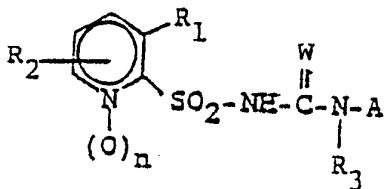
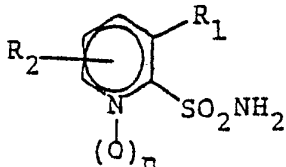




Modalidade e n.º (11) 96.445 R	T D	Data do pedido: (22)	Classificação Internacional (51)
Requerente (71): HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT, alemã, industrial, com sede em D-6230 Frankfurt am Main 80, República Federal da Alemanha			
Inventores (72): DR. HEINZ KEHNE, DR. LOTHAR WILLMS, DR. OSWALD ORT, DR. KLAUS BAUER e DR. HERMANN BIERINGER			
Reivindicação de prioridade(s) (30)			Figura (para interpretação do resumo)
Data do pedido	País de Origem	N.º de pedido	
10.01.1990	DE	P 40 00 503.8	
27.09.1990	DE	P 40 30 577.5	
Epigrafe: (54) "PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE PIRI- DIL-SULFONIL-UREIAS E DE COMPOSI- ÇÕES HERBICIDAS E DE REGULAÇÃO DO DESENVOLVIMENTO DE PLANTAS QUE AS CONTÊM"			
Resumo: (máx. 150 palavras) (57) Preparam-se compostos de fórmula geral $\text{R}_2-\text{C}_6\text{H}_3(\text{R}_1)-\text{N}(\text{O})_n-\text{SO}_2-\text{NH}-\text{C}(=\text{W})-\text{N}(\text{R}_3)-\text{A} \quad (\text{I})$ úteis como herbicidas e como agentes reguladores do crescimento de plantas, fazendo reagir novos compostos de fórmula geral $\text{R}_2-\text{C}_6\text{H}_3(\text{R}_1)-\text{N}(\text{O})_n-\text{SO}_2\text{NH}_2 \quad (\text{II})$			

NÃO PREENCHER AS ZONAS SOMBRÉADAS



INSTITUTO NACIONAL DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL

DIRECÇÃO DE SERVIÇOS DE PATENTES

CAMPO DAS CEBOLAS, 1100 LISBOA
TEL.: 888 51 51 / 2 / 3 TELEX: 18356 INPI
TELEFAX: 87 53 08

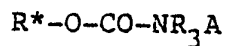
FOLHA DO RESUMO (Continuação)

Modalidade e n.º (11)	T D	Data do pedido (22)	Classificação Internacional (51)
-----------------------	-----	---------------------	----------------------------------

Resumo (continuação) (57)

2

com um carbamato de fórmula geral



Os compostos de fórmula geral II podem ser preparados passando pelos correspondentes cloretos de sulfonilo.

NÃO PREENCHER AS ZONAS SOMBREADAS

(Dr. Jorge Garin)

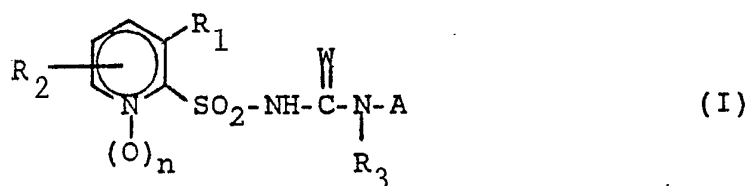
4.

**"PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE PIRIDIL-SULFONIL-UREIAS E DE
COMPOSIÇÕES HERBICIDAS E DE REGULAÇÃO DO
DESENVOLVIMENTO DE PLANTAS QUE AS CONTÊM"**

Sabe-se que algumas 2-piridil-sulfonil-ureias possuem propriedades herbicidas e de regulação do crescimento das plantas: vejam-se as patentes de invenção EP-A-13 480, EP-A-272 855, EP-A-84 224, US-PS 4 421 550, EP-A-103 543 (US-A-4 579 583), US-PS 4 487 626, EP-A-125 864 e WO 88/04297.

A requerente descobriu agora que 2-piridil-sulfonil-ureias com radicais especiais na posição 3 do radical piridilo são especialmente apropriadas como agentes herbicidas e como agentes reguladores do crescimento.

São objecto da presente invenção compostos de fórmula geral (I) ou os seus sais



na qual

o símbolo R_1 representa um grupo de uma das fórmulas gerais $-\text{OSO}_2\text{NR}_4\text{R}_5$, $-\text{NR}_6\text{R}_7$ ou um átomo de iodo;

o símbolo R_2 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo (C_1-C_4) -alquilo, de preferência (C_1-C_3) -alquilo, (C_1-C_3) -halogeno-alquilo, um átomo de halogénio ou um grupo NO_2 , CN , (C_1-C_3) -alcoxi, (C_1-C_3) -halogeno-alcoxi, (C_1-C_3) -alquiltio, (C_1-C_3) -alcoxi- (C_1-C_3) -alquilo, (C_1-C_3) -alcoxi-carbonilo, (C_1-C_3) -alquilamino, di- $[(C_1-C_3)$ -alquil]-amino, (C_1-C_3) -alquil-sulfinilo, (C_1-C_3) -alquil-sulfonilo, $\text{SO}_2\text{NR}^a\text{R}^b$ ou $\text{C}(\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$;

os símbolos R^a e R^b , independentemente um do outro, representam, cada um, um átomo de hidrogénio ou um grupo (C_1-C_3) -alquilo, (C_3-C_4) -alcenilo, propargilo ou, em conjunto, representam um grupo $-(\text{CH}_2)_4-$, $-(\text{CH}_2)_5-$ ou $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$;

o símbolo R_3 representa um átomo de hidrogénio ou um radical CH_3 ;

4

o símbolo R_4 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo (C_1-C_3) -alquilo, (C_3-C_4) -alcenilo, (C_1-C_3) -alcoxi ou (C_3-C_4) -alcinilo, de preferência propargilo;

o símbolo R_5 representa um átomo de hidrogénio ou um radical (C_1-C_3) -alquilo, (C_3-C_4) -alcenilo ou (C_3-C_4) -alcinilo, de preferência propargilo; ou

os símbolos R_4 e R_5 , em conjunto, representam um grupo $-(CH_2)_4-$, $-(CH_2)_5-$ ou $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$;

o símbolo R_6 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo (C_1-C_8) -alquilo, que é não substituído ou é mono-substituído ou poli-substituído por um ou mais radicais escolhidos do grupo constituído por átomos de halogéneo ou grupos (C_1-C_4) -alcoxi, (C_1-C_4) -alquiltio, (C_1-C_4) -alquil-sulfinilo, (C_1-C_4) -alquil-sulfonilo, (C_1-C_4) -alcoxi-carbonilo e CN; (C_3-C_6) -alcenilo, que é não substituído ou mono-substituído ou poli-substituído por um ou mais átomos de halogéneo; (C_3-C_6) -alcinilo, que é não substituído ou mono-substituído ou poli-substituído por um ou vários átomos de halogéneo; (C_1-C_4) -alquil-sulfonilo, que é não substituído ou é mono-substituído ou polisubstituído por um ou vários

átomos de halogéneo; fenil-sulfonilo, em que o radical fenilo é não substituído ou poli-substituído por um ou vários substituintes escolhidos do grupo constituído por átomos de halogéneo, grupos (C_1-C_4) -alquilo e (C_1-C_4) -alcoxi; (C_1-C_4) -alcoxi ou (C_1-C_4) -alquil)-carbonilo, que é não substituído ou é mono-substituído ou poli-substituído por um ou mais átomos de halogéneo;

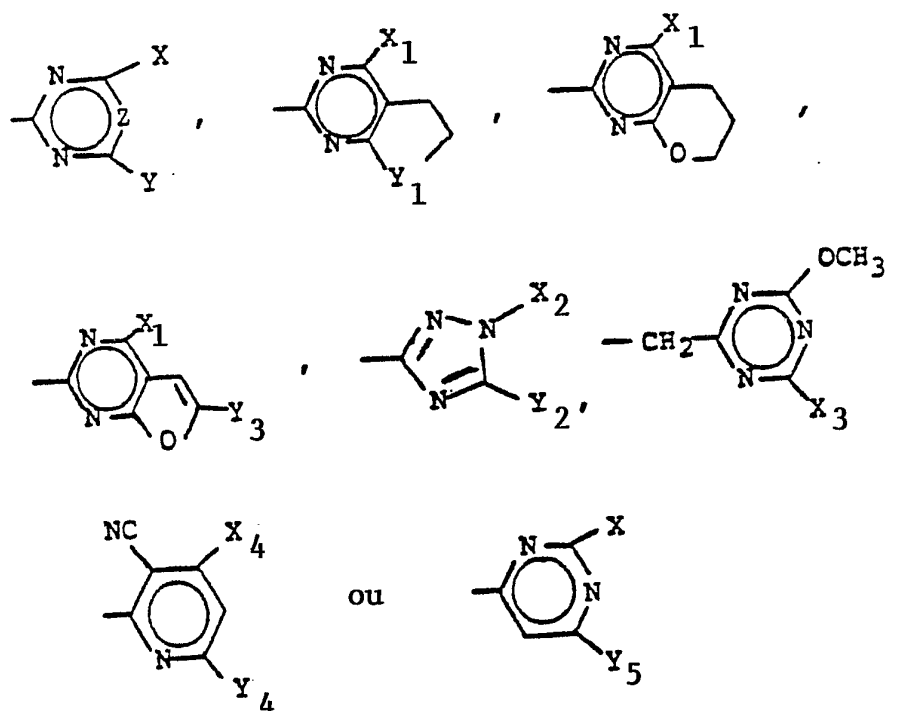
o símbolo R_7 representa um grupo (C_1-C_4) -alquil-sulfonilo, que é não substituído ou é mono-substituído ou poli-substituído por um ou vários átomos de halogéneo; fenil-sulfonilo, em que o radical fenilo é não substituído ou mono-substituído ou poli-substituído por um ou mais substituintes escolhidos do grupo constituído por átomos de halogéneo ou grupos (C_1-C_4) -alquilo e (C_1-C_4) -alcoxi; ou di- $[(C_1-C_4)$ -alquil]-amino-sulfonilo; ou

os símbolos R_6 e R_7 , em conjunto, representam uma cadeia de fórmula geral $-(CH_2)_m-SO_2-$, que pode ainda ser substituída por um a quatro radicais (C_1-C_3) -alquilo e em que o símbolo m significa os números 3 ou 4;

o símbolo n representa os números 0 ou 1;

o símbolo W representa um átomo de oxigênio ou de enxofre;

o símbolo A representa um radical de uma das fórmulas gerais



o símbolo X representa um átomo de hidrogênio ou de halogênio ou um radical (C_1-C_3) -alquilo ou (C_1-C_3) -alcoxi, em que os dois radicais mencionados em



último lugar podem ser não substituídos ou mono-substituídos ou poli-substituídos por átomos de halogêneo ou mono-substituídos por um grupo (C_1-C_3) -alcoxi;

o símbolo Y representa um átomo de hidrogênio ou um grupo (C_1-C_3) -alquilo, (C_1-C_3) -alcoxi ou (C_1-C_3) -alquiltio, em que os radicais que contêm grupos alquilo mencionados são não substituídos ou mono-substituídos ou poli-substituídos por átomos de halogêneo ou mono-substituídos ou di-substituídos por radicais (C_1-C_3) -alcoxi ou (C_1-C_3) -alquiltio; e ainda um radical de fórmula geral NR_8R_9 , (C_3-C_6) -cicloalquilo, (C_2-C_4) -alcenilo, (C_2-C_4) -alcinilo, (C_3-C_4) -alceniloxi ou (C_3-C_4) -alciniloxi;

o símbolo Z representa um grupo CH ou um átomo de azoto;

os símbolos R_8 e R_9 , independentemente um do outro, representam, cada um, um átomo de hidrogênio ou um grupo (C_1-C_3) -alquilo ou (C_3-C_4) -alcenilo;

o símbolo X_1 representa um grupo CH_3 , OCH_3 , OC_2H_5 ou OCF_2H ;

o símbolo Y_1 representa um átomo de oxigénio (-O-) ou um grupo $-CH_2-$;

o símbolo X_2 representa um grupo CH_3 , C_2H_5 ou CH_2CF_3 ;

o símbolo Y_2 representa um grupo OCH_3 , OC_2H_5 , SCH_3 , SC_2H_5 , CH_3 ou C_2H_5 ;

o símbolo X_3 representa um grupo CH_3 ou OCH_3 ;

o símbolo Y_3 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo CH_3 ;

o símbolo X_4 representa um grupo CH_3 , OCH_3 , OC_2H_5 ou CH_2OCH_3 ou um átomo de cloro;

o símbolo Y_4 representa um grupo CH_3 , OCH_3 , OC_2H_5 ou um átomo de cloro; e

o símbolo Y_5 representa um grupo CH_3 , C_2H_5 ou OCH_3 ou um átomo de cloro.

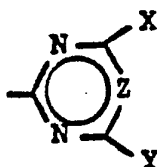
Na fórmula geral (I), os radicais alquilo, alcoxi, halogeno-alquilo, alquilamino e alquiltio, assim como os correspondentes radicais não saturados e/ou substituídos podem ser



respectivamente de cadeia linear ou ramificada. Os radicais alquilo, também nas significações derivadas, tais como alcoxi, halogeno-alquilo, etc., significam metilo, etilo, n-propilo ou i-propilo; os radicais alcenilo e alcinilo têm as significações dos radicais não saturados que correspondem o mais possível aos radicais alquilo, como 2-propenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 2-propinilo, 2-butinilo ou 3-butinilo. Halogéneo significa flúor, cloro, bromo ou iodo.

Os compostos de fórmula geral (I) podem formar sais, nos quais o átomo de hidrogénio do grupo $-SO_2NH-$ pode ser substituído por um catião apropriado para fins agrícolas. Estes sais são, por exemplo, sais de metais, em especial sais de metais alcalinos ou de metais alcalino-terrosos ou também sais de amónio ou sais de amins orgânicas. Igualmente, a formação do sal pode realizar-se por reacção com ácidos fortes na parte de piridina do composto de fórmula geral (I). Os ácidos apropriados para este efeito são HCl , HBr , H_2SO_4 ou HNO_3 .

Os compostos preferidos de fórmula geral (I) ou os seus sais são aqueles em que o símbolo n representa o número 0, o símbolo W representa um átomo de oxigénio e o símbolo A representa um radical de fórmula geral





na qual os símbolos X, Y e Z têm os significados definidos antes.

Os compostos preferidos de fórmula geral (I) ou os seus sais são também aqueles em que :

os símbolos R_2 , R^a , R^b , n, W e A têm os significados definidos antes,

os símbolos R_4 e R_5 , independentemente um do outro, representam, cada um, um grupo (C_1-C_3) -alquilo, alilo ou propargilo ou

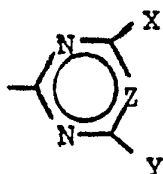
os símbolos R_4 e R_5 , em conjunto, representam um grupo $-(CH_2)_4-$, $-(CH_2)_5-$ ou $-CH_2CH_2-OCH_2-CH_2-$;

o símbolo R_6 representa um átomo de hidrogênio ou um grupo (C_1-C_4) -alquilo, que é não substituído ou é mono-substituído ou poli-substituído por um ou vários átomos de halogênio ou por um radical escolhido do grupo formado por (C_1-C_3) -alcoxi, (C_1-C_3) -alquiltio, (C_1-C_3) -alquil-sulfonilo, (C_1-C_4) -alcoxi-carbonilo e CN; (C_3-C_4) -alcenilo, (C_3-C_4) -alcínilo, (C_1-C_4) -alquil-sulfonilo, fenil-sulfonilo ou fenil-sulfonilo que é mono-substituído, di-substituído ou tri-substituído por um, dois ou três radicais escolhidos do grupo formado por átomos de halogênio e radicais (C_1-C_3) -alquilo e (C_1-C_3) -alcoxi; (C_1-C_3) -alcoxi ou (C_1-C_4) -alquilcarbonilo;

o símbolo R_7 representa um grupo (C_1-C_4) -alquil-sulfonilo, fenil-sulfonilo ou fenil-sulfonilo que é mono-substituído, di-substituído ou tri-substituído por um, dois ou três radicais escolhidos do grupo formado por átomos de halogênio e grupos (C_1-C_3) -alquilo e (C_1-C_3) -alcoxi ou di- (C_1-C_4) -alquil-amino-sulfonilo ou

os símbolos R_6 e R_7 , em conjunto, representam uma cadeia de fórmula geral $-(CH_2)_mSO_2-$, em que o símbolo m representa um dos números 3 ou 4.

São especialmente preferidos os compostos de fórmula geral (I) ou os seus sais em que o símbolo R_2 representa um átomo de hidrogênio ou de halogênio ou um radical (C_1-C_3) -alquilo, (C_1-C_3) -alcoxi ou (C_1-C_3) -alquiltio; os símbolos R_4 e R_5 , independentemente um do outro, representam, cada um, um grupo (C_1-C_3) -alquilo; o símbolo R_6 representa um átomo de hidrogênio ou um radical (C_1-C_4) -alquilo ou (C_1-C_3) -alquil-sulfonilo; o símbolo R_7 representa um radical (C_1-C_3) -alquil-sulfonilo e o símbolo A representa um radical de fórmula geral



na qual o símbolo Z representa um grupo CH ou um átomo de azoto;

o símbolo X representa um átomo de halogéneo ou um radical (C_1-C_2) -alquilo, (C_1-C_2) -alcoxi, OCF_2H , CF_3 ou OCH_2CF_3 ; e

o símbolo Y representa um radical (C_1-C_2) -alquilo, (C_1-C_2) -alcoxi ou OCF_2H ;

e especialmente os compostos definidos antes em que o símbolo n representa 0 e o símbolo W representa um átomo de oxigénio.

São ainda objecto da presente invenção os processos para a preparação dos compostos de fórmula geral (I) ou dos seus sais, caracterizados pelo facto de :

a) se fazer reagir um composto de fórmula geral (II)

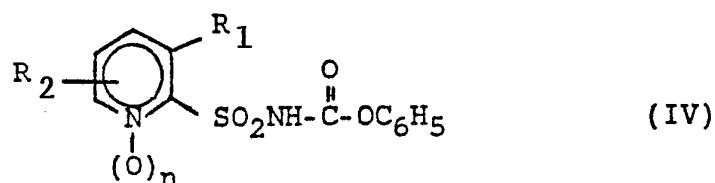


com um carbamato heterocíclico de fórmula geral (III)



na qual o símbolo R^* representa um radical fenilo ou $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$ -alquilo, ou

- b) se fazer reagir um piridil-sulfonil-carbamato de fórmula geral (IV)

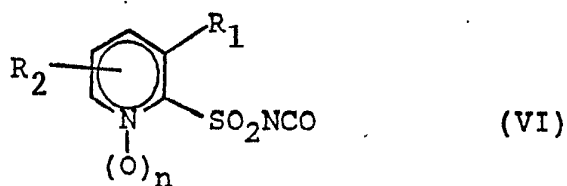


com um amino-heterociclo de fórmula geral (V)



ou

- c) se fazer reagir um sulfonil-isocianato de fórmula geral (VI)



com um amino-heterociclo de fórmula geral



ou

- d) numa reacção em um único vaso reaccional, em primeiro lugar se fazer reagir um amino-heterociclo de fórmula geral



na presença de uma base, como, por exemplo, trietilamina, com fosgênio e, em seguida, se fazer reagir o produto intermediário assim formado com uma piridina-sulfonamida de fórmula geral (II) (por exemplo, procedendo de maneira análoga à que se descreveu na patente de invenção europeia EP-A-232 067).

A reacção dos compostos de fórmulas gerais (II) e (III) realiza-se, de preferência, sob a acção catalítica de bases, no seio de um dissolvente orgânico inerte, como, por exemplo, diclorometano, acetonitrilo, dioxano ou THF, a uma temperatura compreendida entre 0° C e o ponto de ebulição do dissolvente. Como bases, prefere-se o 1,8-diaza-biciclo [5.4.0] undec-7-eno (DBU) ou trimetil-alumínio ou trietil-alumínio.

As sulfonamidas de fórmula geral (II) são compostos novos. Estas sulfonamidas e a sua preparação são igualmente objecto da presente invenção. Obtêm-se a partir de 2-halogeno-piridinas apropriadamente substituídas, que se fazem reagir com compostos S-nucleófilos, como, por exemplo, benzil-mercaptano ou tio-ureia. Os compostos assim formados são transformados, com hipoclorito de sódio ou com cloro, nos sulfocloreto (procedendo de maneira análoga à que se descreveu na patente de invenção europeia EP-A-272 855), que, em seguida, são feitos reagir directamente com amoníaco ou com tércio-butilamina passando pelas tércio-butilamidas com subsequente eliminação do grupo de protecção, de maneira a obterem-se as sulfonamidas de fórmula geral (II).

Podem preparar-se os carbamatos de fórmula geral (III) de acordo com processos que são descritos nos pedidos de patente de invenção sul-africanas 82/5671 e 82/5045 ou na

patente de invenção europeia EP-A-70804 (US-A-4 480 101) ou RD 275056.

A reacção dos compostos de fórmula geral (IV) com os amino-heterociclos de fórmula geral (V) realiza-se, de preferência, no seio de dissolventes inertes apróticos, como, por exemplo, dioxano, acetonitrilo ou tetra-hidrofurano, a temperaturas compreendidas entre 0° C e a temperatura de ebulição do dissolvente. Os materiais de partida necessários (V) são conhecidos da literatura ou podem preparar-se de acordo com processos conhecidos na literatura. Os piridil-sulfonil-carbamatos de fórmula geral (IV) obtêm-se de maneira análoga à que se descreveu nas patentes de invenção europeias EP-A-44 808 ou EP-A-237 292.

Os piridil-sulfonil-isocianatos de fórmula geral (VI) podem preparar-se de maneira análoga à que se descreveu na patente de invenção europeia EP-A-184 385 e fazer reagir com os amino-heterociclos de fórmula geral (V).

Os sais dos compostos de fórmula geral (I) preparam-se, de preferência, no seio de dissolventes inertes, como, por exemplo, água, metanol ou acetona, a temperaturas compreendidas entre 0° C e 100° C. As bases apropriadas para a preparação dos sais de acordo com a presente invenção são, por exemplo, carbonatos de metais alcalinos, como carbonato de

potássio, hidróxidos de metais alcalinos e alcalino-terrosos, amoníaco ou etanolamina. Como ácidos para a preparação de sais, são especialmente apropriados, por exemplo, HCl, HBr, H_2SO_4 ou HNO_3 .

Pela expressão "dissolventes inertes" referida nas variantes de processo mencionadas antes, significam-se respectivamente dissolventes que, nas condições respectivas de realização da reacção, são inertes, muito embora possam não ser inertes em todas as condições de realização da reacção.

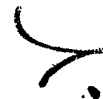
Os compostos de fórmula geral (I) de acordo com a presente invenção possuem uma actividade herbicida acentuada contra um largo espectro de plantas daninhas monocotiledóneas ou dicotiledóneas economicamente importantes. Também eliminam ervas daninhas perenes difficilmente atacáveis que se desenvolvem por rizomas, pedaços de raízes ou outros órgãos duradouros. Nesse caso é indiferente que as substâncias sejam aplicadas pelo processo antes da sementeira, antes da emergência ou depois da emergência. Pormenorizadamente, mencionam-se, por exemplo, alguns tipos de flora de ervas daninhas monocotiledóneas e dicotiledóneas que podem ser controladas pelos compostos de acordo com a presente invenção sem que se pretenda realizar uma restrição a determinados tipos por meio desta indicação.

Pelo que diz respeito a tipos de ervas daninhas monocotiledóneas, referem-se, por exemplo, as espécies Avena, Lolium, Alopecurus, Phalaris, Echinochloa, Digitaria, Setaria e Cyperus do grupo de ervas daninhas anuais, e relativamente às espécies perenes, referem-se Agropyron, Cynodon, Imperata e Sorghum e também espécies de Cyperus duradoiras.

Nas espécies de ervas dicotiledóneas, o espectro de acção alarga-se a espécies como, por exemplo, Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Matricaria, Abutilon e Sida das espécies anuais, assim como às espécies Convolvulus, Cirsium, Rumex e Artemisia das ervas daninhas perenes.

As ervas daninhas que existem nas condições de cultura específicas do arroz, como, por exemplo, Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus e Cyperus, são igualmente bem atacadas pelas substâncias activas de acordo com a presente invenção.

Se os compostos de acordo com a presente invenção forem aplicados sobre a superfície do terreno antes da germinação, então evita-se completamente o desabrochar das plantículas dos germes das ervas daninhas ou as ervas daninhas desenvolvem-se até à fase de formação de folhas e, no entanto, verifica-se a dificuldade do seu crescimento e finalmente morrem depois de decorrerem três a quatro semanas.



No caso da aplicação das substâncias activas sobre as partes verdes das plantas num processo de pós-emergência, verifica-se igualmente uma muito rápida e drástica interrupção de desenvolvimento depois do tratamento e as plantas daninhas permanecem no estágio de desenvolvimento existente no momento da aplicação ou morrem completamente depois de um determinado intervalo de tempo de modo que desta maneira se elimina a concorrência prejudicial de ervas daninhas em relação às plantas de cultura muito cedo e que se mantém posteriormente.

Não obstante os compostos de acordo com a presente invenção possuírem uma actividade herbicida excelente contra ervas daninhas monocotiledóneas e dicotiledóneas, as plantas de cultura de culturas economicamente importantes, como, por exemplo, trigo, cevada, centeio, arroz, milho, beterraba-açucareira, algodão e soja, são apenas muito ligeiramente prejudicadas ou absolutamente nada prejudicadas. Os compostos de acordo com a presente invenção são portanto apropriados por estas razões para o combate selectivo do desenvolvimento de plantas indesejadas em culturas de plantas úteis de interesse económico agrícola.

Além disso, as substâncias de acordo com a presente invenção possuem excelentes propriedades de regulação do crescimento em plantas de cultura. Elas actuam de maneira a regular o metabolismo de substâncias nas próprias plantas e podem, por

consequência, influenciar substâncias contidas nas plantas e serem empregadas para facilitar as colheitas como, por exemplo, por provocarem a dissecação e a eliminação do desenvolvimento. Além disso, são apropriadas também para o controle geral e a inibição de desenvolvimento vegetativo indesejado, sem que as plantas sejam mortas. A inibição do desenvolvimento vegetativo representa um papel muito importante em muitas culturas de plantas monocotiledôneas e dicotiledôneas porque se pode diminuir dessa forma a armazenagem ou eliminá-la completamente.

Os compostos de acordo com a presente invenção podem ser utilizados sob a forma de pós molháveis, concentrados emulsionáveis, soluções pulverizáveis, pós para polvilhação ou grânulos nas formulações correntes. São portanto também objecto da presente invenção composições herbicidas e composições reguladoras do crescimento das plantas que contêm compostos de fórmula geral (I) ou os seus sais.

Os compostos de fórmula geral (I) podem ser formulados de diversas maneiras, de acordo com os parâmetros biológicos e/ou físico-químicos que se prevêem. Como possibilidades de formulação, interessam, por exemplo, pós molháveis (WP), pós solúveis em água (SP), concentrados solúveis em água, concentrados emulsionáveis (EC), emulsões (EW), tais como emulsões do tipo óleo-em-água e do tipo água-em-óleo, soluções pulverizá-

veis, concentrados em suspensão (SC), dispersões à base de óleo ou à base de água, soluções miscíveis com óleos, suspensões de cápsulas (CS), agentes para polvilhação (DP), agentes de cauterização, grânulos para aplicação na palha e no terreno, grânulos (GR) sob a forma de microgrânulos, grânulos para pulverização, grânulos para aplicação e grânulos de absorção, grânulos dispersáveis em água (WG), grânulos solúveis em água (SG), formulações de volume extra-pequeno (ULV), microcápsulas e ceras.

Estes tipos de formulações individuais são conhecidos, em princípio, e são descritos, por exemplo, em Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Vol. 7, C. Hauser Verlag München, 4ª Edição, 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N. Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3ª Edição, 1979, G. Goodwin, Ltd., Londres.

Os agentes auxiliares das formulações necessários, tais como materiais inertes, agentes tensio-ativos, dissolventes e outros aditivos são igualmente conhecidos e estão descritos, por exemplo, em Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers" 2ª Edição, Darland Books, Caldwell, N. J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2ª Edição, J. Wiley and Sons, N. Y.; C. Marsden, "Solvents Guide", 2ª Edição, Interscience, N. Y., 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ., Corp., Ridgewood,

N. J.; Sisley and Wood "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co., INC., N. Y., 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart, 1976; Winnaker-Küchler, "Chemische Technologie", Vol. 7, C. Hauser Verlag, München, 4ª Edição, 1986.

À base destas formulações, podem preparar-se combinações com outras substâncias activas sob o ponto de vista pestiçada, adubos e/ou agentes reguladores do crescimento, por exemplo sob a forma de uma formulação pronta ou sob a forma de mistura em tanque.

Os pós molháveis são preparados uniformemente dispersáveis em água, que juntamente com a substância activa e ainda o agente diluente ou inerte, contêm ainda agentes molhantes, por exemplo alquil-fenóis polioxietilados, álcoois gordos e aminas gordas polioxietilados, sulfatos de éter de álcool gordo poliglicólicos, alcano-sulfonatos ou alquil-benzeno-sulfonatos, e agentes dispersantes, por exemplo, sal de sódio do ácido lignino-sulfónico, sal de sódio do ácido 2,2'-dinaftil-metano-6,6'-dissulfónico, sal de sódio do ácido dibutil-naftaleno-sulfónico ou também sal de sódio de oleil-metil-aurina.

Os concentrados emulsionáveis são preparados por dissolução da substância activa num dissolvente orgânico como, por exemplo, butanol, ciclo-hexanona, dimetil-formamida, xileno

ou também hidrocarbonetos aromáticos de elevado ponto de ebulição ou outros hidrocarbonetos, com adição de um ou mais agentes emulsionantes. Como agentes emulsionantes podem utilizar-se, por exemplo, sais de cálcio de ácido alquil-aril-sulfônico como dodecil-benzeno-sulfonato de cálcio ou agentes emulsionantes não iônicos, como ésteres de poliglicol de ácidos gordos, éteres alquil-aril-poliglicólicos, éteres de álcool gordo-poliglicólicos, produtos da condensação de óxido de propileno-óxido de etileno, poliéteres alquílicos, ésteres de ácidos gordos de sorbitano, ésteres de ácidos gordos de polioxietileno-sorbitano ou ésteres de polioxietileno-sorbite.

Obtêm-se os pós para polvilhação por moagem da substância activa com substâncias sólidas finamente subdivididas, por exemplo talco, argilas naturais como caulino, bentonite e pirofilite, ou terra de diatomáceas.

Os grânulos podem obter-se por espalhamento de uma solução da substância activa sobre material inerte granulado com capacidade de absorção ou por aplicação de concentrados de substância activa por meio de agentes adesivos, por exemplo álcool polivinílico, sal de sódio do ácido poliacrílico ou também por meio de óleos minerais, sobre a superfície de substâncias veiculares, como areia, caulinite ou material inerte granulado. Também se podem granular substâncias activas apropriadas pela maneira de proceder corrente para a preparação de

grânulos de adubos - caso assim se pretenda, em mistura com adubos.

As composições agro-químicas contêm, em geral, entre 0,1 % e 99 % em peso, especialmente entre 0,1 % e 95 % em peso de substância activa de fórmula geral (I).

Nos pós molháveis, a concentração de substância activa está compreendida, por exemplo, entre cerca de 10 % e 90 % em peso, consistindo a parte restante até perfazer 100 % em peso nos componentes usuais da formulação. Nos concentrados emulsionáveis, a concentração de substância activa pode estar compreendida entre cerca de 1 % e 85 % em peso, na maior parte das vezes entre 5 % e 80 % em peso. As formulações sob a forma de pó contêm cerca de 1 % a 25 % em peso, na maior parte das vezes 5 % a 20 % em peso, de substância activa; as soluções pulverizáveis contêm entre cerca de 0,2 % e 20 % em peso, na maior parte das vezes entre 2 % e 20 % em peso de substância activa. No caso dos grânulos, o teor de substância activa depende parcialmente do facto de o composto activo ser líquido ou sólido. Regra geral, o teor de substância activa nos grânulos dispersáveis em água está compreendido entre 10 % e 90 % em peso.

Além disso, as mencionadas formulações de substância activa contêm eventualmente os agentes de adesão, molhantes,

dispersantes, emulsionantes, auxiliares de penetração, dissolventes, cargas ou substâncias veiculares usuais.

Para utilização, as formulações existentes sob a forma corrente no comércio são diluídas eventualmente de acordo com a maneira de proceder usual, por exemplo, no caso dos pós molháveis, concentrados emulsionáveis, dispersões e grânulos dispersáveis em água, por meio de água. As composições com a forma de pós, grânulos para aplicação no terreno ou na palha, assim como soluções pulverizáveis, geralmente não são diluídas com outras substâncias inertes antes da utilização.

As quantidades de utilização necessárias dos compostos de fórmula geral (I) variam com as condições externas, como temperatura, humidade, tipo de herbicida utilizado, etc.. Elas podem variar entre limites afastados, por exemplo entre 0,001 e 10,0 quilogramas por hectare ou mais de substância activa; no entanto, de preferência, fica compreendida entre 0,005 e 5 kg/ha.

São igualmente possíveis misturas ou formulações de misturas com outras substâncias activas, como, por exemplo, insecticidas, acaricidas, herbicidas, agentes de protecção das plantas úteis, adubos, agentes reguladores do crescimento ou fungicidas.

EXEMPLOS

A. EXEMPLOS QUÍMICOS

EXEMPLO 1

2-benziltio-3-iodopiridina

Aquece-se a refluxo durante oito horas uma solução de 34,0 gramas (0,15 mole) de 2-fluoro-3-iodo-piridina e 18,6 gramas (0,15 mole) de benzil-mercaptano no seio de 250 ml de acetonitrilo com 22,8 gramas (0,165 mole) de carbonato de potássio. Arrefece-se, elimina-se o dissolvente no evaporador rotativo, retoma-se o resíduo em diclorometano e lava-se a fase orgânica com água. Após secagem com sulfato de sódio, evaporação e destilação sob vazio do resíduo oleoso, obtêm-se 37,3 gramas (76 % da teoria) de 2-benziltio-3-iodopiridina com o ponto de ebulição igual a 150° - 153° C a 0,1 mbar.

EXEMPLO 2

3-iodo-2-piridino-sulfonamida

Sobre uma mistura de 25,0 gramas (76,5 milimoles) de 2-benziltio-3-iodopiridina, 125 ml de diclorometano, 60 ml de

água e 38 ml de ácido clorídrico concentrado, adicionam-se, gota a gota, a 0° C, 510 ml (0,34 mole) de uma solução aquosa a 5 % de hipoclorito de sódio. Agita-se a 0° C durante trinta minutos, extrai-se três vezes com 100 ml de diclorometano de cada vez e seca-se a fase orgânica com sulfato de sódio. Arrefece-se a solução assim obtida a -20° C. A esta temperatura, faz-se passar uma corrente de 6,8 gramas (0,4 mole) de amoníaco durante vinte minutos, agita-se a -20° C durante duas horas e deixa-se aquecer até à temperatura ambiente. Lava-se com água a mistura reaccional, seca-se a fase orgânica e evapora-se até à secura. A trituração do resíduo com éter di-isopropílico origina 15,5 gramas (71 % da teoria) de 3-iodo-2-piridina-sulfonamida com o ponto de fusão igual a 247° - 250° C (decomposição).

EXEMPLO 3

3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1-(3-iodo-2-piridil-sulfonil)-ureia

A uma suspensão de 2,1 gramas (7,4 milimoles) de 3-iodo-2-piridina-sulfonamida e 2,2 gramas (8,1 milimoles) de N-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-fenil-carbamato em 30 ml de acetonitrilo adicionam-se 1,2 gramas (0,081 mole) de 1,8-diaza-biciclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU). Agita-se a solução resultante

à temperatura ambiente durante quarenta e cinco minutos e, em seguida, adicionam-se 20 ml de água. Acidula-se a pH 4 com ácido clorídrico e filtra-se o produto que precipita. Obtêm-se 3,2 gramas (93 % da teoria) de 3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1-(3-iodo-2-piridil-sulfonil)-ureia com o ponto de fusão igual a 161° - 162° C (decomposição).

EXEMPLO 4

3-dimetil-sulfamoiloxi-2-piridina-sulfonamida

Sobre uma mistura de 5,7 gramas (17,6 milimoles) de 2-benziltio-3-dimetil-sulfamoiloxi-piridina, 30 ml de diclorometano, 15 ml de água e 8,5 ml de ácido clorídrico concentrado, deixam-se cair, gota a gota, a 0° C, 107 ml (72 milimoles) de uma solução aquosa a 5 % de hipoclorito de sódio. Agita-se a 0° C durante trinta minutos, extrai-se três vezes com 20 ml de diclorometano de cada vez e seca-se a fase orgânica com sulfato de sódio. Arrefece-se a solução assim obtida a -70° C. A esta temperatura, faz-se passar uma corrente de amoníaco até a mistura reaccional possuir uma reacção nitidamente alcalina. Depois de se agitar a -70° C durante três horas, deixa-se aquecer até à temperatura ambiente e lava-se com água. Seca-se a fase orgânica e evapora-se. Obtêm-se 3,0 gramas (61 % da teoria) de 3-dimetil-sulfamoiloxi-2-piridina-sulfonamida.

Espectro de ressonância magnética nuclear (CDCl_3) :

δ (ppm) = 3,06 [s, 6H, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$]; 5,80 (s, 2H, NH_2);
7,48 (dd, 1H); 7,98 (dd, 1H); 8,38 (dd, 1H).

EXEMPLO 5

3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1-(3-dimetil-sulfamoiloxi-2-piridil-sulfonil)-ureia

A uma suspensão de 3,0 gramas (10,6 milimoles) de 3-dimetil-sulfamoiloxi-2-piridina-sulfonamida e 3,4 gramas (12,7 milimoles) de N-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-fenil-carbamato em 40 ml de acetonitrilo adicionam-se 1,9 gramas (12,7 milimoles) de 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU). Agita-se a solução resultante à temperatura ambiente durante uma hora e, em seguida, adicionam-se 30 ml de água. Acidula-se a pH 4 com ácido clorídrico e separa-se por filtração sob sucção o produto que precipitou. Depois de se triturar com éter dietílico, obtêm-se 2,1 gramas (42 % da teoria) de 3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1-(3-dimetil-sulfamoiloxi-2-piridil-sulfonil)-ureia com o ponto de fusão igual a 155° - 157° C.



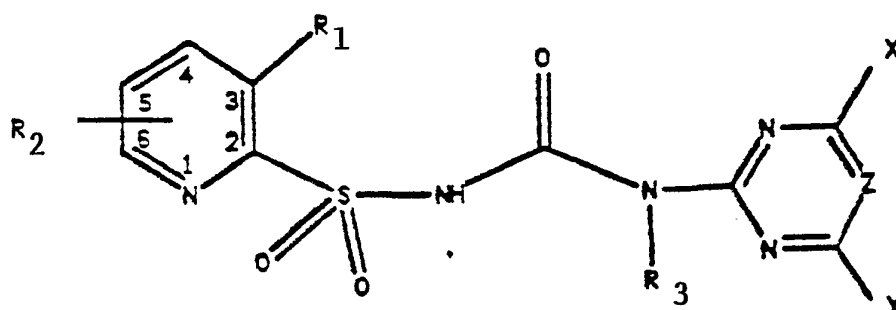
EXEMPLO 6

3-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-1-(3-iodo-2-piridil-sulfo-
nil)-ureia

Sobre 4,3 gramas (15 milimoles) de 3-iodo-2-piridina-sulfonamida em 150 ml de diclorometano adicionam-se, gota a gota, à temperatura ambiente 9,0 ml (18 milimoles) de uma solução 2 molar de trimetil-alumínio em tolueno. Depois de terminada a libertação de gases, adicionam-se gota a gota 3,85 gramas (18 milimoles) de metil-4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il-carbamato em 20 ml de diclorometano e aquece-se a solução resultante a refluxo durante vinte a quatro horas. Arrefece-se e despeja-se a mistura reaccional em 150 ml de ácido clorídrico 1 N arrefecido com gelo. Separa-se a fase orgânica e extrai-se a fase aquosa duas vezes com diclorometano. Seca-se a fase orgânica e evapora-se. Depois de se triturar o produto bruto com éter dietílico, obtêm-se 3,1 gramas (44 % da teoria) de 3-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-1-(3-iodo-2-piridil-sulfonyl)-ureia com o ponto de fusão igual a 155° C (decomposição).

Os compostos dos seguintes Quadros 1 a 4 são obtidos procedendo de maneira análoga à que se descreveu nos Exemplos 1 a 6.

QUADRO 1



Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
1	I	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	161-162 (decompo- sição)
2	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
3	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
4	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	186 (decomposição)
5	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	177-178
6	"	H	H	CH ₃	CH ₃	N	156-157 (decompo- sição)
7	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
8	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
9	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	155 (decompo- sição)
10	"	H	H	OCF ₂ H	CH ₃	CH	
11	"	H	H	OCF ₂ H	OCF ₂ H	CH	
12	"	H	H	OCH ₃	Br	CH	
13	"	H	H	OCH ₃	OC ₂ H ₅	CH	
14	"	H	H	OCH ₃	SCH ₃	CH	
15	"	H	H	OCH ₃	OC ₂ H ₅	N	
16	"	H	H	OCH ₃	OC ₃ H ₇	CH	
17	"	H	H	OCH ₃	Cl	N	
18	"	H	H	Cl	OC ₂ H ₅	CH	
19	"	H	H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	CH	
20	"	H	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH	
21	"	H	H	CF ₃	OCH ₃	CH	
22	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	CH ₃	CH	
23	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
24	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	OCH ₂ CF ₃	CH	
25	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	OCH ₃	N	
26	"	H	H	OCH ₃	CH(OCH ₃) ₂	CH	
27	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
28	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
29	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
30	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
31	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
32	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
33	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
34	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
35	"	5-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
36	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
37	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
38	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
39	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
40	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
41	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
42	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
43	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
44	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
45	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
46	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
47	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
48	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
49	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
50	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
51	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
52	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
53	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
54	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
55	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
56	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
57	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
58	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
59	"	5-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
60	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
61	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
62	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
63	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
64	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
65	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
66	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
67	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
68	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
69	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
70	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
71	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
72	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
73	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
74	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
75	"	4-CF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
76	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
77	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
78	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
79	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
80	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
81	"	4-F	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
82	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
83	"	5-CF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
84	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
85	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
86	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
87	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
88	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
89	"	5-F	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	

4.

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
90	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
91	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
92	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
93	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
94	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
95	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
96	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
97	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
98	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
99	"	4-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
100	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
101	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
102	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
103	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
104	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
105	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
106	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
107	"	5-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
108	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
109	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
110	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
111	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
112	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
113	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
114	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
115	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
116	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
117	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
118	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
119	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
120	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
121	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
122	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
123	"	6-C ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
124	"	6-C ₄ H ₉	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
126	"	6-OC ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
127	"	6-OCH ₂ CF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
128	"	6-SCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
129	"	6-SO ₂ CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
130	"	6-NO ₂	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
131	"	6-CO ₂ CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
132	"	6-Br	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
133	"	6-CF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
134	"	6-OCF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
135	"	6-OCF ₂ H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
136	-OSO ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	155-157
137	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
138	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
139	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
140	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
141	"	H	H	CH ₃	CH ₃	N	
142	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	137-138 (decompo
143	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	sicção)
144	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
145	"	H	H	OCF ₂ H	CH ₃	CH	
146	"	H	H	OCF ₂ H	OCF ₂ H	CH	
147	"	H	H	OCH ₃	Br	CH	
148	"	H	H	OCH ₃	OC ₂ H ₅	CH	
149	"	H	H	OCH ₃	SCH ₃	CH	
150	"	H	H	OCH ₃	OC ₂ H ₅	N	
151	"	H	H	OCH ₃	OC ₃ H ₇	CH	
152	"	H	H	OCH ₃	Cl	N	
153	"	H	H	Cl	OC ₂ H ₅	CH	
154	"	H	H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	CH	
155	"	H	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH	
156	"	H	H	CF ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
157	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	CH ₃	CH	
158	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	OCH ₃	CH	
159	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	OCH ₂ CF ₃	CH	
160	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	OCH ₃	N	
161	"	H	H	OCH ₃	CH(OCH ₃) ₂	CH	
162	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
163	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
164	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
165	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
166	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
167	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
168	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
169	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
170	"	5-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
171	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
172	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
173	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
174	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
175	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
176	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
177	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
178	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
179	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
180	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
181	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
182	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
183	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
184	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
185	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
186	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
187	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
188	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
189	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
190	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
191	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
192	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
193	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
194	"	5-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
195	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
196	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
197	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
198	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
199	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
200	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
201	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
202	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
203	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
204	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
205	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
206	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
207	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
208	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
209	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
210	"	4-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
211	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
212	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
213	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
214	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
215	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
216	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
217	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
218	"	5-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
219	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
220	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
221	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
222	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
223	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
224	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
225	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
226	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
227	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
228	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
229	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
230	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
231	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
232	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
233	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
234	"	4-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
235	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
236	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
237	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
238	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
239	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
240	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
241	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
242	"	5-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
243	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
244	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
245	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
246	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
247	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
248	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
249	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
250	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

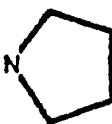
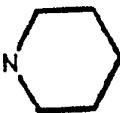
Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
251	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
252	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
253	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
254	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
255	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
256	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
257	"	"	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
258	"	6-C ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
259	"	6-C ₄ H ₉	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
260	"	6-OC ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
261	"	6-OCH ₂ CF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
262	"	6-SCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
263	"	6-SO ₂ CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
264	"	6-NO ₂	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
265	"	6-CO ₂ CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
266	"	6-Br	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
267	"	6-CF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
268	"	6-OCF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
269	"	6-OCF ₂ H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
270	-OSO ₂ N	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \diagup \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH
271	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
272	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
273	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
274	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
275	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
276	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
277	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
278	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
279	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
280	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
281	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

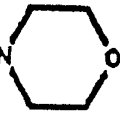
Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
282	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
283	-OSO ₂ N(CH ₃)OCH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
284	-OSO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{CH}_3 \\ \diagdown \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
285	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
286	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
287	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
288	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
289	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
290	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
291	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
292	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
293	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
294	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
295	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
296	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
297	-OSO ₂ N(Allyl) ₂	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
298	-OSO ₂ N $\begin{array}{l} \diagup \text{C}_2\text{H}_5 \\ \diagdown \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	157-158
299	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	151-153 (decompo
300	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	sição)
301	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	159-160 (decompo
302	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	sição)
303	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	146-149 (decompo
304	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	sição)
305	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
306	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
307	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
308	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
309	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
310	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
311	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
312	-OSO ₂ N 	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	158-159
313	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	170-171
314	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
315	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	169-170
316	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
317	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	155
318	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
319	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
320	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
321	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
322	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
323	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
324	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
325	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
326	-OSO ₂ N 	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	173-174 (decompo sição)
327	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
328	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
329	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	185-186 (decompo sição)
330	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
331	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
332	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
333	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
334	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
335	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
336	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
337	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
338	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
339	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
340	-OSO ₂ N 	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	141-142 (decomposição)
341	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
342	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
343	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
344	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
345	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
346	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
347	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
348	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
349	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
350	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
351	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
352	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
353	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
354	-NHSO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	191-192 (decom- posição)
355	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
356	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
357	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
358	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
359	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
360	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
361	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
362	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
363	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
364	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
365	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
366	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
367	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
368	-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
369	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
370	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
371	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
372	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
373	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
374	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
375	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
376	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
377	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
378	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
379	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
380	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
381	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
382	-NHSO ₂ C ₃ H ₇	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
383	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
384	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
385	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
386	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
387	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
388	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
389	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
390	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
391	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
392	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
393	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
394	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
395	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
396	-NHSO ₂ C ₈ H ₅	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
397	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
398	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
399	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
401	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
402	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
403	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
404	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
405	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
406	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
407	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
408	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
409	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
410	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
411	-N(SO ₂ CH ₃) ₂	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	219-220 (decom- posição)
412	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
413	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
414	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
415	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
416	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
417	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
418	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
419	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
420	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
421	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
422	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
423	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
424	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
425	-N(SO ₂ C ₂ H ₅) ₂	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
426	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
427	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
428	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
429	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
430	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
431	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
432	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
433	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
434	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
435	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
436	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

-44-

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
437	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
438	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
439	-N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	177-178
440	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	152-153
441	"	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	N	
442	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	185-186 (decom.)
443	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	169-170 (decom.)
444	"	H	H	CH ₃	OC ₂ H ₅	CH	
445	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	158-159 (decom.)
446	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	173-174 (decom.)
447	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	167-169
448	"	H	H	OCF ₂ H	CH ₃	CH	
449	"	H	H	OCF ₂ H	OCF ₂ H	CH	
450	"	H	H	OCH ₃	Br	CH	
451	"	H	H	OCH ₃	OC ₂ H ₅	CH	
452	"	H	H	OCH ₃	SCH ₃	CH	
453	"	H	H	OCH ₃	OC ₂ H ₅	N	
454	"	H	H	OCH ₃	OC ₃ H ₇	CH	
455	"	H	H	CH ₃	Cl	CH	168-169 (decom- posição)
456	"	H	H	Cl	OC ₂ H ₅	CH	
457	"	H	H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	CH	
458	"	H	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH	
459	"	H	H	CF ₃	OCH ₃	CH	
460	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	CH ₃	CH	
461	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	OCH ₃	CH	
462	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	OCH ₂ CF ₃	CH	
463	"	H	H	OCH ₂ CF ₃	OCH ₃	N	
464	"	H	H	OCH ₃	CH(OCH ₃) ₂	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
465	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
466	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
467	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
468	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
469	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
470	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
471	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
472	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
473	"	5-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
474	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
475	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
476	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
477	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
478	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
479	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
480	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
481	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	185
482	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
483	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
484	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
485	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
486	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
487	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
488	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
489	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
490	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
491	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
492	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
493	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
494	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
495	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
496	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
497	"	5-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
498	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
499	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
500	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
501	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
502	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
503	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
504	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
505	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
506	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
507	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
508	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
509	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
510	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
511	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
512	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
513	"	4-CF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
514	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
515	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
516	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
517	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
518	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
519	"	4-F	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
520	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
521	"	5-CF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
522	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
523	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
524	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
525	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
526	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
527	"	5-F	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
528	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
529	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
530	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
531	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
532	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
533	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
534	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
535	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
536	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
537	"	4-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
538	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
539	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
540	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
541	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
542	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
543	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
544	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
545	"	5-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
546	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
547	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
548	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
549	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
550	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
551	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
552	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
553	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
554	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
555	"	"	H	OCH ₃	Cl	CH	
556	"	"	H	CH ₃	CH ₃	CH	
557	"	"	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
558	"	"	H	OCH ₃	CH ₃	N	
559	"	"	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
560	"	"	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
561	"	6-C ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
562	"	6-C ₄ H ₉	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
563	"	6-OC ₂ H ₅	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
564	"	6-OCH ₂ CF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
565	"	6-SCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
566	"	6-SO ₂ CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
567	"	6-NO ₂	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
568	"	6-CO ₂ CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
569	"	6-Br	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
570	"	6-CF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
571	"	6-OCF ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
572	"	6-OCF ₂ H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
573	-N(Et)SO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	188 (decompo
574	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	sicão)
575	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
576	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
577	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
578	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
579	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
580	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
581	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
582	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
583	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
584	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
585	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
586	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	182-183 (decom.)
587	-N(Pr)SO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
588	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
589	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
590	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
591	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
592	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	

4.

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
593	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
594	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
595	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
596	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
597	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
598	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
599	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
600	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
601	-N(i-Pr)SO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	195 (decom.)
602	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
603	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
604	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
605	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
606	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
607	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
608	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
609	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
610	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
611	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
612	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
613	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
614	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
615	-N(i-Bu)SO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	166-167
616	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
617	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
618	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
619	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
620	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
621	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
622	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
623	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
624	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
625	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
626	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
627	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
628	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
629	-N(CF ₃)SO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
630	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
631	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
632	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
633	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
634	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
635	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
636	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
637	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
638	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
639	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
640	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
641	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
642	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
643	-N(CHF ₂)SO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
644	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
645	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
646	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
647	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
648	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
649	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
650	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
651	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
652	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
653	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
654	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
655	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
656	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
657	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{CF}_3 \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
658	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
659	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
660	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
661	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
662	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
663	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
664	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
665	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
666	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
667	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
668	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
669	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
670	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
671	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl} \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
672	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
673	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
674	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
675	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
676	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
677	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
678	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
679	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
680	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
681	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
682	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
683	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
684	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
685	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3 \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
686	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
687	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
688	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
689	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
690	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
691	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
692	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
693	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
694	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
695	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
696	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
697	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
698	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
699	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{SCH}_3 \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
700	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
701	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
702	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
703	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
704	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
706	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
707	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
708	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
709	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
710	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
711	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
712	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
713	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
714	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3 \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
715	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
716	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
717	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
718	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
719	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
720	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
721	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
722	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
723	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
724	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
725	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
726	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
727	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
728	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3 \\ \diagup \\ \text{N} \\ \diagdown \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
729	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
730	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
731	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
732	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
733	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
734	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
735	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
736	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
737	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
738	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
739	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
740	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
741	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

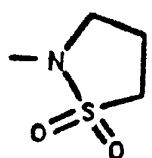
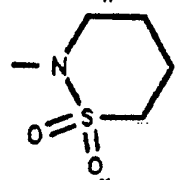
Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
742	$\text{N} \begin{array}{l} \text{CH}_2\text{CN} \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
743	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
744	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
745	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
746	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
747	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
748	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
749	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
750	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
751	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
752	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
753	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
754	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
755	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
756	$\text{N} \begin{array}{l} \text{Alilo} \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	208-210 (decom posição)
757	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
758	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
759	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
760	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
761	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
762	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
763	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
764	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
765	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
766	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
767	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
768	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
769	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
--------------------	----------------	----------------	----------------	---	---	---	------------------------

770	$\text{N} \begin{cases} \text{Propargilo} \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{cases}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	167-168 (decomposição)
771	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
772	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
773	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
774	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
775	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
776	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
777	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
778	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
779	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
780	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
781	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
782	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
783	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
784	$\text{N} \begin{cases} \text{COCH}_3 \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{cases}$	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
785	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
786	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
787	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
788	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
789	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
790	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
791	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
792	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
793	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
794	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
795	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
796	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
797	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
798		H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	195 (decomposição)
799	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
800	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
801	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
802	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
803	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
804	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
805	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
806	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
807	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
808	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
809	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
810	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
811	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
812		H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	192-193 (decomposição)
813	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
814	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
815	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
816	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
817	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
818	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
819	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
820	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
821	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
822	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
823	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
824	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
825	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	



Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
826	-N(OCH ₃)SO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
827	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
828	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
829	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
830	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
831	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
832	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
833	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
834	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
835	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
836	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
837	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
838	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
839	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
840	-N(CH ₃)SO ₂ CF ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
841	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
842	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
843	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
844	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
845	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
846	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
847	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
848	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
849	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
850	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
851	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
852	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
853	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

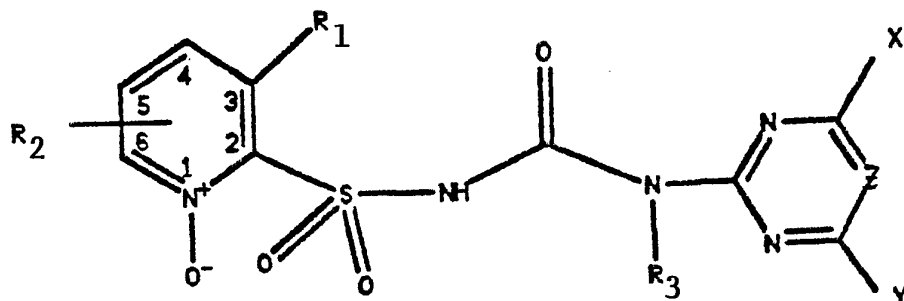
Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
854	-N(CH ₃)SO ₂ Et	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	176-177
855	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
856	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
857	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
858	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
859	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
860	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
861	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
862	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
863	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
864	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	193-194 (decom
865	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	posição)
866	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
867	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
868	-N(CH ₃)SO ₂ Ph	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
869	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
870	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
871	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
872	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
873	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
874	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
875	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
876	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
877	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
878	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
879	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
880	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
881	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 1

Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
882	-N(CH ₃)SO ₂ NMe ₂	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
883	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
884	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
885	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
886	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
887	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
888	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
889	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
890	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
891	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
892	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
893	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
894	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
895	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Quadro 2

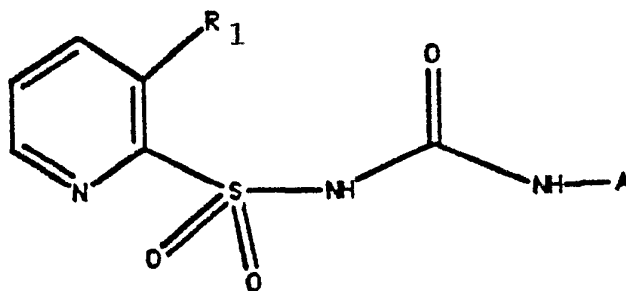


Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
896	I	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
897	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
898	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
899	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
900	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
901	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
902	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
903	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
904	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
905	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
906	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
907	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
908	"	4-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
909	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
910	"	4-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
911	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
912	-OSO ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
913	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
914	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
915	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
916	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
917	"	4-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

Continuação do Quadro 2

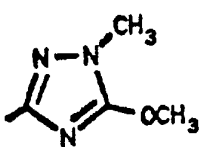
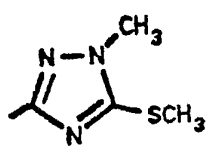
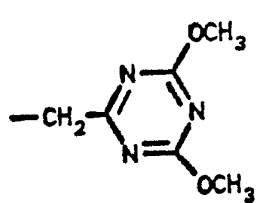
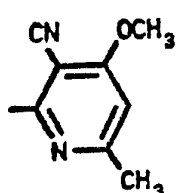
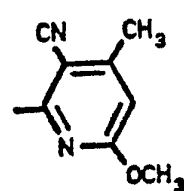
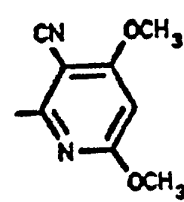
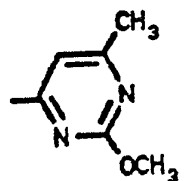
Composto Número	R ₁	R ₂	R ₃	X	Y	Z	Ponto de fusão [°C]
918	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
919	"	4-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
920	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
921	-N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
922	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	CH	
923	"	H	H	OCH ₃	Cl	CH	
924	"	H	H	CH ₃	CH ₃	CH	
925	"	H	H	OCH ₃	OCH ₃	N	
926	"	H	H	OCH ₃	CH ₃	N	
927	"	H	H	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	N	
928	"	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH	
929	"	4-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
930	"	6-CH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
931	"	4-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
932	"	6-Cl	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
933	"	4-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
934	"	6-F	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
935	"	4-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
936	"	6-OCH ₃	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
937	-NH ₂ SO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
938	-NH ₂ SO ₂ C ₂ H ₅	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
939	-N(SO ₂ CH ₃) ₂	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
940	-N(CH ₃)SO ₂ Et	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	
941	-N(Et)SO ₂ CH ₃	H	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	

QUADRO 3

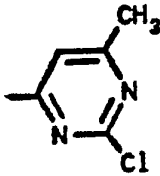
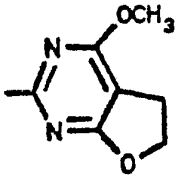
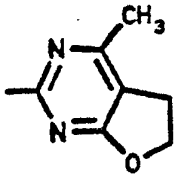
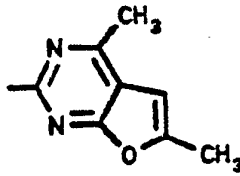
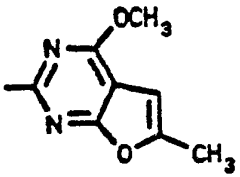
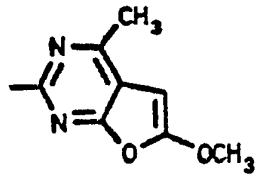


Composto Número	R ₁	A
942	I	
943	-OSO ₂ N(CH ₃) ₂	
944	I	
945	-OSO ₂ N(CH ₃) ₂	
946	I	

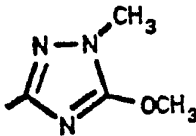
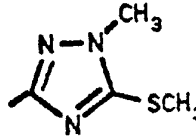
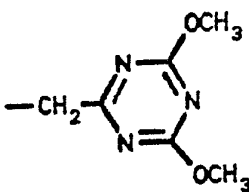
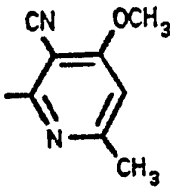
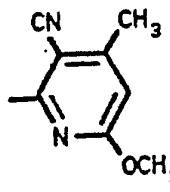
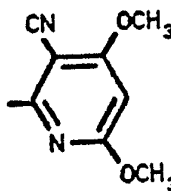
Continuação do Quadro 3

Composto Número	R ₁	A
947	-OSO ₂ N(CH ₃) ₂	
948	I	
949	-OSO ₂ N(CH ₃) ₂	
950	I	
951	-OSO ₂ N(CH ₃) ₂	
952	I	
953	-OSO ₂ N(CH ₃) ₂	

Continuação do Quadro 3

Composto Número	R ₁	A
954	I	
955	-N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	
956	"	
957	"	
958	"	
959	"	

Continuação do Quadro 3

Composto Número	R ₁	A
960	$-N(CH_3)SO_2CH_3$	
961	"	
962	"	
963	"	
964	"	
965	"	

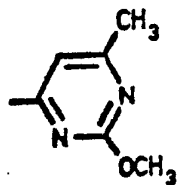
Continuação do Quadro 3

Composto
Número R_1

A

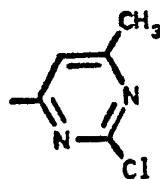
966

"

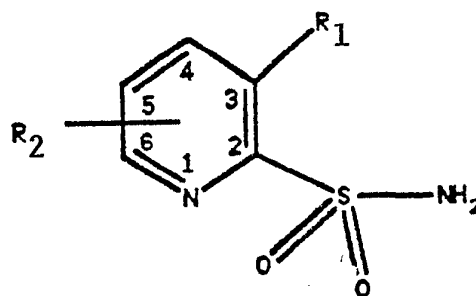


967

"



QUADRO 4

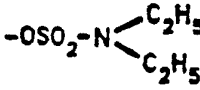
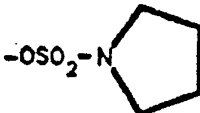
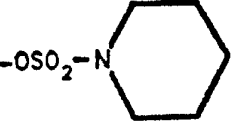
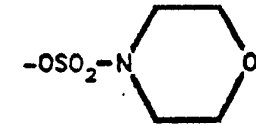


Composto Número	R ₁	R ₂	Ponto de fusão [°C]
968	I	H	247-250 (decomposição)
969	"	4-CH ₃	
970	"	5-CH ₃	
971	"	6-CH ₃	
972	"	4-OCH ₃	
973	"	5-OCH ₃	
974	"	6-OCH ₃	
975	"	4-Cl	
976	"	5-Cl	
977	"	6-Cl	
978	"	4-F	
979	"	5-F	
980	"	6-F	
981	"	6-C ₂ H ₅	
982	"	6-C ₄ H ₉	
983	"	6-OC ₂ H ₅	
984	"	6-OCH ₂ CF ₃	
985	"	6-SCH ₃	
986	"	6-SO ₂ CH ₃	
987	"	6-NO ₂	
988	"	6-CO ₂ CH ₃	
989	"	6-Br	
990	"	6-CF ₃	
991	"	6-OCF ₃	
992	"	6-OCF ₂ H	

Continuação do Quadro 4

Composto Número	R ₁	R ₂	Ponto de fusão [°C]
993	-OSO ₂ N(CH ₃) ₂	H	Óleo
994	"	4-CH ₃	
995	"	5-CH ₃	
996	"	6-CH ₃	
997	"	4-OCH ₃	
998	"	5-OCH ₃	
999	"	6-OCH ₃	
1000	"	4-Cl	
1001	"	5-Cl	
1002	"	6-Cl	
1002	"	4-F	
1004	"	5-F	
1005	"	6-F	
1006	"	6-C ₂ H ₅	
1007	"	6-C ₄ H ₉	
1008	"	6-OC ₂ H ₅	
1009	"	6-OCH ₂ CF ₃	
1010	"	6-SCH ₃	
1011	"	6-SO ₂ CH ₃	
1012	"	6-NO ₂	
1013	"	6-CO ₂ CH ₃	
1014	"	6-Br	
1015	"	6-CF ₃	
1016	"	6-OCF ₃	
1017	"	6-OCF ₂ H	
1018	-OSO ₂ -N $\begin{smallmatrix} \text{CH}_3 \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{smallmatrix}$	H	
1019	-OSO ₂ -N $\begin{smallmatrix} \text{CH}_3 \\ \text{C}_3\text{H}_7 \end{smallmatrix}$	H	

Continuação do Quadro 4

Composto Número	R ₁	R ₂	Ponto de fusão [°C]
1020		H	94-97
1021		H	142-143
1022		H	166-167
1023		H	Óleo
1024	-NHSO ₂ CH ₃	H	176-178
1025	-NHSO ₂ C ₂ H ₅	H	
1026	-NHSO ₂ C ₃ H ₇	H	
1027	-NHSO ₂ C ₆ H ₅	H	
1028	-N(SO ₂ CH ₃) ₂	H	208
1029	-N(SO ₂ C ₂ H ₅) ₂	H	
1030	-N(CH ₃)SO ₂ CH ₃	H	175
1031	"	4-CH ₃	
1032	"	5-CH ₃	
1033	"	6-CH ₃	124
1034	"	4-OCH ₃	
1035	"	5-OCH ₃	
1036	"	6-OCH ₃	
1037	"	4-Cl	
1038	"	5-Cl	
1039	"	6-Cl	
1040	"	4-F	
1041	"	5-F	

Continuação do Quadro 4

Composto Número	R ₁	R ₂	Ponto de fusão [°C]
1042	"	6-F	
1043	"	6-C ₂ H ₅	
1044	"	6-C ₄ H ₉	
1045	"	6-OC ₂ H ₅	
1046	"	6-OCH ₂ CF ₃	
1047	"	6-SCH ₃	
1048	"	6-SO ₂ CH ₃	
1049	"	6-NO ₂	
1050	"	6-CO ₂ CH ₃	
1051	"	6-Br	
1052	"	6-CF ₃	
1053	"	6-OCF ₃	
1054	"	6-OCF ₂ H	
1055	-N(Et)SO ₂ CH ₃	H	178-179 (decomposição)
1056	-N(Pr)SO ₂ CH ₃	H	149-150
1057	-N(i-Pr)SO ₂ CH ₃	H	201
1058	-N(i-Bu)SO ₂ CH ₃	H	amorfo
1059	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{CF}_3 \\ \diagup \\ \text{---N} \\ \diagdown \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	
1060	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl} \\ \diagup \\ \text{---N} \\ \diagdown \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	
1061	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3 \\ \diagup \\ \text{---N} \\ \diagdown \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	
1062	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{SCH}_3 \\ \diagup \\ \text{---N} \\ \diagdown \\ \text{SO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	H	

Continuação do Quadro 4

Composto Número	R ₁	R ₂	Ponto de fusão [°C]
1063		H	
1064		H	
1065		H	
1066		H	143-144
1067		H	138-141
1068		H	
1069		H	200 (decomposição)
1070		H	220-221 (decomposição)
1071	-N(OCH3)SO2CH3	H	
1072	-N(CH3)SO2C2H5	H	136-137
1073	-N(CH3)SO2CF3	H	
1074	-N(CH3)SO2Ph	H	200-203
1075	-N(CH3)SO2N(Me)2	H	

B. EXEMPLOS DE FORMULAÇÕES

- a) Obtém-se um pó para polvilhação misturando 10 partes em peso de um composto de fórmula geral (I) e 90 partes em peso de talco ou de outra carga inerte e mói-se num moinho de impacto.
- b) Obtém-se um pó molhável facilmente dispersável em água misturando 25 partes em peso de um composto de fórmula geral (I), 64 partes em peso de quartzo que contém caulino como substância inerte, 10 partes em peso de sal de potássio do ácido lignino-sulfônico e 1 parte em peso de sal de sódio de oleoil-metil-aurina como agentes molhantes e dispersantes e mói-se num moinho de varas.
- c) Obtém-se um concentrado em dispersão facilmente dispersável em água misturando 20 partes em peso de um composto de fórmula geral (I) com 6 partes em peso de éter alquil-fenol-poliglicólico ([®] Triton X 270), 3 partes em peso de éter isotridecanol-poliglicólico (8 unidades de óxido de etileno) e 71 partes em peso de óleo mineral parafínico (gama de ebulição, por exemplo, cerca de 255 até superior a 277⁰ C) e mói-se num moinho de esferas até se obter uma finura inferior a 5 micrómetros.
- d) Obtém-se um concentrado emulsionável a partir de 15 partes em peso de um composto de fórmula geral (I), 75

partes em peso de ciclo-hexano como dissolvente e 10 partes em peso de nonil-fenol oxietilado como agente emulsionante.

e) Obtém-se um granulado dispersável em água misturando

75 partes em peso de um composto de fórmula geral (I),

10 partes em peso de sal de cálcio do ácido lignino-sulfônico,

5 partes em peso de lauril-sulfato de sódio,

3 partes em peso de álcool polivinílico e

7 partes em peso de caulino,

mói-se num moinho de varas e granula-se o pó num leito turbilionar por pulverização de água como líquido de granulação.

f) Obtém-se um granulado dispersável em água também homogeneizando

25 partes em peso de um composto de fórmula geral (I),

5 partes em peso de sal de sódio do ácido 2,2'-dinaftil-
-metano-6,6'-dissulfônico,

2 partes em peso de sal de sódio de oleoil-metil-aurina,

1 parte em peso de álcool polivinílico,

17 partes em peso de carbonato de cálcio e

50 partes em peso de água,

num moinho coloidal e moendo; em seguida, mói-se num
moinho de pérolas e pulveriza-se a suspensão assim obtida
numa torre de pulverização através de um pulverizador e
seca-se.

- g) Obtém-se um granulado por extrusão misturando 20 partes
em peso de substância activa, 3 partes em peso de sal de
sódio do ácido lignino-sulfônico, 1 parte em peso de
carboximetil-celulose e 76 partes em peso de caulino,
mói-se e humedece-se com água. Submete-se esta mistura a
extrusão e, em seguida, seca-se em corrente de ar.

C. EXEMPLOS BIOLÓGICOS

1. Acção sobre as ervas daninhas num processo de pré-emergência

Colocaram-se sementes ou pedaços de rizoma de ervas daninhas monocotiledóneas e dicotiledóneas em vasos de plástico com terra argilosa e arenosa e recoberta com argila. Aplicaram-se depois os compostos de acordo com a presente invenção formulados sob a forma de pós molháveis ou de concentrados de emulsão sob a forma de suspensões ou de emulsões aquosas com uma quantidade de água aproximadamente igual a 600 a 800 litros por hectare em diferentes dosagens sobre a superfície da argila de cobertura.

Depois do tratamento, os vasos foram colocados em estufa e mantidos em boas condições de desenvolvimento das ervas daninhas. Realizou-se a classificação óptica das plantas ou dos prejuízos do crescimento depois da emergência das plantas de ensaio após um tempo de ensaio de três a quatro semanas em comparação com controlos não tratados. Os valores das classificações mostram que os compostos de acordo com a presente invenção possuem boa actividade herbicida de pré-emergência contra um largo espectro de ervas daninhas e de plantas daninhas (veja-se o Quadro 5).

QUADRO 5

**Acção de pré-emergência dos compostos de acordo com a
presente invenção**

Ex. Nº	Dose (kg de a.i./ha)	Actividade herbicida					
		LOMU	ECCR	AVSA	STME	CHSE	SIAL
1	0,3	5	5	5	5	5	5
136	0,3	5	5	4	5	5	5
4	0,3	5	5	5	5	5	5
411	0,3	5	5	5	5	5	5
354	0,3	5	5	5	5	5	5
439	0,3	5	5	5	5	5	5
312	0,3	4	4	2	4	4	5
326	0,3	2	2	2	3	3	4
7	0,3	5	5	5	5	5	5
299	0,3	5	5	4	5	5	5
443	0,3	5	5	5	5	5	5
301	0,3	2	2	2	2	2	3
298	0,3	5	5	4	5	5	5
313	0,3	3	3	2	4	3	5
446	0,3	5	3	5	4	3	5
445	0,3	5	4	5	5	2	4
756	0,3	5	5	5	5	5	5
442	0,3	5	5	5	5	5	5
455	0,3	3	2	2	3	3	5
770	0,3	5	5	5	5	5	5
854	0,3	5	5	5	5	5	5
8	0,3	5	5	5	5	5	5
5	0,3	5	5	5	5	5	5
142	0,3	5	5	5	5	5	5
340	0,3	5	5	3	5	5	5
573	0,3	5	5	5	5	5	5



ABREVIATURAS :

Ex. Nº = Exemplo de preparação dos Quadros 1 a 4.

a. i. = Ingrediente activo (relativamente à substância activa pura).

LOMU = Lolium multiflorum

ECGR = Echinochloa crus-galli

AVSA = Avena sativa

STME = Stellaria media

CHSE = Chrysanthemum segetum

STAL = Sinapis alba.

2. Acção sobre ervas daninhas num processo de pós-emergência

Colocaram-se sementes ou partes de rizomas de ervas daninhas monocotiledóneas e dicotiledóneas em terra argilosa e arenosa contida em vasos de plástico, recobriu-se com terra e colocaram-se em estufa sob boas condições de desenvolvimento. Três semanas depois da sementeira, trataram-se as plantas utili-

zadas no ensaio na fase de desenvolvimento de três folhas.

Pulverizaram-se compostos de acordo com a presente invenção formulados como pós molháveis ou como concentrados de emulsão, em diversas dosagens, com uma quantidade de água compreendida entre 600 e 800 litros por hectare, sobre as partes verdes das plantas e, depois de cerca de três a quatro semanas das plantas de ensaio em estufa em condições óptimas de desenvolvimento, classificou-se opticamente a acção dos preparados em comparação com controlos não tratados.

Os compostos de acordo com a presente invenção possuem também boa actividade herbicida no ensaio de pós-emergência contra um largo espectro de relvas e ervas daninhas de importância económica (veja-se o Quadro 6).


QUADRO 6

Ex. Nº	Dose (kg de a.i./ha)	Actividade herbicida					
		LOMU	ECCR	AVSA	STME	CHSE	SIAL
1	0,3	5	5	5	5	5	5
136	0,3	3	4	1	5	5	5
4	0,3	5	5	5	5	5	5
411	0,3	5	5	4	5	5	5
354	0,3	5	5	5	5	5	5
439	0,3	5	5	5	5	5	5
7	0,3	5	5	5	5	5	5
299	0,3	3	3	2	3	2	5
443	0,3	5	5	5	5	3	5
298	0,3	3	5	2	4	3	5
445	0,3	3	2	2	3	4	3
756	0,3	5	4	3	4	4	5
442	0,3	5	2	3	3	2	4
770	0,3	5	3	3	3	3	3
854	0,3	4	5	4	4	5	5
8	0,3	5	5	5	5	3	5
5	0,3	5	5	5	5	5	5
142	0,3	4	2	2	4	1	3
340	0,3	3	3	0	5	2	5
573	0,3	5	5	5	5	5	5

L.

ABREVIATURAS :

Ex. Nº = Exemplo de preparação dos Quadros 1 a 4.

a. i. = Ingrediente activo (em relação à substância activa pura).

LOMU = Lolium multiflorum

ECGR = Echinochloa crus-galli

AVSA = Avena sativa

STME = Stellaria media

CHSE = Chrysanthemum segetum

STAL = Sinapis alba.

3. Compatibilidade com as plantas de cultura

Em outros ensaios em estufa, colocaram-se sementes de um grande número de plantas de cultura e de ervas daninhas em terreno argiloso e arenoso e recobriram-se com argila.



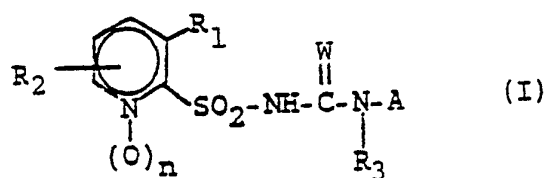
Tratou-se uma parte dos vasos imediatamente como se descreveu em 1., colocaram-se os restantes em estufa até as plantas desenvolverem duas a três folhas verdadeiras e, em seguida, pulverizaram-se com substâncias de acordo com a presente invenção em dosagens diferentes, como se descreveu em 2.

Quatro a cinco semanas depois da aplicação e de um tempo de repouso em estufa, realizou-se a classificação por meios ópticos, verificando-se que os compostos de acordo com a presente invenção em culturas de dicotiledóneas, como, por exemplo, soja, algodão, colza, beterraba-açucareira e batata, ficaram não atacadas tanto no processo de pré-mergência como no de pós emergência, mesmo para dosagens elevadas de substâncias activas.

Algumas substâncias comportaram-se também bem relativamente a culturas de gramíneas, como, por exemplo, cevada, trigo, centeio, sorgo, milho ou arroz. Os compostos de fórmula geral (I) apresentaram elevada selectividade na utilização para combate do desenvolvimento de plantas indesejadas em culturas com interesse económico agrícola.

REIVINDICAÇÕES -----

1.- Processo para a preparação de piridil-sulfonil-ureias de fórmula geral



na qual

o símbolo R_1 representa um átomo de iodo ou um grupo de fórmula geral $-\text{OSO}_2\text{NR}_4\text{R}_5$ ou $-\text{NR}_6\text{R}_7$;

o símbolo R_2 representa um átomo de hidrogénio ou de

halogéneo ou um grupo alquilo C_1-C_3 , halogenoalquilo C_1-C_3 , nitro, ciano, alcoxi C_1-C_3 , halogenoalcoxi C_1-C_3 , alquiltio C_1-C_3 , alcoxi(C_1-C_3)-alquilo C_1-C_3 , alcoxi(C_1-C_3)-carbonilo, alquil(C_1-C_3)-amino, dialquil(C_1-C_3)-amino, alquil(C_1-C_3)-sulfinilo, alquil(C_1-C_3)-sulfonilo ou um grupo de fórmula geral $SO_2NR_aR_b$ ou $C(O)NR_aR_b$;

os símbolos R_a e R_b , independentemente um do outro, representam, cada um, um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C_1-C_3 , alcenilo C_3-C_4 ou propargilo, ou em conjunto representam um dos grupos com as fórmulas $-(CH_2)_4-$, $-(CH_2)_5-$ ou $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$;

o símbolo R_3 representa um átomo de hidrogénio ou um grupo metilo;

o símbolo R_4 representa um átomo de hidrogénio ou um radical alquilo C_1-C_3 , alcenilo C_3-C_4 , alcoxi C_1-C_3 ou alcinilo C_3-C_4 e

o símbolo R_5 representa um átomo de hidrogénio ou um radical alquilo C_1-C_3 , alcenilo C_3-C_4 ou alcinilo C_3-C_4 ou

os símbolos R_4 e R_5 em conjunto representam um dos grupos com as fórmulas $-(CH_2)_4-$, $-(CH_2)_5-$ ou $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$;

o símbolo R_6 representa um átomo de hidrogénio ou um radical alquilo C_1-C_8 que é não substituído ou monos

substituído ou polissubstituído por substituintes escolhidos do grupo formado por átomos de halogéneo e grupos alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)-tio, alquil(C_1-C_4)-sulfinilo, alquil(C_1-C_4)-sulfonilo, alcoxi(C_1-C_4)-carbonilo e ciano, alcenilo C_3-C_6 que é não substituído ou monossubstituído ou polissubstituído por um ou mais átomos de halogéneo, alcinilo C_3-C_6 que é não substituído ou monossubstituído ou polissubstituído por um ou mais átomos de halogéneo, alquil(C_1-C_4)-sulfonilo que é não substituído ou monossubstituído ou polissubstituído por átomos de halogéneo, ou grupos fenil-sulfonilo em que o grupo fenilo é não substituído ou monossubstituído por um ou mais substituintes escolhidos do grupo formado por átomos de halogéneo e grupos alquilo C_1-C_4 e alcoxi C_1-C_4 , alcoxi(C_1-C_4) ou alquil(C_1-C_4)-carbonilo que é não substituído ou monossubstituído ou polissubstituído por um ou vários átomos de halogéneo;

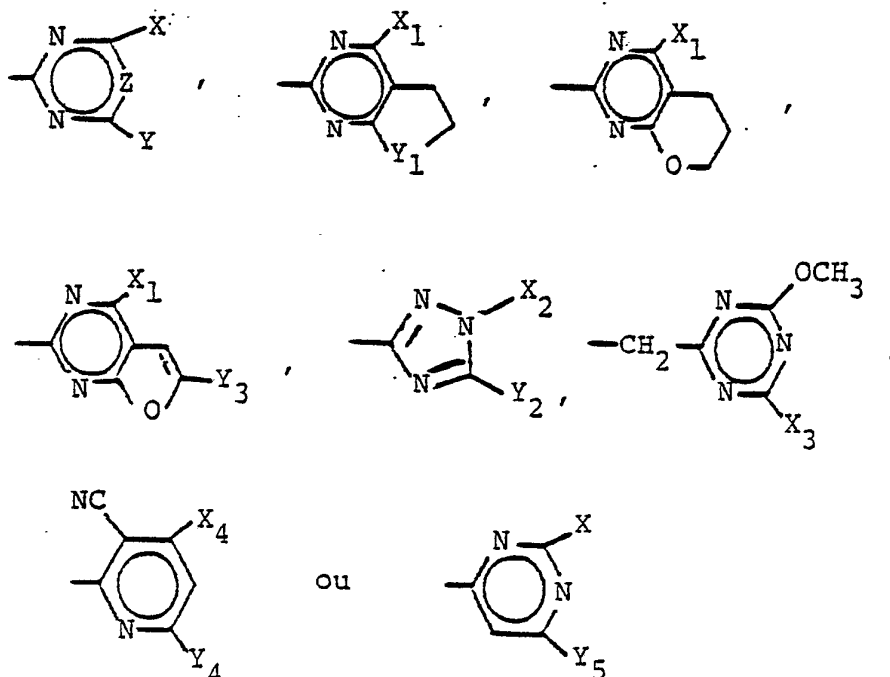
o símbolo R_7 representa um grupo alquil(C_1-C_4)-sulfonilo que é não substituído ou monossubstituído ou polissubstituído por um ou vários átomos de halogéneo, fenil-sulfonilo em que o grupo fenilo é não substituído ou monossubstituído ou polissubstituído por um ou mais substituintes escolhidos do grupo formado por átomos de halogéneo ou grupos alquilo(C_1-C_4) e

alcoxi(C₁-C₄), ou dialquil(C₁-C₄)-aminossulfonilo, ou os símbolos R₆ e R₇ em conjunto formam uma cadeia de fórmula geral -(CH₂)_m-SO₂- em que a cadeia pode ainda ser monossubstituída, dissubstituída, trissubstituída ou tetrassubstituída por 1 a 4 radicais alquilo C₁-C₃ e o símbolo m representa os números 2 ou 4;

o símbolo n representa zero ou 1;

o símbolo W representa um átomo de oxigénio ou de enxofre;

o símbolo A representa um radical de uma das fórmulas gerais



o símbolo X representa um átomo de hidrogénio ou de

halogéneo ou um radical alquilo C_1-C_3 ou alcoxi C_1-C_3 em que os dois radicais mencionados em último lugar podem ser não substituídos ou monossubstituídos ou polissubstituídos por um ou vários átomos de halogéneo ou monossubstituídos por um radical alcoxi C_1-C_3 ;

o símbolo Y representa um átomo de hidrogénio ou um radical alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 ou alquil(C_1-C_3)-tio, em que os radicais referidos antes que contêm grupos alquilo podem ser não substituídos ou monossubstituídos ou polissubstituídos por um ou vários átomos de halogéneo ou ser monossubstituídos ou dissubstituídos por um grupo ou grupos alcoxi C_1-C_3 ou alquil(C_1-C_3)-tio, e ainda um radical de fórmula geral NR_8R_9 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcenilo C_2-C_4 , alcinilo C_2-C_4 , alceniloxi C_3-C_4 ou alciniloxi C_3-C_4 ;

o símbolo Z representa um átomo de azoto ou um grupo de fórmula CH;

os símbolos R_8 e R_9 , independentemente um do outro, representam, cada um, um átomo de hidrogénio ou um radical alquilo C_1-C_3 ou alcenilo C_3-C_4 ;

o símbolo X_1 representa um grupo de fórmula CH_3 , OCH_3 , OC_2H_5 ou OCF_2H ;

o símbolo Y_1 representa um átomo de oxigénio ou um grupo da fórmula $-CH_2-$;

o símbolo X_2 representa um grupo de fórmula CH_3 , C_2H_5 ou CH_2CF_3 ;

o símbolo Y_2 representa um grupo de fórmula OCH_3 , OC_2H_5 , SCH_3 , SC_2H_5 , CH_3 ou C_2H_5 ;

o símbolo X_3 representa um grupo CH_3 ou OCH_3 ;

o símbolo Y_3 representa um átomo de hidrogénio ou um radical CH_3 ;

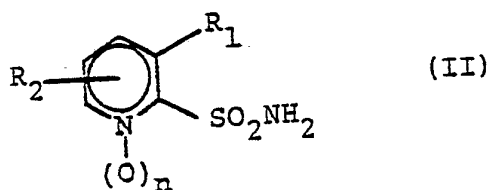
o símbolo X_4 representa um átomo de cloro ou um radical CH_3 , OCH_3 , OC_2H_5 ou CH_2OCH_3 ;

o símbolo Y_4 representa um átomo de cloro ou um radical CH_3 , OCH_3 ou OC_2H_5 ; e

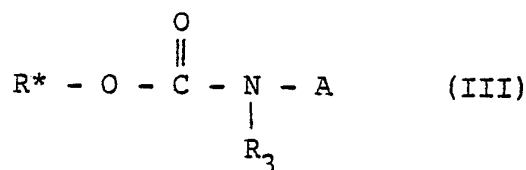
o símbolo Y_5 representa um átomo de cloro ou um radical CH_3 , C_2H_5 ou OCH_3 ;

e dos seus sais, caracterizado pelo facto

a) de se fazer reagir um composto de fórmula geral



com um carbamato heterocíclico de fórmula geral

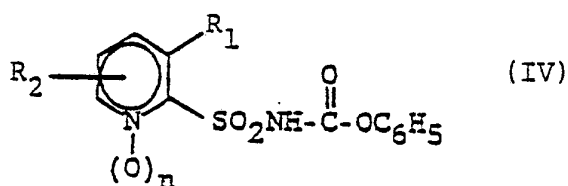


na qual

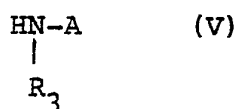
o símbolo R^* representa um radical fenilo ou alqui-

lo C_1-C_4 , ou

b) de se fazer reagir um carbamato de piridil-sulfonilo de fórmula geral

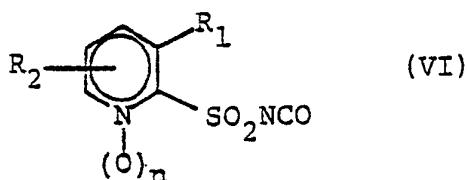


com um amino-heterociclo de fórmula geral



ou

c) de se fazer reagir um isocianato de sulfonilo de fórmula geral



com um amino-heterociclo de fórmula geral



ou

d) em uma reação de um vaso, em primeiro lugar, de se fazer reagir um amino-heterociclo de fórmula geral



com fosgênio, na presença de uma base, e de se fazer reagir o

produto intermediário assim formado com uma piridino-sulfonamida de fórmula geral (II).

2.- Processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo facto de

os símbolos R_4 e R_5 , independentemente um do outro, representarem grupos alquilo C_1-C_3 , alilo ou propargilo ou

os símbolos R_4 e R_5 , em conjunto, representarem um dos grupos de fórmulas $-(CH_2)_4-$, $-(CH_2)_5-$ ou $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$;

o símbolo R_6 representar um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C_1-C_4 que é não substituído ou monossubstituído ou polissubstituído por um ou vários átomos de halogénio ou um radical do grupo que consiste em alcoxi C_1-C_3 , alquil(C_1-C_3)-tio, alquil(C_1-C_3)-sulfonilo, alcoxi(C_1-C_4)-carbonilo e ciano, alcenilo C_3-C_4 , alcinilo C_3-C_4 , alquil(C_1-C_4)-sulfonilo, fenil-sulfonilo, fenil-sulfonilo que é monossubstituído, dissustituído ou trissubstituído por grupos escolhidos de entre átomos de halogénio, alquilo C_1-C_3 e alcoxi C_1-C_3 , alcoxi(C_1-C_3) ou alquil(C_1-C_4)-carbonilo;

o símbolo R_7 representar um radical alquil(C_1-C_4)-sulfonilo, fenil-sulfonilo ou fenil-sulfonilo que é monossubstituído, dissustituído ou trissubstituído por um ou três radicais do grupo formado por átomos de halogénio ou por grupos alquilo C_1-C_3 e alcoxi(C_1-C_3), ou dialquil(C_1-C_4)-amino-sulfonilo ou

os símbolos R_6 e R_7 em conjunto representam uma cadeia de fórmu-

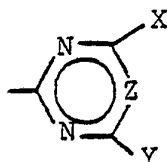
la geral $-(CH_2)_mSO_2-$ na qual o símbolo m representa o número 3 ou 4.

3.- Processo de acordo com as reivindicações 1 ou 2, caracterizado pelo facto de

o símbolo W representar um átomo de oxigénio;

o símbolo n representar o número zero e

o símbolo A representar um radical de fórmula geral



4.- Processo de acordo com uma qualquer ou várias das reivindicações 1 a 3, caracterizado pelo facto de

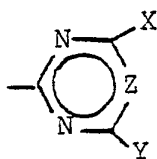
o símbolo R_2 representar um átomo de hidrogénio ou de halogéneo ou um grupo alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 ou alquil(C_1-C_3)-tio;

os símbolos R_4 e R_5 , independentemente um do outro, representam grupos alquilo C_1-C_3 ;

o símbolo R_6 representar um átomo de hidrogénio ou um grupo alquilo C_1-C_4 ou alquil(C_1-C_3)-sulfonilo;

o símbolo R_7 representa um grupo alquil(C_1-C_3)-sulfonilo; e

o símbolo A representa um radical de fórmula geral





na qual

o símbolo Z representa um átomo de azoto ou um grupo CH,

o símbolo X representa um átomo de halogéneo ou um grupo alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 ou um grupo OCF_2H , CF_3 ou OCH_2CF_3 e

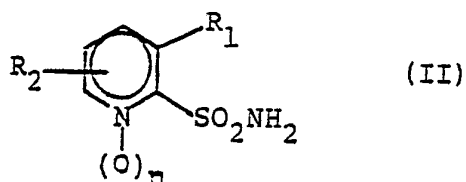
o símbolo Y representa alquilo C_1-C_2 ou alcoxi C_1-C_2 ou um grupo OCF_2H .

5.- Processo para a preparação de composições herbicidas ou reguladoras do crescimento de plantas, caracterizado pelo facto de se misturar, com agentes auxiliares de formulação, uma quantidade eficaz de pelo menos um composto de fórmula geral (I) ou dos seus sais quando preparados pelo processo de acordo com uma qualquer ou várias das reivindicações 1 a 4.

6.- Processo para controlar a presença de plantas indesejadas ou para regular crescimento de plantas, caracterizado pelo facto de se aplicar uma quantidade activa sob o ponto de vista herbicida ou uma quantidade que regula o crescimento de plantas de compostos de fórmula geral (I) preparados pelo processo de acordo com uma ou várias das reivindicações 1 a 4, ou dos seus sais, sobre as plantas, as sementes das plantas ou a superfície de cultivo, compreendida entre cerca de 0,001 e 10,0 Kg de substância activa por hectare de terreno tratado, ou preferivelmente en

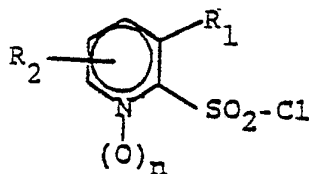
tre cerca de 0,005 e 5 Kg de substância activa por hectare de terreno tratado.

8.- Processo para a preparação de compostos de fórmula geral



na qual

os símbolos R_1 , R_2 e n têm os significados mencionados em uma ou mais das reivindicações 1 a 4, caracterizado pelo facto de se transformar um cloreto de sulfonilo de fórmula geral

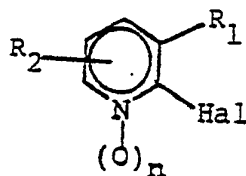


na qual

os símbolos R_1 , R_2 e n têm os significados definidos antes, em uma sulfonamida de fórmula geral (II), mediante reacção com butil terc.-amina e eliminação do grupo butilo terc. sob as

condições habituais ou com amoníaco.

9.- Processo de acordo com a reivindicação 8, caracterizado pelo facto de se preparar o cloreto de sulfonilo mediante reacção de um composto de fórmula geral



na qual

o símbolo Hal representa um átomo de flúor, cloro, bromo ou iodo e

os símbolos R_1 , R_2 e n têm os significados definidos antes,

com um reagente S-nucleofílico e reacção subsequente do produto intermediário assim obtido, com hipoclorito de sódio ou cloro.

Lisboa, 9 de Janeiro de 1991

O Agente Oficial da Propriedade Industrial