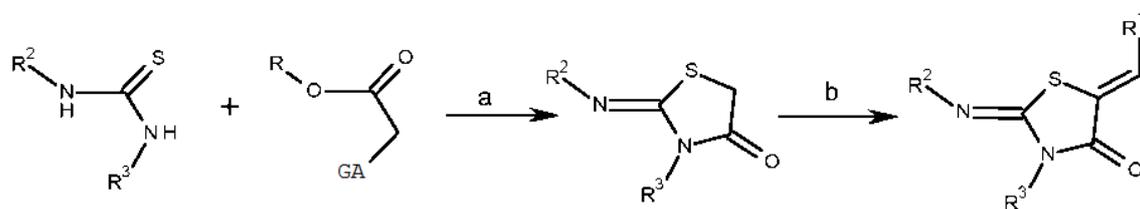
[00270] A hidrólise de [<sup>3</sup>H]-AEA por FAAH foi determinada como anteriormente descrito em homogenatos celulares de células U937 (0,18 mg proteína) (Omeir *et al.*, 1999, *Biochem Biophys Res Commun*, 264, 316-20; Mor *et al.*, 2004, *J Med Chem*, 47, 4998-5008). As quantidades de proteína de homogenatos celulares correspondem a  $0,5 \times 10^6$  células (U937), para assegurar a melhor comparabilidade possível de valores de IC<sub>50</sub> como usado para os ensaios de absorção celular de AEA. URB597 foi usado como controle positivo. A quantificação de proteína foi realizada usando um ensaio de BCA (Thermo Scientific). A atividade de enzima foi avaliada pela adição de veículo ou compostos em 10 µl de DMSO a 490 µl de homogenato em 10 mM de Tris HCl, 1 mM de EDTA, 0,1 % (p/v) de BSA livre de ácido graxo, pH = 8 e incubação por 15 min a 37 °C. Após, uma mistura de AEA plus [etanolamina-1-<sup>3</sup>H]-AEA (0,5 nM) em 100 nM final foi adicionada aos homogenatos e incubada por 15 min a 37 °C. A reação foi interrompida pela adição de 1 ml. CHCl<sub>3</sub> resfriado com gelo:MeOH (1:1) seguido de vórtex vigoroso. A separação de fases foi alcançada pela centrifugação a 10'000 x g a 4 °C por 10 min. A radioatividade da fase aquosa separada (fase de cima) contendo [<sup>3</sup>H- etanolamina] ou [<sup>3</sup>H-glicerol] foi medida pela contagem de cintilação de líquidos em um analisador de cintilação de líquidos Tri-Carb 2100 TR após a adição de 3,5 ml de coquetel de cintilação Ultima Gold (PerkinElmer Life Sciences). Os resultados são expressos como hidrólise de substrato de trítio em porcentagem de controle tratado com veículo. Os valores de IC<sub>50</sub> foram calculados por GraphPad®. Os dados são relatados como média de n = 3 experimentos independentes realizados em triplicatas.

Ligação de receptor CB a radioligando

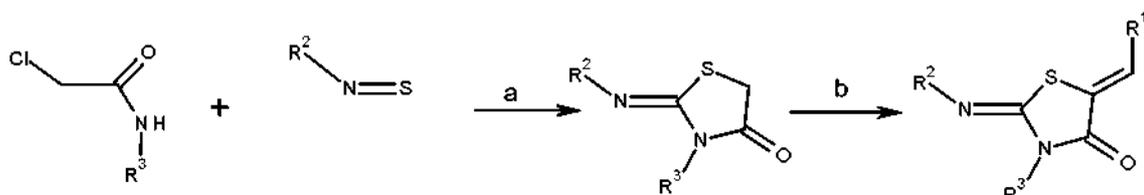
[00271] As propriedades de ligação de compostos ETI-T aos receptores hCB1 ou hCB2 foram realizadas como anteriormente relatado em um ensaio de deslocamento de [<sup>3</sup>H]-CP55,940 (Gertsch *et al.*, 2008, Proc Natl Acad Sci 105, 9099-104). WIN 55.212-2 foi usado como controle positivo. Em resumo, 20 µg de proteína de preparações de membrana hCB<sub>1</sub> ou hCB<sub>2</sub> de CHO-K1 foram descongelados em gelo e ressuspensos em um volume final de 500 µl de tampão de ligação (50 mM de Tris-HCl, 2,5 mM de EDTA, 5 mM de MgCl<sub>2</sub>, 0,5 % de BSA livre de ácido graxo, pH 7,4) em viais de vidro silanizados. [<sup>3</sup>H]-CP55,940 (168 Ci/mmol) (PerkinElmer, Waltham, MA, EUA) foi adicionado a uma concentração final de 0,5 nM seguido da adição de competidores ou veículo em 5 µl de DMSO. A ligação de membrana foi equilibrada por 2 h à temperatura ambiente (25 °C). As amostras foram filtradas através de uma placa pré-embecida com polietilenimina a 0,1 % UniFilter®-96 GF/B (PerkinElmer) e lavadas doze vezes com 167 µl de tampão de ensaio resfriado com gelo. A placa foi seca, o fundo vedado e 45 µl de coquetel de cintilação MicroScint 20 (PerkinElmer) foram adicionados antes de medir em um contador de cintilação de líquidos PerkinElmer 1450 Microbeta TRILUX. A ligação não específica foi determinada por WIN 55,212-2, 10 µM e subtraída de todos os valores. Valores de IC<sub>50</sub>.

Síntese geral

[00272] Os compostos da invenção podem ser produzidos de acordo com uma das vias representadas no esquema 1 ou esquema 2. Os materiais de partida podem ser comprados ou produzidos de acordo com procedimentos da literatura.



[00273] Esquema 1: a) solvente, opcional uma base; b)  $R^1$ -CH=O, piperidina, EtOH, 18 h ou 2 eq. NaOH, AcOH, 60 - 110 °C, 3-24 h (análogo a *J.Med.Chem.;2010*] 53 (10), 4198 ou *J.Med.Chem.;2008*; 51, 1242), com R sendo H, metila ou etila e GA sendo um grupo de saída tal como Cl ou Br.

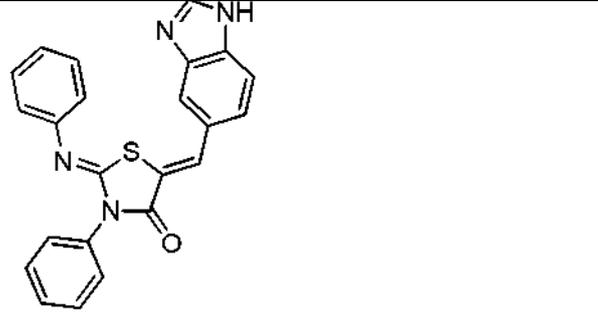
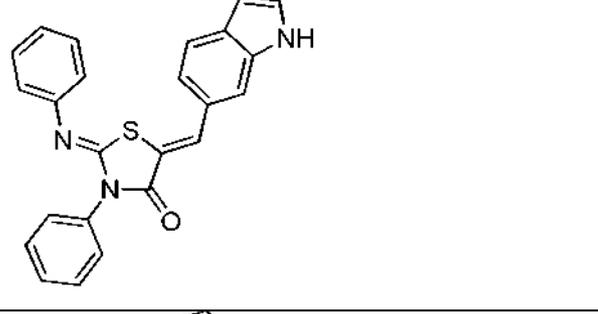
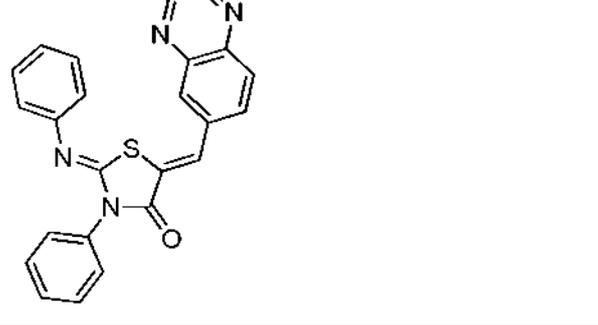
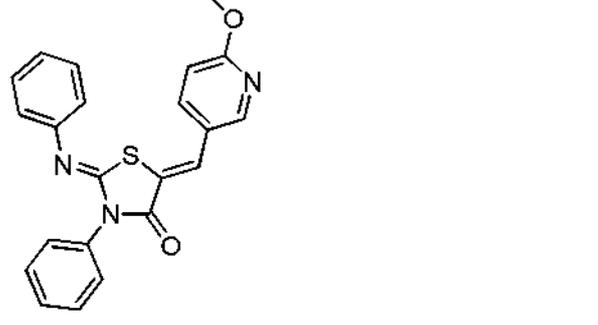


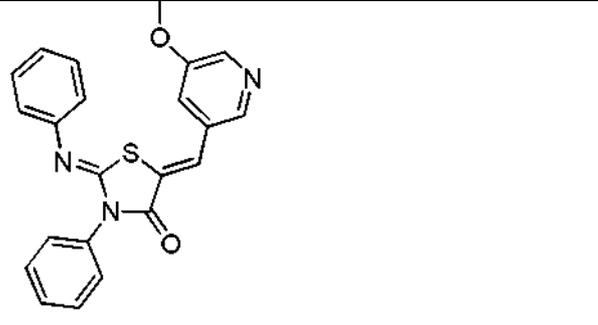
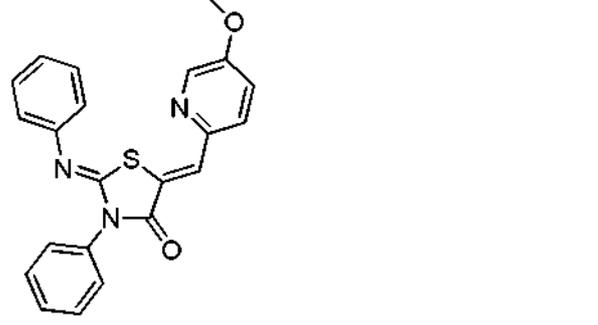
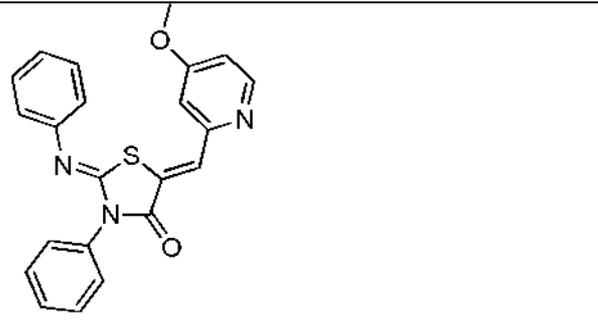
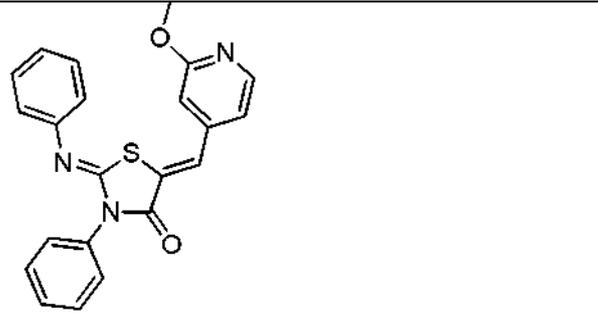
[00274] Esquema 2: a) solvente, base; b)  $R^1$ -CH=O, piperidina, EtOH, 18 h ou 2 eq. NaOH, AcOH, 60 - 110 °C, 3-24 h (análogo a *J.Med. Chem.;2010*; 53 (10), 4198 ou *J.Med. Chem.;2008*; 51, 1242).

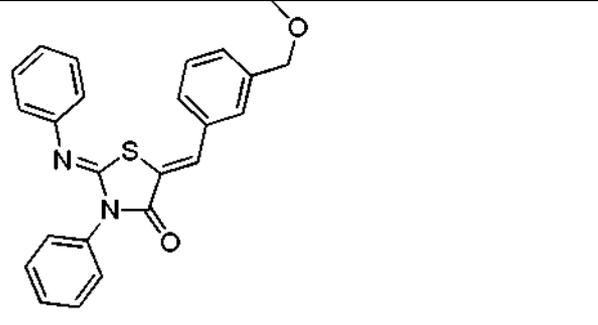
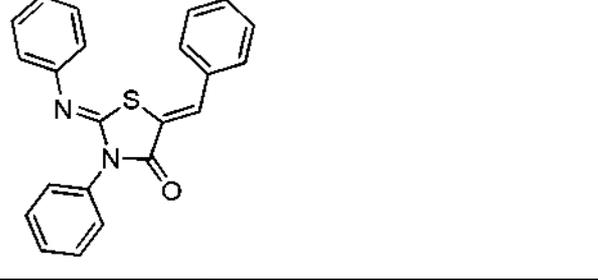
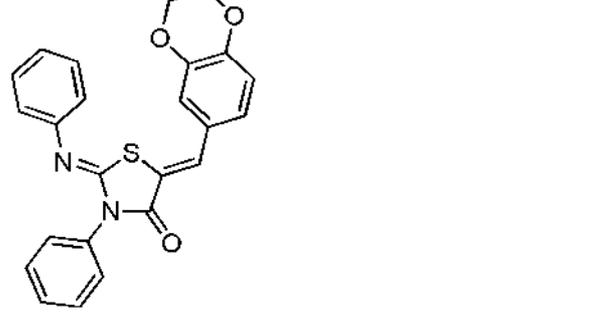
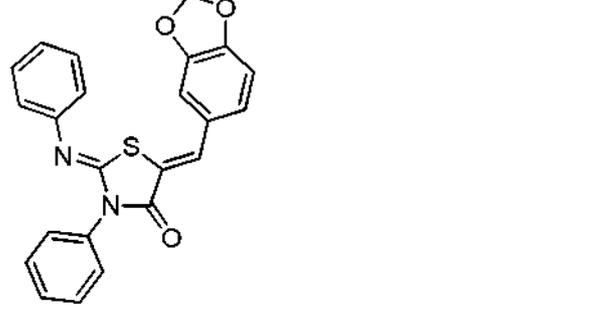
[00275] Avaliação:

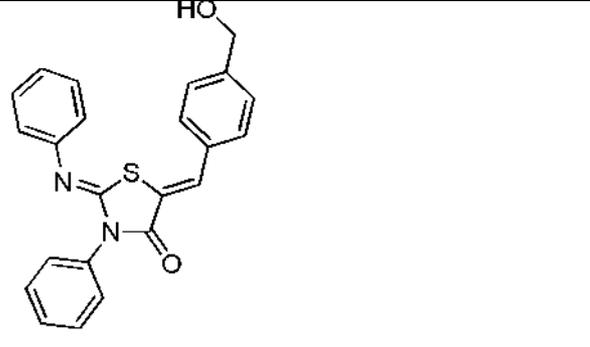
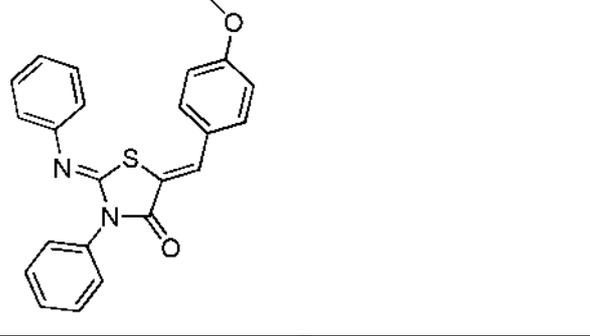
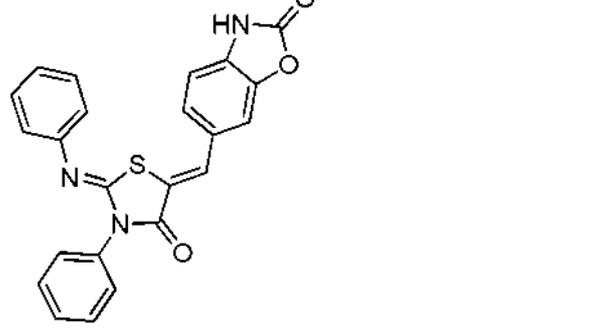
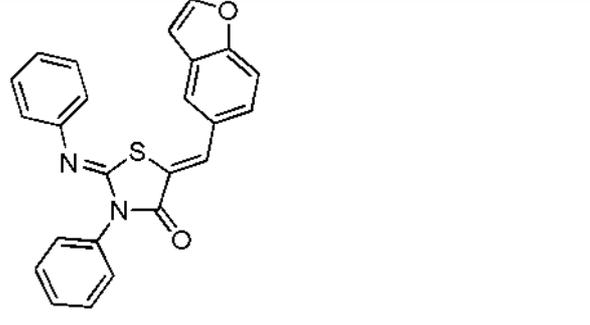
Tabela 1 - inibição da absorção de AEA

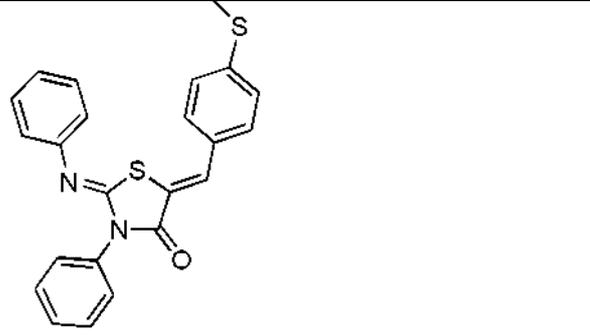
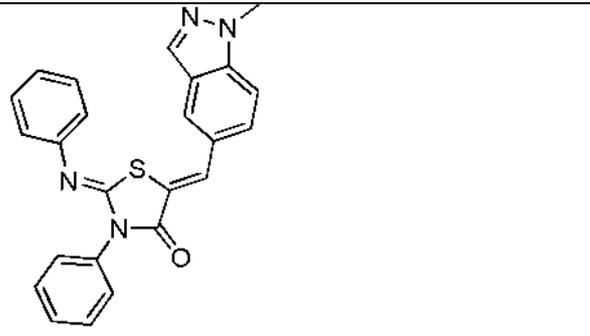
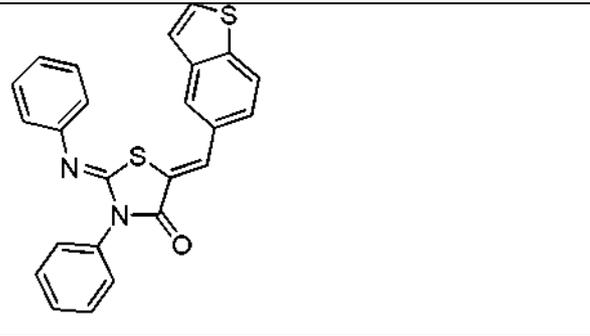
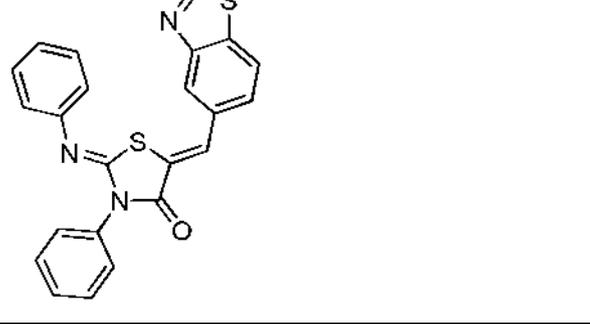
Composto	inibição da absorção de AEA IC <sub>50</sub> ( $\mu$ M)
	0,731

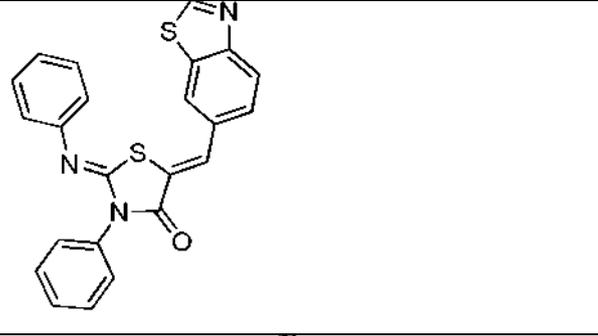
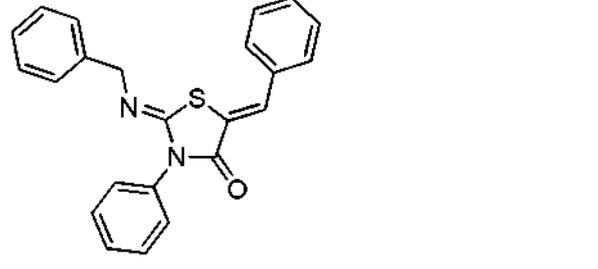
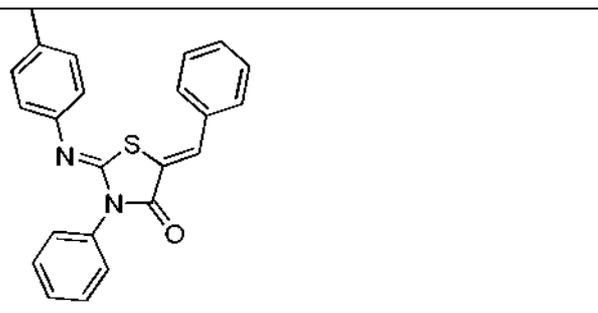
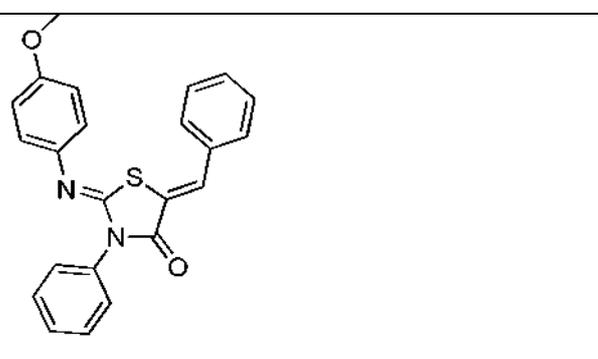
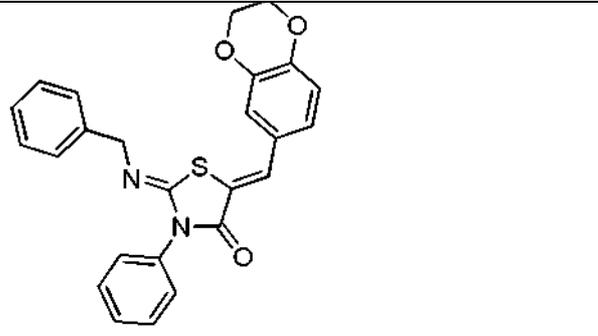
	0,194
	2,3
	7,1
	15,6

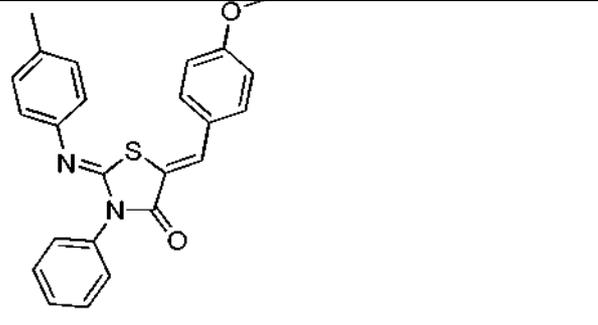
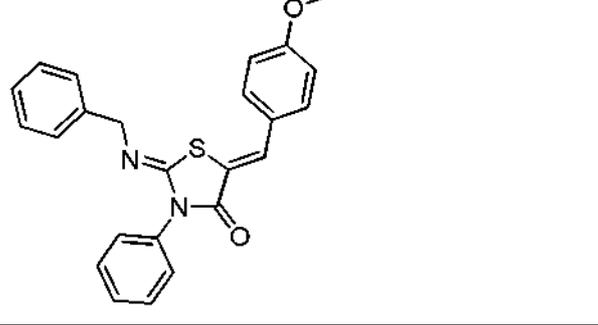
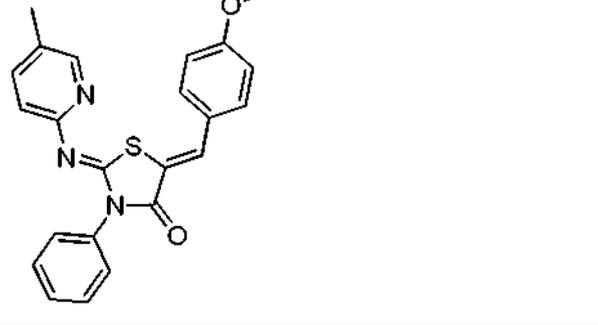
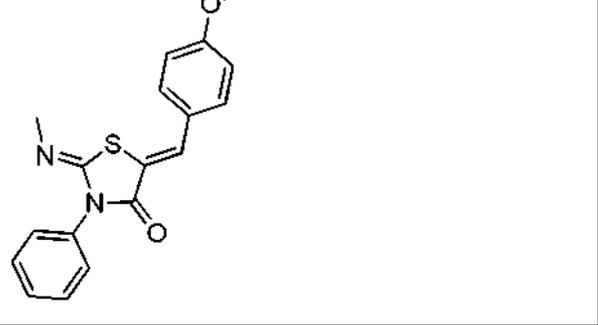
	6,7
	6,6
	1,6
	5,5

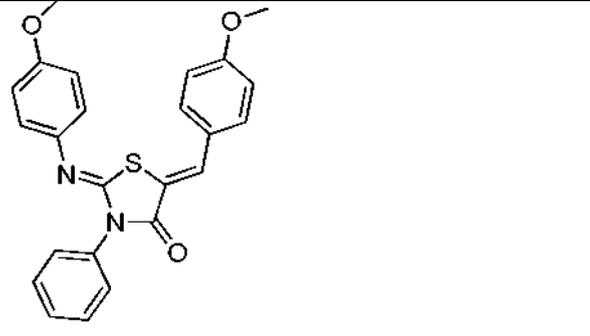
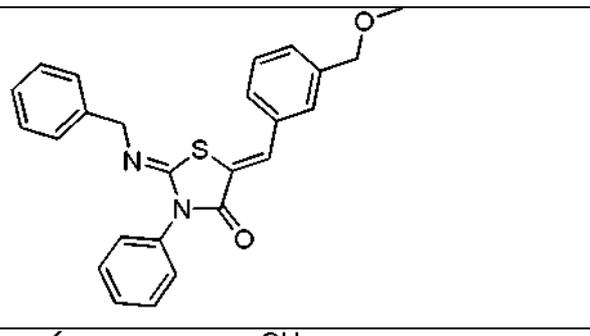
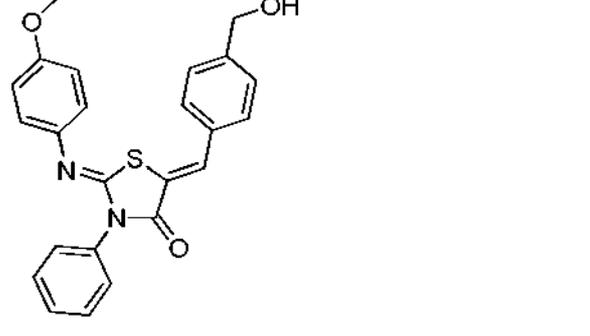
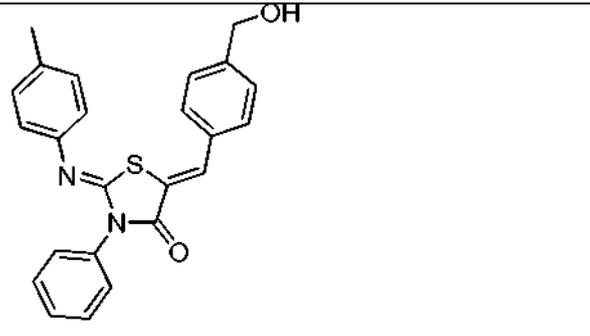
	1,0
	2,78
	0,817
	3,36

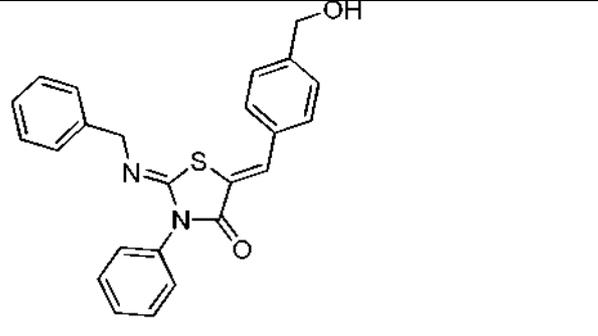
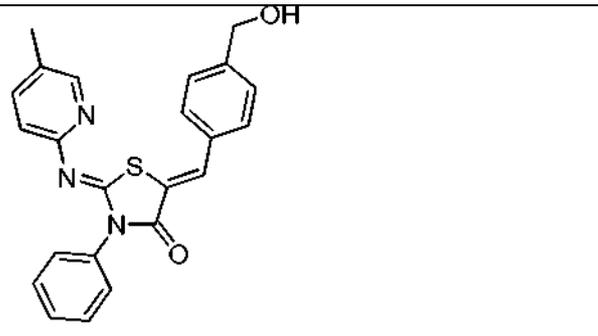
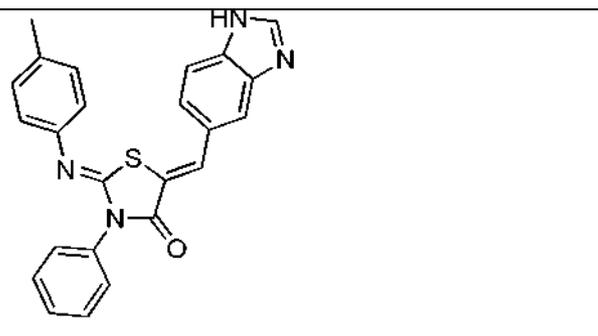
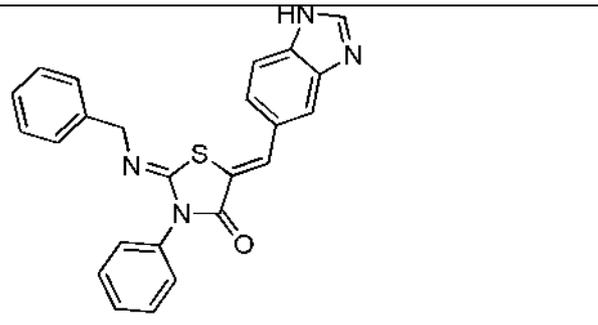
 <chem>OCC1=CC=C(C=C1)/C=C2C(=O)N(C3=CC=CC=C3)C(=N4C=CC=CC4=S2)c5ccccc5</chem>	0,729
 <chem>COc1ccc(cc1)/C=C2C(=O)N(C3=CC=CC=C3)C(=N4C=CC=CC4=S2)c5ccccc5</chem>	2,12
 <chem>O=C1NC2=CC=C(C=C2)OC1/C=C3C(=O)N(C4=CC=CC=C4)C(=N5C=CC=CC5=S3)c6ccccc6</chem>	5,56
 <chem>c1ccc2c(c1)oc3ccccc32/C=C4C(=O)N(C5=CC=CC=C5)C(=N6C=CC=CC6=S4)c7ccccc7</chem>	3,26

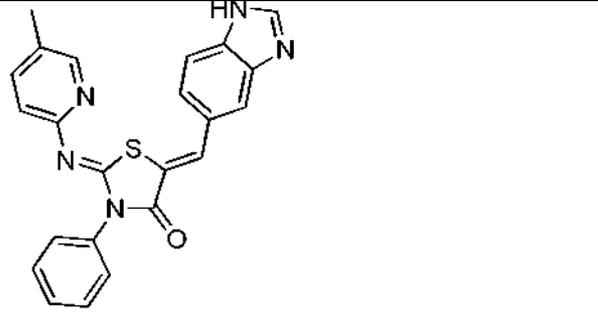
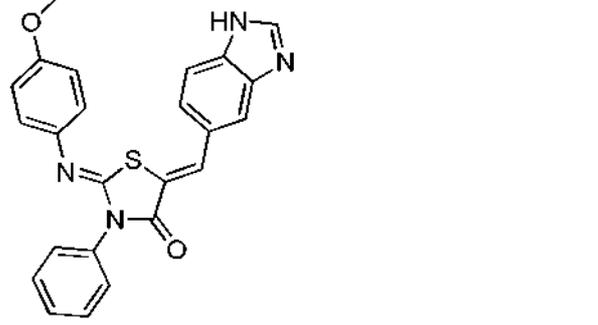
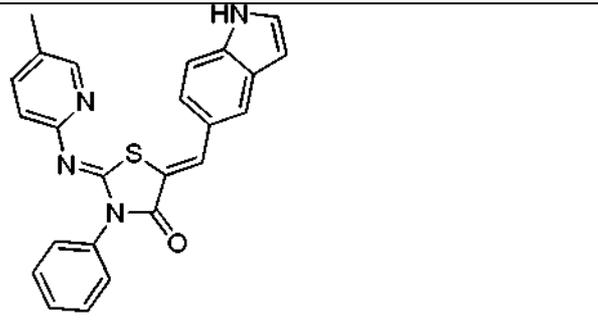
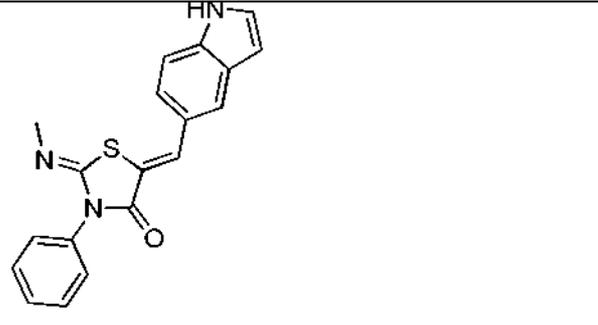
	9,94
	0,515
	4,63
	11,77

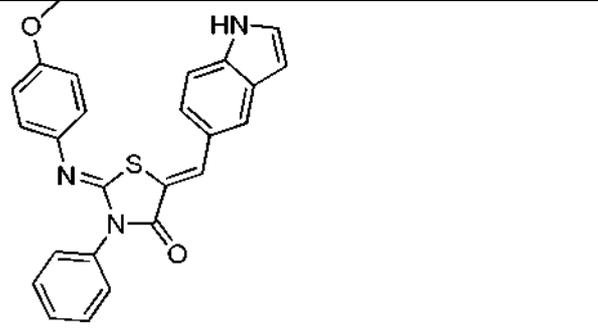
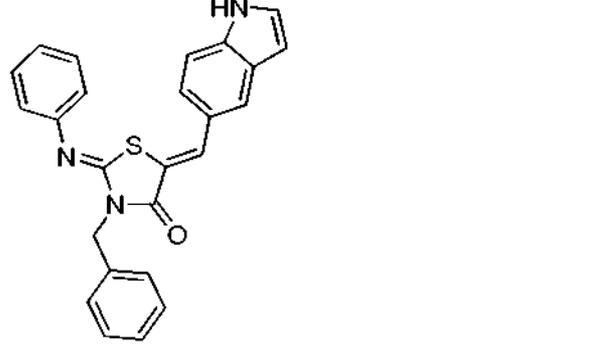
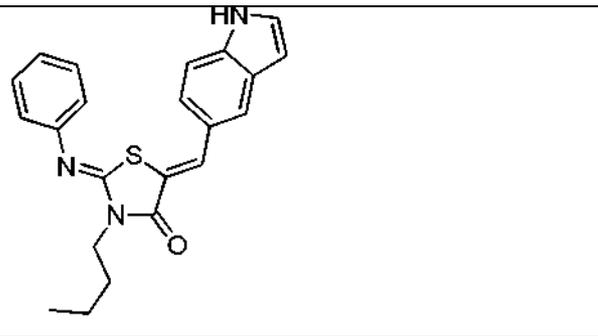
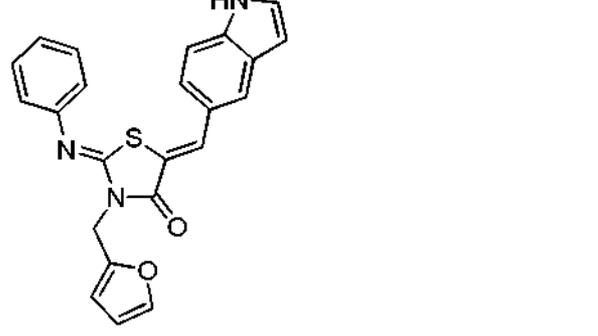
	0,291
	0,180
	3,24
	2,34
	0,170

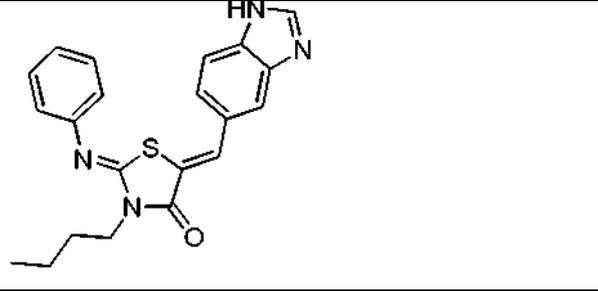
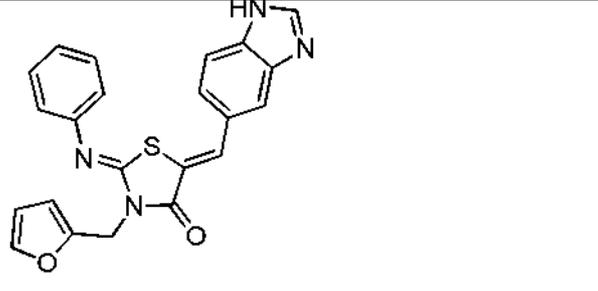
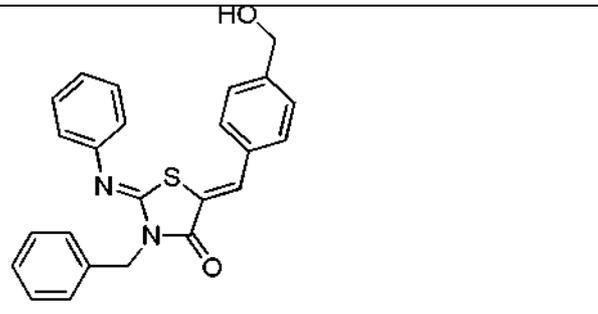
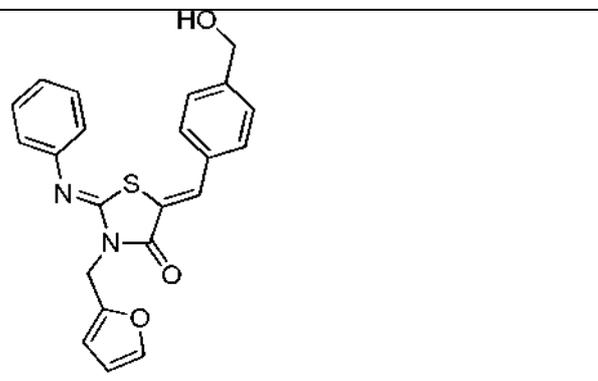
	5,10
	0,440
	2,80
	6,92

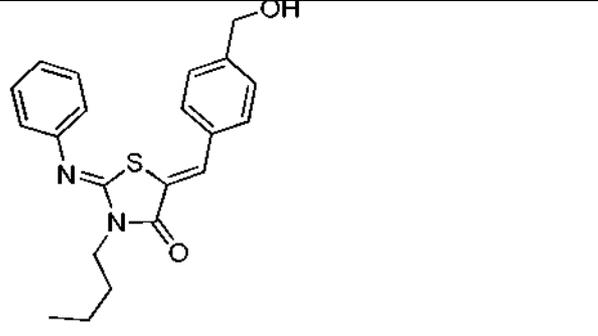
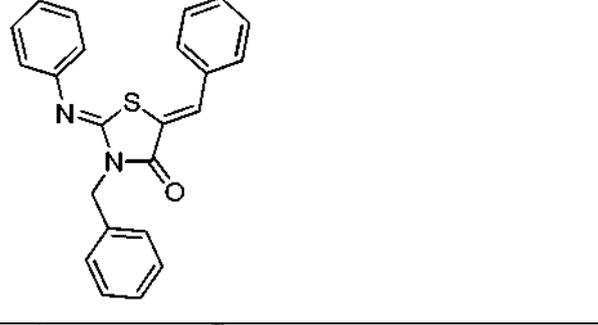
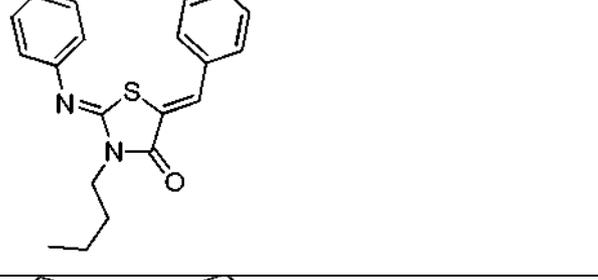
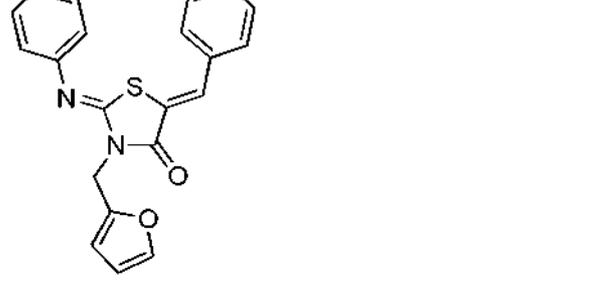
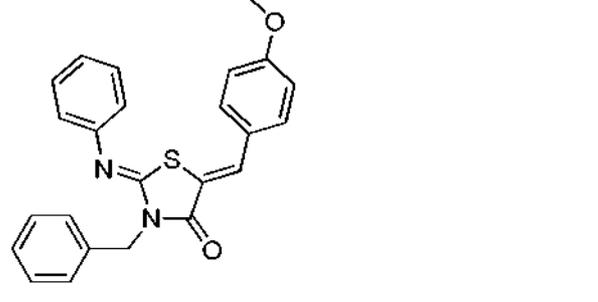
	1,74
	1,69
	0,135
	0,111

	0,257
	1,45
	0,107
	2,14

	1,59
	0,164
	2,73
	16,6

	1,07
	0,610
	0,677
	0,879

	0,557
	1,84
	0,657
	1,31

	1,09
	5,42
	4,15
	1,81
	2,29

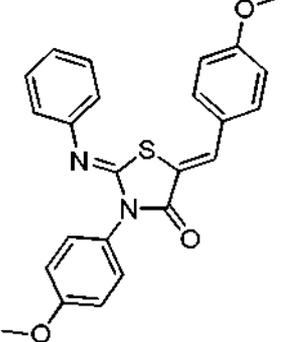
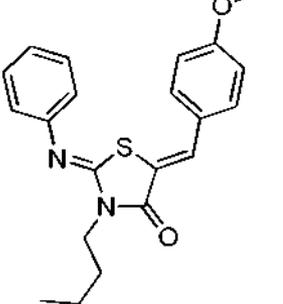
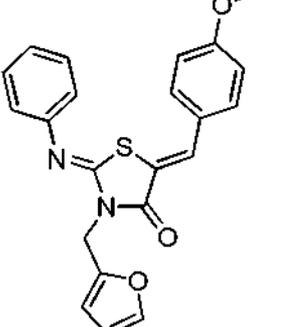
	7,18
	2,27
	3,18

Tabela 2 - inibição da absorção de AEA de compostos adicionais

ETI-T-composto	absorção de AEA IC <sub>50</sub> (µM)	ETI-T-composto	absorção de AEA IC <sub>50</sub> (µM)
24_Q_B	0,033	24_N_A	0,334
24_Q_I	0,035	24_Q_N	0,373
24_P_L	0,051	24_B_N	0,419
24_Q_L	0,085	24_N_I	0,462
24_P_I	0,087	24_P_X	0,509
24_Q_X	0,137	24_P_N	0,53
24_A_B	0,138	24_A_L	0,616
24_B_I	0,141	24_B_L	0,663

24_B_X	0,162	24_N_B	0,667
24_Q_A	0,164	24_A_X	0,721
24_B_B	0,170	24	0,817
24_C_N	0,170	24_F_N	0,939
24_N_X	0,172	24_P_B	1,043
24_B_A	0,176	24_S_N	1,43
24_P_A	0,176	24_A_N	1,510
24_A_A	0,286	24_K_N	1,620
24_A_I	0,301		

Tabela 3 - inibição de FAAH de compostos adicionais

ETI-T-composto	inibição de FAAH IC <sub>50</sub> (µM)	ETI-T-composto	inibição de FAAH IC <sub>50</sub> (µM)
24_Q_B	1,288	24_N_A	> 100
24_Q_I	0,037	24_Q_N	0,437
24_P_L	0,617	24_N_I	> 100
24_Q_L	0,813	24_P_X	2,63
24_P_I	0,170	24_P_N	0,912
24_Q_X	0,427	24_N_B	> 100
24_B_I	> 100	24	> 100
24_B_X	> 100	24_F_N	> 100
24_Q_A	> 100	24_P_B	11,22
24_B_B	> 100	24_C_B	> 100
24_C_N	1,585	24_C_C	> 100
24_N_X	> 100	24_C_F	> 100
24_P_A	1,514	22_B_I	> 100
24_A_A	> 100		
24_A_I	> 100		

Tabela 4 - ligação a receptor CB1 de compostos adicionais

ETI-T-composto	% de ligação a receptor CB1 a 10 µM	ETI-T-composto	% de ligação a receptor CB1 a 10 µM
24_Q_B	45	24_A_I	58
24_Q_I	47	24_N_A	80
24_P_L	41	24_Q_N	26
24_Q_L	44	24_B_N	53
24_P_I	61	24_N_I	82
24_A_B	29	24_P_X	78
24_B_I	42	24_P_N	52

24_B_X	78	24_A_L	67
24_Q_A	74	24_B_L	63
24_B_B	3	24_N_B	86
24_C_N	68	24_A_X	54
24_N_X	43	24	1
24_B_A	32	24_P_B	50
24_P_A	83	24_S_N	56
24_A_A	30	24_K_N	78
22B_I	42		

Tabela 5 - inibição da absorção de AEA de compostos adicionais

ETI-T-composto	absorção de AEA IC <sub>50</sub> (µM)	ETI-T-composto	absorção de AEA IC <sub>50</sub> (µM)
04_A_N	0,107	03_C_K	0,564
04_B_I	0,132	03_N_K	0,564
04_K_N	0,142	04_B_X	0,578
04_A_X	0,155	03_N_C	0,610
04_F_N	0,164	32_B_A	0,632
04	0,194	03_N_G	0,677
03_T_N	0,262	03_C_O	0,727
32	0,291	04_N_K	0,727
03_A_A	0,315	03	0,731
32_A_X	0,327	03_B_A	0,760
32_A_I	0,341	04_C_B	0,861
28_A_X	0,351	04_S_N	0,878
28_A_I	0,389	03_N_M	0,879
04_A_A	0,390	32_B_X	0,993
03_P_N	0,403	04_P_N	1,020
03_B_X	0,479	04_C_G	1,060
04_C_F	0,484	03_F_N	1,070
03_U_N	0,509	04_C_O	1,120
28	0,515	04_C_K	1,140
04_B_A	0,527	04_U_N	1,4
04_N_G	0,557	04_D_N	1,590

Tabela 6 - inibição de FAAH de compostos adicionais

ETI-T-composto	inibição de FAAH IC <sub>50</sub> (µM)	ETI-T-composto	inibição de FAAH IC <sub>50</sub> (µM)	ETI-T-composto	inibição de FAAH IC <sub>50</sub> (µM)
04_A_N	> 100	03_T_N	> 100	28_A_I	> 100
04_B_I	22,909	32	> 100	04_A_A	> 100

04_K_N	> 100	03_A_A	> 100	03_P_N	< 10
04_A_X	14,454	32_A_X	> 100	03_B_X	> 100
04_F_N	> 100	32_A_I	> 100	04_C_F	> 10
04	> 100	28_A_X	> 100		

Tabela 7 - ligação a receptor CB1 de compostos adicionais

ETI-T-composto	% de ligação a receptor CB1 a 10 $\mu$ M	ETI-T-composto	% de ligação a receptor CB1 a 10 $\mu$ M	ETI-T-composto	% de ligação a receptor CB1 a 10 $\mu$ M
04_A_N	71	03_T_N	36	28_A_I	31
04_B_I	43	32	37	04_A_A	49
04_K_N	80	03_A_A	57	03_P_N	71
04_A_X	27	32_A_X	55	03_B_X	46
04_F_N	55	32_A_I	43	04_C_F	27
04	43	28_A_X	51		

Tabela 8 - inibição da absorção de AEA de compostos adicionais

ETI-T-composto	absorção de AEA IC <sub>50</sub> ( $\mu$ M)	ETI-T-composto	absorção de AEA IC <sub>50</sub> ( $\mu$ M)	ETI-T-composto	absorção de AEA IC <sub>50</sub> ( $\mu$ M)
22_K_N	0,097	22_U_N	0,812	22_R_N	5,180
22_A_N	0,111	22_N_K	0,861	22_C_C	10,420
22_B_X	0,127	15	1,030	23_A_V	10,500
22_F_N	0,135	22_N_G	1,090	22_B_V	12,540
22_A_X	0,150	22_C_0	1,200	15_U_N	15,550
22_A_A	0,341	22_C_G	1,280	34	> 10
15_Q_N	0,368	22_N_M	1,310	04_A_V	> 10
22_B_A	0,386	22_C_K	1,430	15_R_N	> 10
22_P_N	0,500	22_D_N	1,450	22_A_V	> 10
22_C_F	0,592	15_C_0	1,560	22_E_N	> 10
22_N_C	0,657	22_C_N	1,660	22_N_F	> 10
15_C_K	0,692	15_C_N	1,690	22_T_N	> 10
22_Q_N	0,713	22_C_B	2,170		
22	0,729	15_T_N	2,640		

Tabela 9 e 10 - inibição de FAAH e ligação a receptor CB1 de compostos adicionais

ETI-T-composto	inibição de FAAH IC <sub>50</sub> (μM)
22_K_N	6,607
22_A_N	19,498
22_B_X	19,055
22_F_N	> 100
22_A_X	> 100
22_A_A	> 100
15_Q_N	< 10
22_B_A	> 100

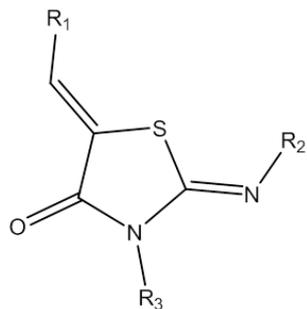
ETI-T-composto	% de ligação a receptor CB1 a 10 μM
22_K_N	63
22_A_N	71
22_B_X	70
22_F_N	33
22_A_X	41
22_A_A	50
15_Q_N	27
22_B_A	24

Tabela 11 - inibição da absorção de AEA, inibição de FAAH e ligação a receptor CB1 de compostos adicionais

ETI-T-composto	absorção de AEA IC <sub>50</sub> (μM)	ETI-T-composto	inibição de FAAH IC <sub>50</sub> (μM)	ETI-T-composto	% de ligação a receptor CB1 a 10 μM
23_C_N	0,180	23_C_N	> 10	23_C_N	75
23_T_N	0,556				
23_Q_N	0,598				
23_C_G	0,753				
23_N_K	1,120				
23_B_X	1,132				
23_C_0	1,190				

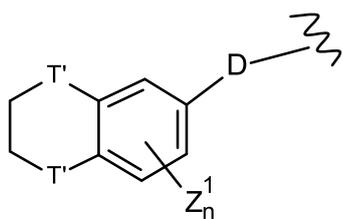
REIVINDICAÇÕES

1. COMPOSTO **caracterizado por** compreender a seguinte fórmula geral (1)

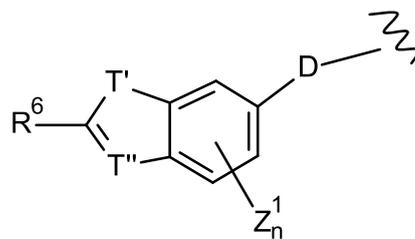


(fórmula 1)

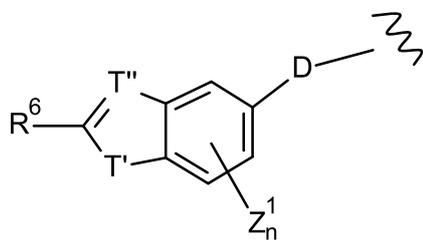
em que R<sup>1</sup> consiste na fórmula geral 2e', 2c', 2g', 2h' ou 2b'



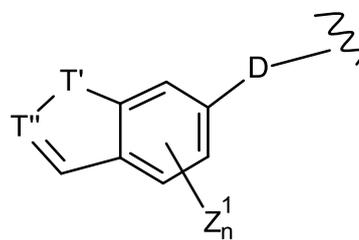
(2e'),



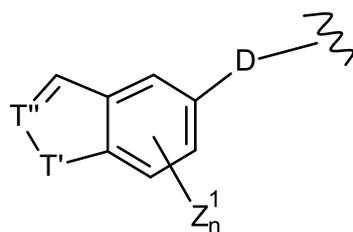
(2b'),



(2c')



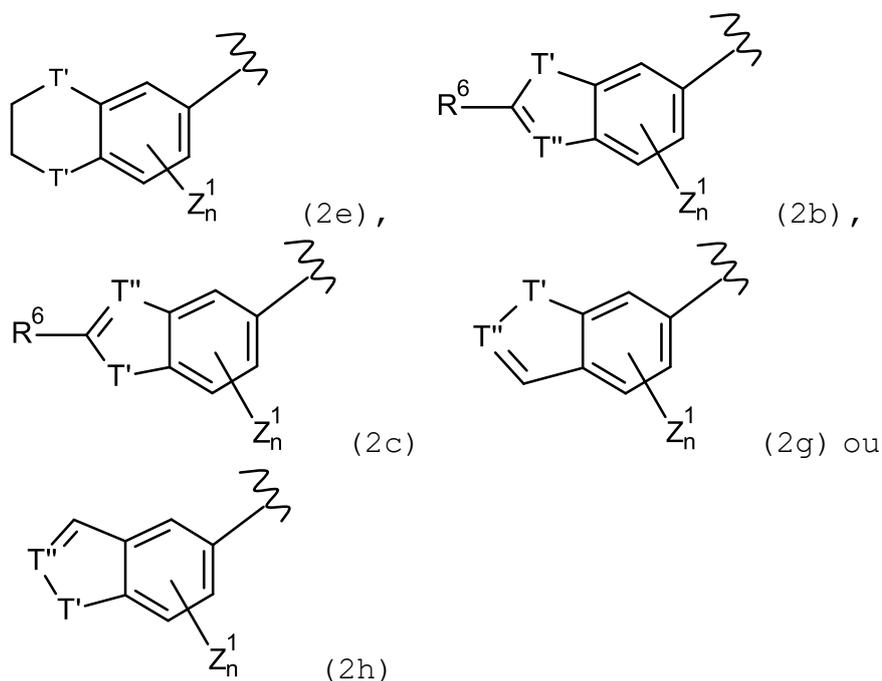
(2g')



ou

(2h')

- com D sendo uma C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub> alquila,  
ou na fórmula geral 2e, 2b, 2c, 2g ou 2h



- com  $T'$  sendo selecionado de  $-NH$ ,  $-CH_2$ ,  $-S$ ,  $NR^c$ ,  $-CHCH_3$ ,  $-C(CH_3)_2$  ou  $-O$  para as fórmulas gerais  $2b'$ ,  $2c'$ ,  $2g'$ ,  $2h'$ ,  $2b$ ,  $2c$ ,  $2g$  or  $2h$ , ou

-  $T'$  sendo selecionado dentre  $-NH$  ou  $-O$  para as fórmulas gerais  $2e'$  ou  $2e$  e

- com cada  $T''$  sendo selecionados independentemente uns dos outros dentre  $CH$  ou  $=N$ ;

- com  $R^6$  sendo selecionado dentre  $-OH$ ,  $-OCH_3$ ,  $-OCH_3$ ,  $-CH_3$  or  $H$ ,

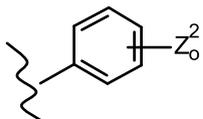
- com  $R^c$  sendo  $-CH_2OH$ ,  $-CH_3$ ,  $-CH_2CH_3$ ,  $-CH_2CH_2CH_3$ ,  $-CH(CH_3)_2$ ,  $-CH_2CF_3$ ,  $-CHF_2CF_3$ ,  $-CF_2CF_3$ ,  $-CH_2F$ , ou  $-CF_3$ , e

- com  $n$  de  $Z_n^1$  sendo 0, 1, 2 ou 3, e com cada  $Z^1$  independentemente de qualquer outro  $Z^1$  sendo selecionado de  $-F$ ,  $-Cl$ ,  $-Br$ ,  $-I$ ,  $CN$ ,  $-R^a$ ,  $-OR^a$ ,  $-(CH_2)_rOR^a$ ,  $-SR^a$ ,  $-(CH_2)_rSR^a$  ou  $-NR^{a_2}$ , com cada  $R^a$  sendo selecionado independentemente um do outro de  $H$ , uma  $C_1$ - $C_8$  alquila não substituída, uma  $C_2$ - $C_8$

alquenila não substituída, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquinila não substituída, com r sendo 1, 2, 3 ou 4,

R<sup>2</sup> é selecionado de

- uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída compreende a fórmula 4b



(fórmula 4b),

- com o de Z<sup>2</sup> sendo 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, e
- com cada Z<sup>2</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>2</sup> sendo selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>b</sup>, -SR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila não substituída, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila não substituída, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila não substituída, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, uma alquila, alquenila ou alquinila substituída, em que a alquila, alquenila ou alquinila substituída compreende a fórmula -L-Ar,
  - com L sendo uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, e
  - Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, em que a arila substituída ou heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>2</sup> selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>b</sup>, -SR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila não substituída, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila não substituída, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila não substituída, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, ou

- uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila não substituída, e R<sup>3</sup> é selecionado de

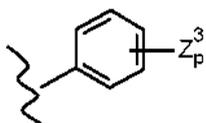
- uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila não substituída,
- uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila não substituída,
- uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila não substituída,
- uma alquila substituída, uma alquenila substituída ou uma alquinila substituída, em que a alquila substituída, alquenila substituída ou alquinila substituída compreende a fórmula -D-Ar,

com D sendo uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, e

Ar sendo uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída, ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, em que

uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída compreende pelo menos um substituinte Z<sup>3</sup> selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>d</sup>, -OR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>d</sup>, -SR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>b</sup> ou -NR<sup>d</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>d</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila não substituída, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila não substituída, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila não substituída, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, ou

- uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> cicloalquila não substituída, ou
- uma arila substituída ou não substituída, em que a arila substituída compreende a fórmula 5b



(fórmula 5b),

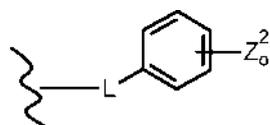
- com p de Z<sup>3</sup><sub>p</sub> sendo 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, e
- com cada Z<sup>3</sup> independentemente um do outro Z<sup>3</sup>

sendo selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>d</sup>, -OR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>d</sup>, -SR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>d</sup> ou -NR<sup>d</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>d</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila não substituída, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila não substituída, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila não substituída, com r sendo 1, 2, 3 ou 4.

2. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, **caracterizado por** R<sup>1</sup> ser selecionado da fórmula 2b, 2c, 2e, 2g ou 2h.

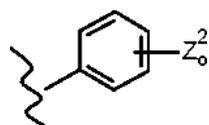
3. COMPOSTO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 ou 2, **caracterizado por** cada Z<sup>1</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>1</sup> ser selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>a</sup>, -OR<sup>a</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>a</sup>, com cada R<sup>a</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila substituída ou não substituída, uma C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquenila substituída ou não substituída, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> alquinila substituída ou não substituída.

4. COMPOSTO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 3, **caracterizado por** R<sup>2</sup> ser selecionado de  
 - uma alquila, alquenila ou alquinila substituída, em que a alquila, alquenila ou alquinila substituída compreende a fórmula 4a



(fórmula 4a) ou

- uma C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída compreende a fórmula 4b



(fórmula 4b)

- com L sendo

- uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>,
- uma alquenila C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>, ou
- uma alquinila C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>, e
  - o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, e
  - cada Z<sup>2</sup> independentemente um do outro Z<sup>2</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>b</sup>, -SR<sup>b</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída, com r sendo 1, 2, 3 ou 4.

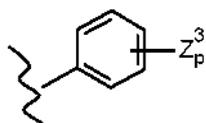
5. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 4, **caracterizado por** o de Z<sup>2</sup><sub>o</sub> ser 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, e cada Z<sup>2</sup> ser selecionado independentemente um do outro Z<sup>2</sup> de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>b</sup> ou -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila substituída ou não substituída, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila substituída ou não substituída, ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila substituída ou não substituída.

6. COMPOSTO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 5, **caracterizado por** R<sup>3</sup> ser selecionado de

- uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila não substituída,
- uma C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-cicloalquila não substituída, ou
- uma alquila, alquenila ou alquinila substituída, em que a alquila, alquenila ou alquinila substituída compreende a fórmula -D-Ar,
- com D sendo
- uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila,

- uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, ou
- uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquinila, e
- Ar sendo uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída ou uma C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>- heteroarila substituída ou não substituída, ou

uma C<sub>6</sub>- arila substituída ou não substituída, em que a arila substituída compreende a fórmula 5b



(formula 5b),

em que

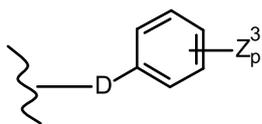
Z<sup>3</sup> é selecionado de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>d</sup>, -OR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>d</sup>, -SR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>b</sup> or -NR<sup>d</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>d</sup> sendo selecionado independentemente de cada outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila não substituída, uma C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> alquenila não substituída ou uma alquinila C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> não substituída, com r sendo 1, 2, 3 ou 4, e

p de Z<sup>3</sup><sub>p</sub> sendo 0, 1, 2, 3, 4 ou 5.

7. COMPOSTO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 6, **caracterizado por** R<sub>3</sub> ser selecionado de

- uma C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-alquila não substituída,
- ciclohexano,
- uma alquila, alquenila ou alquinila substituída,

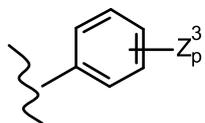
em que a alquila, alquenila ou alquinila substituída tem a fórmula 5a



(fórmula 5a), ou

- uma C<sub>6</sub>-aril substituída ou não substituída, em

que a C<sub>6</sub> arila substituída tem a fórmula 5b



(fórmula 5b),

com D sendo

- uma C<sub>1-12</sub> alquila,
- uma alquenila C<sub>2-12</sub>,
- uma C<sub>2-12</sub> alquinila, e

p de Z<sup>3</sup><sub>p</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, e

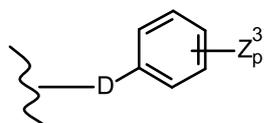
cada Z<sup>3</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>3</sup> é - F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>d</sup>, -OR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>d</sup> -SR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>d</sup> or -NR<sup>d</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>d</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> não substituída, uma alquenila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> não substituída ou uma alquinila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> não substituída, com r sendo 1, 2, 3 ou 4.

8. COMPOSTO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 7, **caracterizado por** R<sub>3</sub> ser selecionado de

- ciclohexano,

- uma alquila, alquenila ou alquinila substituída,

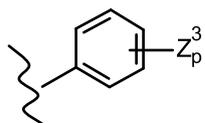
em que a alquila, alquenila ou alquinila substituída tem a fórmula 5a



(fórmula 5a), ou

- uma C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída, em

que a C<sub>6</sub> arila substituída tem a fórmula 5b



(fórmula 5b),

com D sendo

- uma C<sub>1-12</sub> alquila,
- uma C<sub>2-12</sub> alquenila,
- uma C<sub>2-12</sub> alquinila, e

p de Z<sup>3</sup><sub>p</sub> é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, e

cada Z<sup>3</sup> independentemente de qualquer outro Z<sup>3</sup> é -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>d</sup>, -OR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>OR<sup>d</sup> -SR<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>SR<sup>d</sup> or -NR<sup>d</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>d</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1-C12</sub> alquila não substituída, uma C<sub>2-C12</sub> alquenila não substituída ou uma alquinila C<sub>2-C12</sub> não substituída, com r sendo 1, 2, 3 ou 4.

9. COMPOSTO de acordo com qualquer uma das reivindicações 4 e 6 a 8, **caracterizado por**

L ser uma C<sub>1-4</sub> alquila, uma C<sub>2-4</sub> alquenila ou uma C<sub>2-4</sub> alquinila, ou

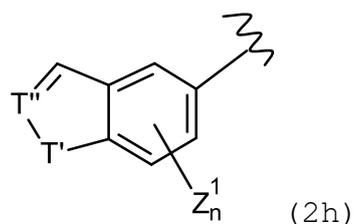
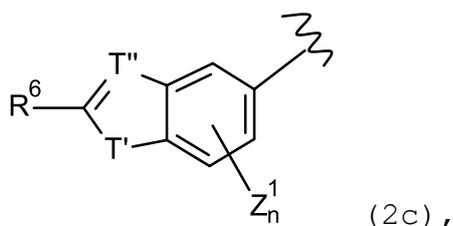
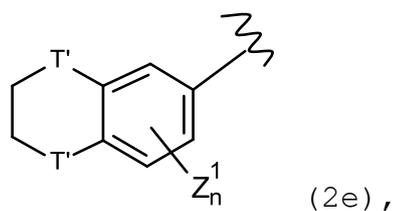
D ser uma C<sub>1-4</sub> alquila, uma C<sub>2-4</sub> alquenila ou uma C<sub>2-4</sub> alquinila.

10. COMPOSTO de acordo com qualquer uma das reivindicações 6 a 8, **caracterizado por**

p de Z<sup>3</sup><sub>p</sub> ser 0, 1, 2, 3, 4 ou 5, e cada Z<sup>3</sup> ser selecionado independentemente de qualquer outro Z<sup>3</sup> de -F, -Cl, -Br, -I, CN, -R<sup>d</sup>, -OR<sup>d</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>d</sup> or -NR<sup>d</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>d</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1-C12</sub> alquila substituída ou não substituída, uma C<sub>2-C12</sub> alquenila substituída ou não substituída, ou uma C<sub>2-C12</sub> alquinila substituída ou não substituída.

11. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, **caracterizado por**

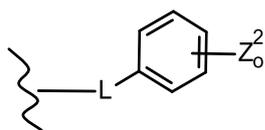
- R1 ter a fórmula geral 2e, 2c ou 2h,



com T' sendo O no caso de 2e,  
e T' sendo selecionado de -NH, NCH<sub>3</sub> e S no  
caso de 2c e 2h e T'' sendo =N,

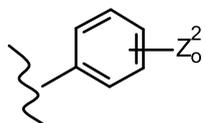
e n de Z<sub>n</sub><sup>1</sup> sendo 0, e

- R<sup>3</sup> ser ciclohexano, e
  - R<sup>2</sup> ser
  - uma alquila, alquenila ou alquinila substituída,
- em que a alquila, alquenila ou alquinila substituída tem a fórmula 4<sup>a</sup>



(fórmula 4a) ou

- uma C<sub>6</sub>-arila substituída ou não substituída, em  
que a C<sub>6</sub> arila substituída tem a fórmula 4b



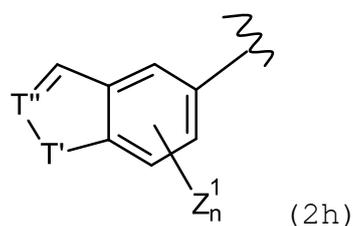
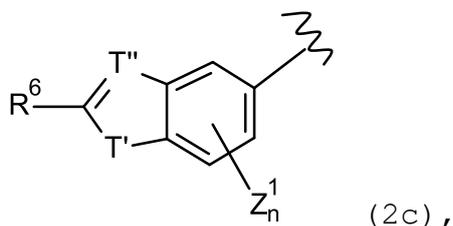
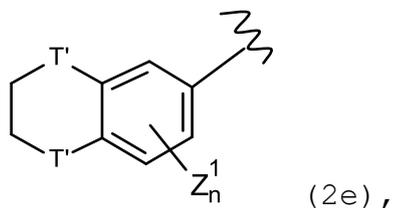
(fórmula 4b)

- sendo L
- uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,
- uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,

- uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e  
 o de Z<sup>2</sup><sub>0</sub> é 0 ou 1, e cada Z<sup>2</sup> é selecionado independentemente de qualquer outro Z<sup>2</sup> de -F, -Cl, -R<sup>b</sup>, -OR<sup>b</sup>, CH<sub>2</sub>OR<sup>b</sup> or -NR<sup>b</sup><sub>2</sub>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila não substituída, uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila não substituída ou uma C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila não substituída.

12. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, **caracterizado por**

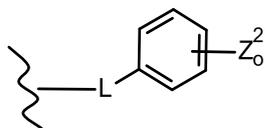
- R<sup>1</sup> ter a formula geral 2e, 2c or 2h,



com T' sendo O no caso de 2e,  
 e T' sendo selecionado de -NH, NCH<sub>3</sub> e S no caso de 2c e 2h e T'' sendo =N,  
 e n de Z<sub>n</sub><sup>1</sup> sendo 0,

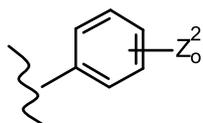
e

- R<sup>3</sup> ser ciclohexano, e  
 - R<sup>2</sup> ser  
 - uma alquila, alquenila ou alquinila substituída,  
 em que a alquila, alquenila ou alquinila substituída tem a fórmula 4a



(fórmula 4a) ou

- uma C<sub>6</sub> -arila substituída ou não substituída, em que a C<sub>6</sub> arila substituída tem a fórmula 4b



(fórmula 4b)

sendo L

- uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,
- uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila,
- uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, e

o de Z<sup>2</sup> é 0 ou 1, e cada Z<sup>2</sup> é selecionado independentemente de qualquer outro Z<sup>2</sup> de -F, -Cl, -R<sup>b</sup>, com cada R<sup>b</sup> sendo selecionado independentemente um do outro de H, um C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila não substituída, uma C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquenila não substituída, ou uma alquenil alquinila não substituída.

13. COMPOSTOS de acordo com a reivindicação 1, **caracterizado por** os ditos compostos serem selecionados de:

- (2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-3-(4-fluorofenil)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-um;
- (2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-3-ciclohexil-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-3-(4-clorofenil)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxina-6-il)metileno)tiazolidin-4-um;
- (2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-3-(4-clorofenil)-

5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxina-6-il)metileno)tiazolidin-4-um;

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-3-ciclohexil-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-isobutiltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-5-(2,3-di-hidro-1,4-benzodioxin-6-ilmetileno)-3-(4-fluorofenil)-2-(p-tolilimino)tiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-3-ciclohexil-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-isobutiltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-p-toliltiazolidin-4-ona ;

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-3-(4-fluorofenil)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxina-6-il)metileno)tiazolidin-4-um;

- (2Z,5Z)-2-(benzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-isobutil-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-p-

toliltiazolidin-4-ona ;

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-p-

toliltiazolidin-4-ona ;

- (2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-p-

toliltiazolidin-4-ona ;

- (2Z,5Z)-3-ciclohexil-5-(2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-ilmetileno)-2-(p-tolilimino)tiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-2-(fenilimino)-3-p-toliltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-7-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-3-ciclohexil-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-isobutiltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-3-(4-clorofenil)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxina-6-il)metileno)tiazolidin-4-um;

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-3-(4-clorofenil)-

5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxina-6-il)metileno) tiazolidin-4-um;

- (2Z,5Z)-3-(4-fluorofenil)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-2-(fenilimino) tiazolidin-4-um;

- (2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-isobutiltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-fenil-2-(fenilimino) tiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(4-metoxifenilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorobenzilimino)-3-(4-fluorofenil)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxina-6-il)metileno) tiazolidin-4-um;

- (2Z,5Z)-2-((piridin-3-il)metilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxina-7-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-um;

- (2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-3-feniltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-3-fenil-2-(fenilimino) tiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-fenil-2-(fenilimino) tiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-5-((1-metil-1H-indazol-5-il)metileno)-3-fenil-2-(fenilimino) tiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-3-(p-tolil)-2-(p-tolilimino) tiazolidin-4-ona;

- (2Z, 5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-((4-fluorofenil)imino)-3-(p-tolil) tiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-((4-fluorofenil)imino)-3-isobutiltiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3-(3-fenilpropil) tiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3-fenetiltiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-((4-metoxifenil)imino)-3-feniltiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(fenilimino)-3-(3-fenilpropil) tiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-3-(furan-2-ilmetil)-2-(fenilimino) tiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-((4-fluorobenzil)imino)-3-feniltiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-((2-clorobenzil)imino)-3-feniltiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-indol-5-il)metileno)-2-(fenetilimino)-3-feniltiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-(p-tolil)-2-(p-tolilimino) tiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-fenil-2-(p-tolilimino) tiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-isobutil-2-(p-tolilimino) tiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-((4-fluorofenil)imino)-3-(p-tolil) tiazolidin-4-ona;
- (2Z, 5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-ciclohexil-2-((4-fluorofenil)imino) tiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-((4-fluorofenil)imino)-3-isobutiltiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3-(4-fluorofenil)tiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3-(4-metoxifenil)tiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3-butiltiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3-(3-fenilpropil)tiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(benzilimino)-3-fenetiltiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-((5-metilpiridin-2-il)imino)-3-feniltiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-((4-metoxifenil)imino)-3-feniltiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-benzil-2-(fenilimino)tiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-butil-2-(fenilimino)tiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(fenilimino)-3-(3-fenilpropil)tiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-((4-fluorobenzil)imino)-3-feniltiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-3-fenil-2-(piridin-3-ilmetil)imino)tiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(fenetilimino)-3-feniltiaolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-3-ciclohexil-5-((1-metil-1H-indazol-5-il)metileno)-2-(p-tolilimino)tiaolidin-4-ona;

- ftolilimino)tiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-(benzo[d]tiazol-6-ilmetileno)-3-ciclohexil-2-(p-tolilimino)tiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-(benzo[d]tiazol-6-ilmetileno)-3-isobutil-2-(p-tolilimino)tiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-(benzo[d]tiazol-6-ilmetileno)-2-((4-fluorofenil)imino)-3-isobutiltiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(4-fluorofenilimino)-3-ciclohexiltiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-((benzo[d]tiazol-6-il)metileno)-3-ciclohexiltiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-3-ciclohexil-5-((1-metil-1H-indazol-5-il)metileno)tiazolidin-4-ona.

14. COMPOSTO de acordo com a reivindicação 1, **caracterizado por** o composto ser selecionado de

- (2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-3-ciclohexil-5-((2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-3-ciclohexil-5-((2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-3-ciclohexil-5-(2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-ilmetileno)-2-(p-tolilimino)tiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-3-ciclohexil-5-((2,3-dihidrobenczo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)-2-(fenilimino)tiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-il)metileno)-2-(4-fluorofenilimino)-3-ciclohexiltiazolidin-4-ona;
- (2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-5-((benzo[d]tiazol-6-il)metileno)-3-ciclohexiltiazolidin-4-ona;

- (2Z,5Z)-2-(p-tolilimino)-3-ciclohexil-5-((1-metil-1H-indazol-5-il)metileno)tiazolidin-4-ona.

15. COMPOSTO de acordo com a reivindicação 1, **caracterizado por** o composto ser (2Z,5Z)-2-(4-fluorofenilimino)-3-ciclohexil-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona.

16. COMPOSTO de acordo com a reivindicação 1, **caracterizado por** o composto ser (2Z,5Z)-2-(4-metoxibenzilimino)-3-ciclohexil-5-((2,3-dihidrobenzo[b][1,4]dioxin-6-il)metileno)tiazolidin-4-ona.

17. COMPOSTO de acordo com a reivindicação 1, **caracterizado por** o composto ser (2Z,5Z)-5-((1H-benzo[d]imidazol-5-yl)methylene)-2-(4-fluorophenylimino)-3-cyclohexylthiazolidin-4-one.

18. USO DO COMPOSTO conforme definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 17, **caracterizado por** ser para fabricar um medicamento para tratar transtornos psiquiátricos ou neurológicos e inflamação.