



República Federativa do Brasil
Ministério da Economia
Instituto Nacional da Propriedade Industrial

(21) BR 112019026257-1 A2



(22) Data do Depósito: 11/06/2018

(43) Data da Publicação Nacional: 30/06/2020

(54) Título: 3-FENILISOXAZOLINA-5-CARBOXAMIDAS HERBICIDAMENTE ATIVAS DE TETRA-HIDRO- E DI-HIDROFURANCARBOXAMIDAS

(51) Int. Cl.: C07D 413/12; A01N 43/80.

(30) Prioridade Unionista: 13/06/2017 EP 17175780.0.

(71) Depositante(es): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT.

(72) Inventor(es): OLAF PETERS; KLAUS BERNHARD HAAF; GUIDO BOJACK; KATHERINE ROSE LAW; ANU BHEEMAIHA MACHETTIRA; HANSJÖRG DIETRICH; ELMAR GATZWEILER; CHRISTOPHER HUGH ROSINGER; ELISABETH ASMUS.

(86) Pedido PCT: PCT EP2018065334 de 11/06/2018

(87) Publicação PCT: WO 2018/228986 de 20/12/2018

(85) Data da Fase Nacional: 11/12/2019

(57) Resumo: A invenção se refere a 3-fenilisoaxazolina-4-carboxamidas de tetra-hidro e di-hidrofuran carboxamidas da fórmula geral (I) e a seus sais agroquimicamente compatíveis (I) assim como ao uso das mesmas no campo de proteção de planta.

**“3-FENILISOXAZOLINA-5-CARBOXAMIDAS HERBICIDAMENTE ATIVAS
DE TETRA-HIDRO- E DI-HIDROFURANCARBOXAMIDAS”**

[0001] A invenção se refere ao campo técnico dos herbicidas, especificamente aquele dos herbicidas para controle seletivo de ervas daninhas e gramíneas daninhas em culturas de plantas úteis.

[0002] Especificamente, se refere a 3-fenilisoxazolina-5-carboxamidas e -5-tioamidas de tetra-hidro- e di-hidrofurancarboxamidas substituídas, a processos para sua preparação e a seu uso como herbicidas.

[0003] Os documentos W01995/014681 A1, W01995/014680 A1, W0 2008/035315 A1, W02005/051931 A1 e W02005/021515 A1 descrevem, cada um, entre outros, 3-fenilisoxazolina-5-carboxamidas que são substituídas no anel de fenila nas posições 3 e 4 por radicais alcóxi. O documento W01998/057937 A1 descreve, entre outros, compostos que são substituídos no anel fenila na posição 4 por um radical alcóxi. O documento W02006/016237 A1 descreve, entre outros, compostos que são substituídos no anel de fenila por um radical amido. Os compostos descritos nos documentos mencionados acima são descritos nesses documentos como farmacologicamente ativos.

[0004] O documento W02005/021516 A1 revela ácido 3-([3-(3-*terc*-butilfenil)-5-etil-4,5-di-hidro-1,2-oxazol-5-il]carbonil)amino)-5-fluoro-4-oxopentanoico e ácido 3-([3-(3-*terc*-butilfenil)-5-isopropil-4,5-di-hidro-1,2-oxazol-5-il]carbonil)amino)-5-fluoro-4-oxopentanoico como compostos farmacologicamente ativos.

[0005] Os documentos DE 4026018 A1, EP 0 520 371 A2 e DE

4017665 revelam 3-fenilisoxazolina-5-carboxamidas que portam um átomo de hidrogênio na posição 5 do anel isoxazolina. Esses compostos são descritos no presente documento como fitoprotetores agroquimicamente ativos, isto é, como compostos que eliminam a ação herbicida indesejada de herbicidas em plantas de cultura. Nenhuma ação herbicida desses compostos é revelada. O pedido de patente europeu nº 10170238, que tem uma data de prioridade anterior, mas ainda será publicado na data de prioridade do presente pedido, revela 3-fenilisoxazolina-5-carboxamidas e 3-fenilisoxazolina-5-tioamidas herbicida e fungicamente ativas que portam um átomo de hidrogênio na posição 5 do anel de isoxazolina. Monatshefte Chemie (2010) 141, 461 e Letters in Organic Chemistry (2010), 7, 502 também revelam 3-fenilisoxazolina-5-carboxamidas que portam um átomo de hidrogênio na posição 5 do anel isoxazolina. A ação fungicida, mas não a ação herbicida, é revelada para alguns dos compostos mencionados.

[0006] O documento WO 2014/048827 descreve a ação herbicida de ácidos 3-fenilisoxazolina-5-carboxílicos, ésteres -5-carboxílicos, -5-carbaldeídos e -5-nitrilas.

[0007] O documento WO 2014/048853 revela isoxazolina-5-carboxamidas e -5-tioamidas que têm heterociclos na posição 3 (herbicida e fungicida),

[0008] O documento WO 2014/048940 que tem quinolina como heterociclo específico na posição 3 (fungicida), documento WO 2014/048882 que tem alcóxi como radical específico na posição 5.

[0009] O documento WO 2014/048882 revela isoxazolinocarboxamidas que têm alcóxi como radical

específico na posição 5.

[0010] O documento WO 2012/130798 descreve 3-fenilisoaxazolina-5-carboxamidas e -5-tioamidas herbicida e fungicamente ativas de heterociclos substituídos.

[0011] A atividade herbicida desses compostos conhecidos, em particular, em taxas de aplicação baixas, e/ou suas compatibilidades com plantas de cultura permanecem necessitando de aprimoramento.

[0012] Pelos motivos declarados, ainda há necessidade de herbicidas potentes e/ou reguladores de crescimento vegetal para o uso seletivo em plantas de cultura ou no uso de terra de não cultura, em que esses ingredientes ativos devem, preferencialmente, ter propriedades vantajosas adicionais, por exemplo, uma compatibilidade aprimorada com plantas de cultura.

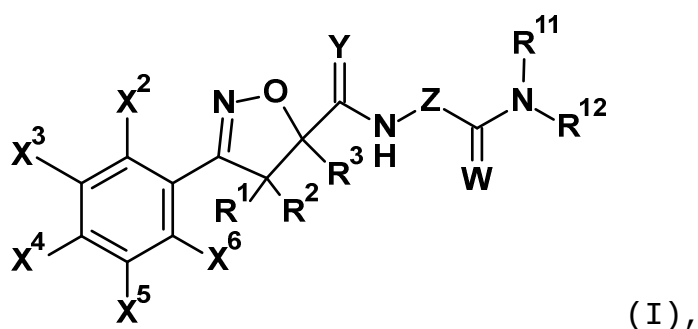
[0013] Consequentemente, é um objetivo da presente invenção fornecer compostos que têm atividade herbicida (herbicidas) que são altamente eficazes contra plantas prejudiciais economicamente importantes mesmo em taxas de aplicação relativamente baixas e podem ser usadas seletivamente em plantas de cultura, preferencialmente com boa atividade contra plantas prejudiciais, e ao mesmo tempo preferencialmente têm boa compatibilidade com plantas de cultura. Preferencialmente, esses compostos herbicidas devem ser particularmente eficazes e eficientes contra um amplo espectro de ervas daninhas e, preferencialmente, também devem ter boa atividade contra um amplo número de ervas.

[0014] Além de uma ação herbicida, diversos compostos da fórmula (I) também têm ação fúngica que, no entanto, não é

muito evidente.

[0015] Surpreendentemente, constatou-se que as 3-fenilisoxazolina-5-carboxamidas de tetra-hidro- e di-hidrofurancarboxamidas da fórmula (I) definidas abaixo e seus sais têm excelente atividade herbicida contra um amplo espectro de plantas prejudiciais anuais mono e dicotiledôneas economicamente importantes.

[0016] A presente invenção fornece, portanto, os compostos da fórmula geral (I)



e os sais agroquimicamente aceitáveis dos mesmos em que R^1 e R^2 independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio ou ciano,

ou

representam (C_1-C_4) -alquila ou (C_1-C_4) -alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em halogênio e ciano;

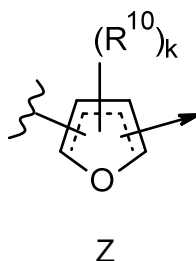
R^3 representa (C_1-C_5) -alquila, (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_2-C_5) -alquenila, (C_2-C_5) -alquinila ou (C_1-C_5) -alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano, (C_1-C_5) -alcóxi e hidróxi;

Y representa oxigênio ou enxofre;

W representa oxigênio ou enxofre;

Z representa um anel de furano totalmente saturado ou

parcialmente saturado que é substituído por k radicais do grupo R^{10} ,



em que a seta em cada caso denota uma ligação ao grupo $C=W$ da fórmula (I);

R^{10} representa halogênio, ciano ou CO_2R^7 ,

ou

representa (C_1-C_2) -alquila ou (C_1-C_2) -alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro;

R^{11} , R^{12} independentemente um do outro representam hidrogênio, ciano, OR^7 , $S(O)_n R^5$, $SO_2NR^6R^7$, CO_2R^8 , $CONR^6R^8$, COR^6 , NR^6R^8 , NR^6COR^8 , $NR^6CONR^8R^8$, $NR^6CO_2R^8$, $NR^6SO_2R^8$, $NR^6SO_2NR^6R^8$, $C(R^6)=NOR^8$, arila opcionalmente substituída, heteroarila opcionalmente substituída ou heterociclila opcionalmente substituída,

ou

representam (C_1-C_{12}) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_7) -cicloalquil- (C_1-C_7) -alquila, (C_2-C_{12}) -alquenila, (C_5-C_7) -cicloalquenila ou (C_2-C_{12}) -alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano, nitro, OR^7 , $S(O)_n R^5$, $SO_2NR^6R^7$, CO_2R^8 , $CONR^6R^8$, COR^6 , NR^6R^8 , NR^6COR^8 , $NR^6CONR^8R^8$,

$\text{NR}^6\text{CO}_2\text{R}^8$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^8$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{NR}^6\text{R}^8$, $\text{C}(\text{R}^6)=\text{NOR}^8$, arila
opcionalmente substituída, heteroarila
opcionalmente substituída ou heterociclila
opcionalmente substituída,
ou

R^{11} e R^{12} juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual os
mesmos são fixados formam um anel de cinco, seis
ou sete membros saturado, parcial ou totalmente
insaturado que é opcionalmente mono- a
hexassubstituído por radicais do grupo que
consiste em halogênio, ciano, nitro, $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -
alquila, halo- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -alquila, oxo, OR^7 , $\text{S}(\text{O})_n \text{R}^5$,
 $\text{SO}_2\text{NR}^6\text{R}^7$, CO_2R^8 , CONR^6R^8 , COR^6 , NR^6R^8 , NR^6COR^8 ,
 $\text{NR}^6\text{CONR}^8\text{R}^8$, $\text{NR}^6\text{CO}_2\text{R}^8$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^8$, $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{NR}^6\text{R}^8$,
 $\text{C}(\text{R}^6)=\text{NOR}^8$ e que, além desse átomo de nitrogênio,
contém r átomos de carbono, n átomos de oxigênio,
p átomos de enxofre e p elementos do grupo que
consiste em NR^7 e NCOR^7 como átomos de anel;

X^2 , X^4 e X^6 independentemente um do outro representam, cada
um, hidrogênio, halogênio ou ciano,

ou

representam $(\text{C}_1\text{-C}_2)$ -alquila, em cada caso,
substituída por m radicais do grupo que consiste
em flúor, cloro, bromo e $(\text{C}_1\text{-C}_2)$ -alcóxi;

X^3 e X^5 independentemente um do outro representam
hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, hidróxi,
ciano, nitro, $\text{S}(\text{O})_n \text{R}^6$ ou CO_2R^7 ,

ou

representam $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ -alquila, $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ -alcóxi, $(\text{C}_3\text{-C}_4)$ -
cicloalquila, $(\text{C}_2\text{-C}_3)$ -alquenila ou $(\text{C}_2\text{-C}_3)$ -

alquinila, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e bromo;

R⁵ representa (C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila ou arila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano e hidróxi;

R⁶ representa hidrogênio ou R⁵;

R⁷ representa hidrogênio,

ou

representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₃-C₄)-alquenila ou (C₃-C₄)-alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano e (C₁-C₂)-alcóxi;

R⁸ representa hidrogênio,

ou

representa (C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₃-C₈)-alquenila ou (C₃-C₈)-alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano e (C₁-C₂)-alcóxi;

k representa o número sequencial 0, 1 ou 2;

m representa o número sequencial 0, 1, 2, 3, 4 ou 5;

n representa o número sequencial 0, 1 ou 2;

p representa o número sequencial 0 ou 1; e

r representa o número sequencial 3, 4, 5 ou 6.

[0017] Alquila significa radicais hidrocarbila de cadeia linear ou ramificada saturada que têm o número de átomos de carbono especificado em cada caso, por exemplo, C₁-C₆-alquila como metila, etila, propila, 1-metiletila, butila, 1-metilpropila, 2-metilpropila, 1,1-dimetiletila, pentila,

1-metilbutila, 2-metilbutila, 3-metilbutila, 2,2-dimetilpropila, 1-etilpropila, hexila, 1,1-dimetilpropila, 1,2-dimetilpropila, 1-metilpentila, 2-metilpentila, 3-metilpentila, 4-metilpentila, 1,1-dimetilbutila, 1,2-dimetilbutila, 1,3-dimetilbutila, 2,2-dimetilbutila, 2,3-dimetilbutila, 3,3-dimetilbutila, 1-etilbutila, 2-etilbutila, 1,1,2-trimetilpropila, 1,2,2-trimetilpropila, 1-etil-1-metilpropila e 1-etil-2-metilpropila.

[0018] Alquila substituída por halogênio significa grupos alquila de cadeia linear ou ramificada em que alguns ou todos os átomos de hidrogênio nesses grupos podem ser substituídos por átomos de halogênio, por exemplo, C₁-C₂-haloalquila como clorometila, bromometila, diclorometila, triclorometila, fluorometila, difluorometila, trifluorometila, clorofluorometila, diclorofluorometila, clorodifluorometila, 1-cloroetila, 1-bromoetila, 1-fluoroetila, 2-fluoroetila, 2,2-difluoroetila, 2,2,2-trifluoroetila, 2-cloro-2-fluoroetila, 2-cloro,2-difluoroetila, 2,2-dicloro-2-fluoroetila, 2,2,2-tricloroetila, pentafluoroetila e 1,1,1-trifluoroprop-2-ila.

[0019] Alquenila significa radicais hidrocarbila de cadeia linear ou ramificada insaturada que têm o número de átomos de carbono especificado em cada caso e uma ligação dupla em qualquer posição, por exemplo, C₂-C₆-alquenila como etenila, 1-propenila, 2-propenila, 1-metiletenila, 1-butenila, 2-butenila, 3-butenila, 1-metil-1-propenila, 2-metil-1-propenila, 1-metil-2-propenila, 2-metil-2-propenila, 1-pentenila, 2-pentenila, 3-pentenila, 4-pentenila, 1-metil-1-butenila, 2-metil-1-butenila, 3-

metil-1-butenila, 1-metil-2-butenila, 2-metil-2-butenila, 3-metil-2-butenila, 1-metil-3-butenila, 2-metil-3-butenila, 3-metil-3-butenila, 1,1-dimetil-2-propenila, 1,2-dimetil-1-propenila, 1,2-dimetil-2-propenila, 1-etil-1-propenila, 1-etil-2-propenila, 1-hexenila, 2-hexenila, 3-hexenila, 4-hexenila, 5-hexenila, 1-metil-1-pentenila, 2-metil-1-pentenila, 3-metil-1-pentenila, 4-metil-1-pentenila, 1-metil-2-pentenila, 2-metil-2-pentenila, 3-metil-2-pentenila, 4-metil-2-pentenila, 1-metil-3-pentenila, 2-metil-3-pentenila, 3-metil-3-pentenila, 4-metil-3-pentenila, 1-metil-4-pentenila, 2-metil-4-pentenila, 3-metil-4-pentenila, 4-metil-4-pentenila, 1,1-dimetil-2-butenila, 1,1-dimetil-3-butenila, 1,2-dimetil-1-butenila, 1,2-dimetil-2-butenila, 1,2-dimetil-3-butenila, 1,3-dimetil-1-butenila, 1,3-dimetil-2-butenila, 1,3-dimetil-3-butenila, 2,2-dimetil-3-butenila, 2,3-dimetil-1-butenila, 2,3-dimetil-2-butenila, 2,3-dimetil-3-butenila, 3,3-dimetil-1-butenila, 3,3-dimetil-2-butenila, 1-etil-1-butenila, 1-etil-2-butenila, 1-etil-3-butenila, 2-etil-1-butenila, 2-etil-2-butenila, 2-etil-3-butenila, 1,1,2-trimetil-2-propenila, 1-etil-1-metil-2-propenila, 1-etil-2-metil-1-propenila e 1-etil-2-metil-2-propenila.

[0020] Alquinila significa radicais hidrocarbila de cadeia linear ou ramificada que têm o número de átomos de carbono especificado em cada caso e uma ligação tripla em qualquer posição, por exemplo, C₂-C₆-alquinila como etinila, 1-propinila, 2-propinila (ou propargila), 1-butinila, 2-butinila, 3-butinila, 1-metil-2-propinila, 1-pentinila, 2-pentinila, 3-pentinila, 4-pentinila, 3-metil-1-butinila, 1-metil-2-butinila, 1-metil-3-butinila, 2-

metil-3-butinila, 1,1-dimetil-2-propinila, 1-etil-2-propinila, 1-hexinila, 2-hexinila, 3-hexinila, 4-hexinila, 5-hexinila, 3-metil-1-pentinila, 4-metil-1-pentinila, 1-metil-2-pentinila, 4-metil-2-pentinila, 1-metil-3-pentinila, 2-metil-3-pentinila, 1-metil-4-pentinila, 2-metil-4-pentinila, 3-metil-4-pentinila, 1,1-dimetil-2-butinila, 1,1-dimetil-3-butinila, 1,2-dimetil-3-butinila, 2,2-dimetil-3-butinila, 3,3-dimetil-1-butinila, 1-etil-2-butinila, 1-etil-3-butinila, 2-etil-3-butinila e 1-etil-1-metil-2-propinila.

[0021] Cicloalquila significa um sistema de anel saturado carbocíclico que tem, de preferência, 3-8 átomos de carbono de anel, por exemplo, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila ou ciclo-hexila. No caso de cicloalquila opcionalmente substituída, sistemas cíclicos com substituintes são incluídos, incluindo também substituintes com uma ligação dupla no radical cicloalquila, por exemplo, um grupo alquilideno como metilideno.

[0022] No caso de cicloalquila opcionalmente substituída, sistemas alifáticos policíclicos também estão incluídos, por exemplo, biciclo[1.1.0]butan-1-ila, biciclo[1.1.0]butan-2-ila, biciclo[2.1.0]pentan-1-ila, biciclo[2.1.0]pentan-2-ila, biciclo[2.1.0]pentan-5-ila, biciclo[2.2.1]hept-2-ila (norbornila), adamantan-1-ila e adamantan-2-ila.

[0023] No caso de cicloalquila substituída, sistemas alifáticos espirocíclicos também são incluídos, por exemplo, espiro[2.2]pent-1-ila, espiro[2.3]hex-1-ila, espiro[2.3]hex-4-ila, 3-espiro[2.3]hex-5-ila.

[0024] "Cicloalquenila" sum sistema de anel parcialmente

insaturado não aromático carbocíclico que tem preferencialmente 4-8 átomos de carbono, por exemplo, 1-ciclobutenila, 2-ciclobutenila, 1-ciclopentenila, 2-ciclopentenila, 3-ciclopentenila, ou 1-ciclo-hexenila, 2-ciclo-hexenila, 3-ciclo-hexenila, 1,3-ciclo-hexadienila ou 1,4-ciclo-hexadienila, incluindo também substituintes com uma ligação dupla no radical cicloalquenila, por exemplo, um grupo alquilideno, como metilideno. No caso de cicloalquenila opcionalmente substituída, as elucidações para cicloalquila substituída se aplicam de modo correspondente.

[0025] Alcóxi significa radicais alcóxi de cadeia linear ou ramificada saturado que tem o número de átomos de carbono especificado em cada caso, por exemplo, C₁-C₆-alcóxi como metóxi, etóxi, propóxi, 1-metiletóxi, butóxi, 1-metilpropóxi, 2-metilpropóxi, 1,1-dimetiletóxi, pentóxi, 1-metilbutóxi, 2-metilbutóxi, 3-metilbutóxi, 2,2-dimetilpropóxi, 1-etilpropóxi, hexóxi, 1,1-dimetilpropóxi, 1,2-dimetilpropóxi, 1-metilpentóxi, 2-metilpentóxi, 3-metilpentóxi, 4-metilpentóxi, 1,1-dimetilbutóxi, 1,2-dimetilbutóxi, 1,3-dimetilbutóxi, 2,2-dimetilbutóxi, 2,3-dimetilbutóxi, 3,3-dimetilbutóxi, 1-etilbutóxi, 2-etilbutóxi, 1,1,2-trimetilpropóxi, 1,2,2-trimetilpropóxi, 1-etil-1-metilpropóxi e 1-etil-2-metilpropóxi. Alcóxi substituído por halogênio significa radicais alcóxi de cadeia linear ou ramificada que têm o número de átomos de carbono especificado em cada caso, em que alguns ou todos os átomos de hidrogênio nesses grupos podem ser substituídos por átomos de halogênio conforme especificado acima, por exemplo, C₁-C₂-haloalcóxi como clorometóxi,

bromometóxi, diclorometóxi, triclorometóxi, fluorometóxi, difluorometóxi, trifluorometóxi, clorofluorometóxi, diclorofluorometóxi, clorodifluorometóxi, 1-cloroetóxi, 1-bromoetóxi, 1-fluoroetóxi, 2-fluoroetóxi, 2,2-difluoroetóxi, 2,2,2-trifluoroetóxi, 2-cloro-2-fluoroetóxi, 2-cloro-1,2-difluoroetóxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetóxi, 2,2,2-tricloroetóxi, pentafluoroetóxi e 1,1,1-trifluoroprop-2-oxi.

[0026] O termo "arila" denota um sistema aromático mono, bi ou policíclico opcionalmente substituído que tem de preferência, 6 a 14, especialmente 6 a 10, átomos de carbono de anel, por exemplo, fenila, naftila, antrila, fenantrenila e similares, de preferência, fenila.

[0027] O termo "arila opcionalmente substituída" também abrange sistemas policíclicos, como tetra-hidronaftila, indenila, indanila, fluorenila, bifenilila, em que o sítio de ligação está no sistema aromático. Em termos sistemáticos, "arila" é geralmente também abrangido pelo termo "fenila opcionalmente substituída".

[0028] As arilas listadas acima são, de preferência, substituídas, por exemplo, por hidrogênio, halogênio, alquila, haloalquila, hidroxila, alcóxi, cicloalcóxi, arilóxi, alcoxialquila, alcoxialcóxi, cicloalquila, halocicloalquila, arila, arilalquila, heteroarila, heterociclila, alquenila, alquilcarbonila, cicloalquilcarbonila, arilcarbonila, heteroarilcarbonila, alcoxicarbonila, hidroxicarbonila, cicloalcoxicarbonila, cicloalquilalcoxicarbonila, alcoxicarbonilalquila, arilalcoxicarbonila, arilalcoxicarbonilalquila, alquinila, alquinilalquila, alquilalquinila, trisalquilsililalquinila,

nitro, amino, ciano, haloalcóxi, haloalquiltio, alquiltio, hidrotio, hidroxialquila, oxo, heteroarilalcóxi, arilalcóxi, heterociclilalcóxi, heterociclilalquiltio, heterociclilóxi, heterocicliltio, heteroarilóxi, bisalquilamino, alquilamino, cicloalquilamino, hidroxicarbonilalquilamino, alcoxicarbonilalquilamino, arilalcoxicarbonilalquilamino, alcoxicarbonilalquil(alquil)amino, aminocarbonila, alquilaminocarbonila, bisalquilaminocarbonila, cicloalquilaminocarbonila, hidroxicarbonilalquilaminocarbonila, alcoxicarbonilalquilaminocarbonila, arilalcoxicarbonilalquilaminocarbonila.

[0029] Um radical heterocíclico (heterociclila) contém pelo menos um anel heterocíclico (=anel carbocíclico em que pelo menos um átomo de carbono foi substituído por um heteroátomo, preferencialmente por um heteroátomo do grupo de N, O, S, P) que é saturado, insaturado, parcialmente saturado ou heteroaromático e pode ser não substituído ou substituído, sendo que, em cada caso, o sítio de ligação está localizado em um átomo de anel. Se o radical heterociclila ou o anel heterocíclico for opcionalmente substituído, o mesmo pode ser fusionado a outros anéis carbocíclicos ou heterocíclicos. No caso de heterociclila opcionalmente substituída, sistemas policíclicos são também incluídos, por exemplo, 8-azabíciclo[3.2.1]octanila, 8-azabíciclo[2.2.2]octanila ou 1-azabíciclo[2.2.1]heptila. No caso de heterociclila opcionalmente substituída, sistemas espirocíclicos são também incluídos, por exemplo, 1-oxa-5-azaspiro[2.3]hexila. A menos que seja definido o

contrário, o anel heterocíclico, de preferência, contém de 3 a 9 átomos de anel, em particular, de 3 a 6 átomos de anel, e um ou mais, de preferência, 1 a 4, em particular, 1, 2 ou 3 heteroátomos no anel heterocíclico, de preferência, do grupo N, O e S, em que, no entanto, dois átomos de oxigênio não devem estar diretamente adjacentes entre si, por exemplo, tendo um heteroátomo do grupo que consiste em N, O e S 1- ou 2- ou 3-pirrolidinila, 3,4-di-hidro-2H-pirrol-2- ou -3-ila, 2,3-di-hidro-1H-pirrol-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,5-di-hidro-1H-pirrol-1- ou -2- ou -3-ila, 1- ou 2- ou 3- ou 4-piperidinila; 2,3,4,5-tetra-hidropiridin-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila ou -6-ila; 1,2,3,6-tetra-hidropiridin-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1,2,3,4-tetra-hidropiridin-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1,4-di-hidropiridin-1- ou -2- ou -3- ou -4-ila; 2,3-di-hidropiridin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 2,5-di-hidropiridin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila, 1- ou 2- ou 3- ou 4-azepanila; 2,3,4,5-tetra-hidro-1H-azepin-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,4,7-tetra-hidro-1H-azepin-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,6,7-tetra-hidro-1H-azepin-1- ou -2- ou -3- ou -4-ila; 3,4,5,6-tetra-hidro-2H-azepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4,5-di-hidro-1H-azepin-1- ou -2- ou -3- ou -4-ila; 2,5-di-hidro-1H-azepin-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,7-di-hidro-1H-azepin-1- ou -2- ou -3- ou -4-ila; 2,3-di-hidro-1H-azepin-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 3,4-di-hidro-2H-azepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 3,6-di-hidro-2H-azepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 5,6-di-hidro-2H-azepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -

6- ou -7-ila; 4,5-di-hidro-3H-azepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 1H-azepin-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2H-azepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 3H-azepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4H-azepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila, 2- ou 3-oxolanila (= 2- ou 3-tetra-hidrofuranila); 2,3-di-hidrofuran-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,5-di-hidrofuran-2- ou -3-ila, 2- ou 3- ou 4-oxanila (= 2- ou 3- ou 4-tetra-hidropiranila); 3,4-di-hidro-2H-piran-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,6-di-hidro-2H-piran-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 2H-piran-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 4H-piran-2- ou -3- ou -4-ila, 2- ou 3- ou 4-oxepanila; 2,3,4,5-tetra-hidro-oxepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,4,7-tetra-hidro-oxepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,6,7-tetra-hidro-oxepin-2- ou -3- ou -4-ila; 2,3-di-hidro-oxepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4,5-di-hidro-oxepin-2- ou -3- ou -4-ila; 2,5-di-hidro-oxepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; oxepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2- ou 3-tetra-hidrotiofenila; 2,3-di-hidrotiofen-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,5-di-hidrotiofen-2- ou -3-ila; tetra-hidro-2H-tiopiran-2- ou -3- ou -4-ila; 3,4-di-hidro-2H-tiopiran-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,6-di-hidro-2H-tiopiran-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 2H-tiopiran-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 4H-tiopiran-2- ou -3- ou -4-ila. Os heterociclos de 3 membros e 4 membros preferenciais são, por exemplo, 1- ou 2-aziridinila, oxiranila, tiiranila, 1- ou 2- ou 3-azetidínila, 2- ou 3-oxetanila, 2- ou 3-tietanila, 1,3-dioxetan-2-ila. Exemplos adicionais de "heterociclila" são um radical heterocíclico parcial ou

totalmente hidrogenado que tem dois heteroátomos do grupo que consiste em N, O e S, por exemplo, 1- ou 2- ou 3- ou 4-pirazolidinila; 4,5-di-hidro-3H-pirazol-3- ou -4- ou -5-ila; 4,5-di-hidro-1H-pirazol-1- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,3-di-hidro-1H-pirazol-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 1- ou -2- ou -3- ou -4-imidazolidinila; 2,3-di-hidro-1H-imidazol-1- ou -2- ou -3- ou -4-ila; 2,5-di-hidro-1H-imidazol-1- ou -2- ou -4- ou -5-ila; 4,5-di-hidro-1H-imidazol-1- ou -2- ou -4- ou -5-ila; hexa-hidropiridazin-1- ou -2- ou -3- ou -4-ila; 1,2,3,4-tetra-hidropiridazin-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1,2,3,6-tetra-hidropiridazin-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1,4,5,6-tetra-hidropiridazin-1- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,4,5,6-tetra-hidropiridazin-3- ou -4- ou -5-ila; 4,5-di-hidropiridazin-3- ou -4-ila; 3,4-di-hidropiridazin-3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,6-di-hidropiridazin-3- ou -4-ila; 1,6-di-hidropiridazin-1- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; hexa-hidropirimidin-1- ou -2- ou -3- ou -4-ila; 1,4,5,6-tetra-hidropirimidin-1- ou -2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1,2,5,6-tetra-hidropirimidin-1- ou -2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1,2,3,4-tetra-hidropirimidin-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1,6-di-hidropirimidin-1- ou -2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1,2-di-hidropirimidin-1- ou -2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 2,5-di-hidropirimidin-2- ou -4- ou -5-ila; 4,5-di-hidropirimidin- 4- ou -5- ou -6-ila; 1,4-di-hidropirimidin-1- ou -2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1- ou -2- ou -3-piperazinila; 1,2,3,6-tetra-hidropirazin-1- ou -2- ou -3- ou -5- ou -6-ila; 1,2,3,4-tetra-hidropirazin-1- ou -2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1,2-di-hidropirazin-1- ou -2- ou -3- ou -5- ou -6-ila; 1,4-di-hidropirazin-1- ou -2-

ou -3-ila; 2,3-di-hidropirazin-2- ou -3- ou -5- ou -6-ila; 2,5-di-hidropirazin-2- ou -3-ila; 1,3-dioxolan-2- ou -4- ou -5-ila; 1,3-dioxol-2- ou -4-ila; 1,3-dioxan-2- ou -4- ou -5-ila; 4H-1,3-dioxin-2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1,4-dioxan-2- ou -3- ou -5- ou -6-ila; 2,3-di-hidro-1,4-dioxin-2- ou -3- ou -5- ou -6-ila; 1,4-dioxin-2- ou -3-ila; 1,2-ditiolan-3- ou -4-ila; 3H-1,2-ditiol-3- ou -4- ou -5-ila; 1,3-ditiolan-2- ou -4-ila; 1,3-ditiol-2- ou -4-ila; 1,2-ditian-3- ou -4-ila; 3,4-di-hidro-1,2-diti-in-3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,6-di-hidro-1,2-diti-in-3- ou -4-ila; 1,2-diti-in-3- ou -4-ila; 1,3-ditian-2- ou -4- ou -5-ila; 4H-1,3-diti-in-2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; isoxazolidin-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,3-di-hidroisoxazol-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,5-di-hidroisoxazol-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 4,5-di-hidroisoxazol-3- ou -4- ou -5-ila; 1,3-oxazolidin-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,3-di-hidro-1,3-oxazol-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,5-di-hidro-1,3-oxazol-2- ou -4- ou -5-ila; 4,5-di-hidro-1,3-oxazol-2- ou -4- ou -5-ila; 1,2-oxazinan-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,4-di-hidro-2H-1,2-oxazin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,6-di-hidro-2H-1,2-oxazin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 5,6-di-hidro-2H-1,2-oxazin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 5,6-di-hidro-4H-1,2-oxazin-3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 2H-1,2-oxazin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 6H-1,2-oxazin-3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 4H-1,2-oxazin-3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 1,3-oxazinan-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,4-di-hidro-2H-1,3-oxazin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,6-di-hidro-2H-1,3-oxazin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 5,6-di-hidro-2H-1,3-oxazin-2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 5,6-di-hidro-4H-1,3-oxazin-2- ou -4- ou -5- ou -

6-ila; 2H-1,3-oxazin-2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 6H-1,3-oxazin-2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 4H-1,3-oxazin-2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; morfolin-2- ou -3- ou -4-ila; 3,4-di-hidro-2H-1,4-oxazin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,6-di-hidro-2H-1,4-oxazin-2- ou -3- ou -5- ou -6-ila; 2H-1,4-oxazin-2- ou -3- ou -5- ou -6-ila; 4H-1,4-oxazin-2- ou -3-ila; 1,2-oxazepan-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,4,5-tetra-hidro-1,2-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,4,7-tetra-hidro-1,2-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,6,7-tetra-hidro-1,2-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,5,6,7-tetra-hidro-1,2-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4,5,6,7-tetra-hidro-1,2-oxazepin-3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3-di-hidro-1,2-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,5-di-hidro-1,2-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,7-di-hidro-1,2-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4,5-di-hidro-1,2-oxazepin-3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4,7-di-hidro-1,2-oxazepin-3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 6,7-di-hidro-1,2-oxazepin-3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 1,2-oxazepin-3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 1,3-oxazepan-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,4,5-tetra-hidro-1,3-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,4,7-tetra-hidro-1,3-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,6,7-tetra-hidro-1,3-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,5,6,7-tetra-hidro-1,3-oxazepin-2- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4,5,6,7-tetra-hidro-1,3-oxazepin-2- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3-di-hidro-1,3-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,5-di-hidro-1,3-oxazepin-2- ou -4- ou -

5- ou -6- ou -7-ila; 2,7-di-hidro-1,3-oxazepin-2- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4,5-di-hidro-1,3-oxazepin-2- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4,7-di-hidro-1,3-oxazepin-2- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 6,7-di-hidro-1,3-oxazepin-2- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 1,3-oxazepin-2- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 1,4-oxazepan-2- ou -3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,4,5-tetra-hidro-1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,4,7-tetra-hidro-1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3,6,7-tetra-hidro-1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,5,6,7-tetra-hidro-1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4,5,6,7-tetra-hidro-1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3-di-hidro-1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,5-di-hidro-1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,7-di-hidro-1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4,5-di-hidro-1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 4,7-di-hidro-1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 6,7-di-hidro-1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 1,4-oxazepin-2- ou -3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; isotiazolidin-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,3-di-hidroisotiazol-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,5-di-hidroisotiazol-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 4,5-di-hidroisotiazol-3- ou -4- ou -5-ila; 1,3-tiazolidin-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,3-di-hidro-1,3-tiazol-2- ou -3- ou -4- ou -5-ila; 2,5-di-hidro-1,3-tiazol-2- ou -4- ou -5-ila; 4,5-di-hidro-1,3-tiazol-2- ou -4- ou -5-ila; 1,3-tiazinan-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,4-di-hidro-2H-1,3-tiazin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 3,6-di-hidro-2H-1,3-tiazin-2- ou -3- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 5,6-di-hidro-2H-1,3-tiazin-2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 5,6-di-

hidro-4H-1,3-tiazin-2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 2H-1,3-tiazin-2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 6H-1,3-tiazin-2- ou -4- ou -5- ou -6-ila; 4H-1,3-tiazin-2- ou -4- ou -5- ou -6-ila. Exemplos adicionais de "heterociclila" são um radical heterocíclico parcial ou totalmente hidrogenado que tem 3 heteroátomos do grupo de N, O e S, por exemplo, 1,4,2-dioxazolidin-2- ou -3- ou -5-ila; 1,4,2-dioxazol-3- ou -5-ila; 1,4,2-dioxazinan-2- ou -3- ou -5- ou -6-ila; 5,6-di-hidro-1,4,2-dioxazin-3- ou -5- ou -6-ila; 1,4,2-dioxazin-3- ou -5- ou -6-ila; 1,4,2-dioxazepan-2- ou -3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 6,7-di-hidro-5H-1,4,2-dioxazepin-3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3-di-hidro-7H-1,4,2-dioxazepin-2- ou -3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 2,3-di-hidro-5H-1,4,2-dioxazepin-2- ou -3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 5H-1,4,2-dioxazepin-3- ou -5- ou -6- ou -7-ila; 7H-1,4,2-dioxazepin-3- ou -5- ou -6- ou -7-ila. Os exemplos estruturais de heterociclos que são opcionalmente substituídos são também adicionalmente listados abaixo:

[0030] Os heterociclos listados acima são, de preferência, substituídos, por exemplo, por hidrogênio, halogênio, alquila, haloalquila, hidroxila, alcóxi, cicloalcóxi, arilóxi, alcoxialquila, alcoxialcóxi, cicloalquila, halocicloalquila, arila, arilalquila, heteroarila, heterociclila, alquenila, alquilcarbonila, cicloalquilcarbonila, arilcarbonila, heteroarilcarbonila, alcoxycarbonila, hidroxycarbonila, cicloalcoxycarbonila, cicloalquilalcoxycarbonila, alcoxycarbonilalquila, arilalcoxycarbonila, arilalcoxycarbonilalquila, alquinila, alquinilalquila, alquilalquinila, trisalquilsililalquinila, nitro, amino, ciano, haloalcóxi, haloalquiltio, alquiltio,

hidrotio, hidroxialquila, oxo, heteroarilalcóxi, arilalcóxi, heterociclilalcóxi, heterociclilalquiltio, heterociclilóxi, heterocicliltio, heteroarilóxi, bisalquilamino, alquilamino, cicloalquilamino, hidroxicarbonilalquilamino, alcoxicarbonilalquilamino, arilalcoxicarbonilalquilamino, alcoxicarbonilalquil(alquil)amino, aminocarbonila, alquilaminocarbonila, bisalquilaminocarbonila, cicloalquilaminocarbonila, hidroxicarbonilalquilaminocarbonila, alcoxicarbonilalquilaminocarbonila, arilalcoxicarbonilalquilaminocarbonila.

[0031] Quando uma estrutura base é substituída "por um ou mais radicais" de uma lista de radicais (= grupo) ou um grupo genericamente definido de radicais, isso, em cada caso, inclui substituição simultânea por uma pluralidade de radicais estruturalmente diferentes e/ou idênticos.

[0032] No caso de um heterociclo de nitrogênio parcial ou totalmente saturado, esse pode ser unido ao restante da molécula por meio de carbono ou por meio do nitrogênio.

[0033] Os substituintes adequados para um radical heterocíclico substituído são os substituintes especificados mais abaixo, e adicionalmente também oxo e tioxo. O grupo oxo como um substituinte em um átomo de carbono de anel é, então, por exemplo, um grupo carbonila no anel heterocíclico. Como resultado, lactonas e lactamas são, de preferência, também incluídas. O grupo oxo também pode estar presente nos heteroátomos de anel, que podem existir em diferentes estados de oxidação, por exemplo, no caso de N e S, e, nesse caso, podem formar, por exemplo, os

grupos divalentes -N(O)-, -S(O)- (também SO para abreviar) e -S(O)₂- (também SO₂ para abreviar) no anel heterocíclico. No caso de grupos -N(O)- e -S(O)-, estão incluídos ambos os enantiômeros em cada caso.

[0034] De acordo com a invenção, a expressão "heteroarila" se refere a compostos heteroaromáticos, isto é, compostos heterocíclicos aromáticos totalmente insaturados, de preferência, sendo que os anéis de 5 a 7 membros têm de 1 a 4, de preferência, 1 ou 2, heteroátomos idênticos ou diferentes, de preferência, O, S ou N. As heteroarilas inventivas são, por exemplo, 1H-pirrol-1-ila; 1H-pirrol-2-ila; 1H-pirrol-3-ila; furan-2-ila; furan-3-ila; tien-2-ila; tien-3-ila, 1H-imidazol-1-ila; 1H-imidazol-2-ila; 1H-imidazol-4-ila; 1H-imidazol-5-ila; 1H-pirazol-1-ila; 1H-pirazol-3-ila; 1H-pirazol-4-ila; 1H-pirazol-5-ila, 1H-1,2,3-triazol-1-ila, 1H-1,2,3-triazol-4-ila, 1H-1,2,3-triazol-5-ila, 2H-1,2,3-triazol-2-ila, 2H-1,2,3-triazol-4-ila, 1H-1,2,4-triazol-1-ila, 1H-1,2,4-triazol-3-ila, 4H-1,2,4-triazol-4-ila, 1,2,4-oxadiazol-3-ila, 1,2,4-oxadiazol-5-ila, 1,3,4-oxadiazol-2-ila, 1,2,3-oxadiazol-4-ila, 1,2,3-oxadiazol-5-ila, 1,2,5-oxadiazol-3-ila, azepinila, piridin-2-ila, piridin-3-ila, piridin-4-ila, pirazin-2-ila, pirazin-3-ila, pirimidin-2-ila, pirimidin-4-ila, pirimidin-5-ila, piridazin-3-ila, piridazin-4-ila, 1,3,5-triazin-2-ila, 1,2,4-triazin-3-ila, 1,2,4-triazin-5-ila, 1,2,4-triazin-6-ila, 1,2,3-triazin-4-ila, 1,2,3-triazin-5-ila, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- e 1,2,6-oxazinila, isoxazol-3-ila, isoxazol-4-ila, isoxazol-5-ila, 1,3-oxazol-2-ila, 1,3-oxazol-4-ila, 1,3-oxazol-5-ila, isotiazol-3-ila, isotiazol-4-ila, isotiazol-5-ila, 1,3-tiazol-2-ila, 1,3-

tiazol-4-ila, 1,3-tiazol-5-ila, oxepinila, tiepinila, 1,2,4-triazolonila e 1,2,4-diazepinila, 2H-1,2,3,4-tetrazol-5-ila, 1H-1,2,3,4-tetrazol-5-ila, 1,2,3,4-oxatriazol-5-ila, 1,2,3,4-tiatrizol-5-ila, 1,2,3,5-oxatriazol-4-ila, 1,2,3,5-tiatrizol-4-ila. Os grupos heteroarila de acordo com a invenção também podem ser substituídos por um ou mais radicais idênticos ou diferentes. Se dois átomos de carbono adjacentes forem parte de um anel aromático adicional, os sistemas são sistemas heteroaromáticos fusionados, como heteroaromáticos benzofusionados ou polianelados. Exemplos preferenciais são quinolinas (por exemplo, quinolin-2-ila, quinolin-3-ila, quinolin-4-ila, quinolin-5-ila, quinolin-6-ila, quinolin-7-ila, quinolin-8-ila); isoquinolinas (por exemplo, isoquinolin-1-ila, isoquinolin-3-ila, isoquinolin-4-ila, isoquinolin-5-ila, isoquinolin-6-ila, isoquinolin-7-ila, isoquinolin-8-il); quinoxalina; quinazolina; cinolina; 1,5-naftiridina; 1,6-naftiridina; 1,7-naftiridina; 1,8-naftiridina; 2,6-naftiridina; 2,7-naftiridina; ftalazina; piridopirazinas; piridopirimidinas; piridopiridazinas; pteridinas; pirimidopirimidinas. Exemplos de heteroarila também são anéis benzofusionados com 5 ou 6 membros do grupo de 1H-indol-1-ila, 1H-indol-2-ila, 1H-indol-3-ila, 1H-indol-4-ila, 1H-indol-5-ila, 1H-indol-6-ila, 1H-indol-7-ila, 1-benzofuran-2-ila, 1-benzofuran-3-ila, 1-benzofuran-4-ila, 1-benzofuran-5-ila, 1-benzofuran-6-ila, 1-benzofuran-7-ila, 1-benzotiofen-2-ila, 1-benzotiofen-3-ila, 1-benzotiofen-4-ila, 1-benzotiofen-5-ila, 1-benzotiofen-6-ila, 1-benzotiofen-7-ila, 1H-indazol-1-ila, 1H-indazol-3-ila, 1H-indazol-4-ila, 1H-indazol-5-ila, 1H-indazol-6-ila,

1H-indazol-7-ila, 2H-indazol-2-ila, 2H-indazol-3-ila, 2H-indazol-4-ila, 2H-indazol-5-ila, 2H-indazol-6-ila, 2H-indazol-7-ila, 2H-isoindol-2-ila, 2H-isoindol-1-ila, 2H-isoindol-3-ila, 2H-isoindol-4-ila, 2H-isoindol-5-ila, 2H-isoindol-6-ila; 2H-isoindol-7-ila, 1H-benzimidazol-1-ila, 1H-benzimidazol-2-ila, 1H-benzimidazol-4-ila, 1H-benzimidazol-5-ila, 1H-benzimidazol-6-ila, 1H-benzimidazol-7-ila, 1,3-benzoxazol-2-ila, 1,3-benzoxazol-4-ila, 1,3-benzoxazol-5-ila, 1,3-benzoxazol-6-ila, 1,3-benzoxazol-7-ila, 1,3-benzotiazol-2-ila, 1,3-benzotiazol-4-ila, 1,3-benzotiazol-5-ila, 1,3-benzotiazol-6-ila, 1,3-benzotiazol-7-ila, 1,2-benzisoxazol-3-ila, 1,2-benzisoxazol-4-ila, 1,2-benzisoxazol-5-ila, 1,2-benzisoxazol-6-ila, 1,2-benzisoxazol-7-ila, 1,2-benzisotiazol-3-ila, 1,2-benzisotiazol-4-ila, 1,2-benzisotiazol-5-ila, 1,2-benzisotiazol-6-ila, 1,2-benzisotiazol-7-ila.

[0035] O termo "halogênio" significa flúor, cloro, bromo ou iodo. Se o termo for usado para um radical, "halogênio" significa um átomo de flúor, cloro, bromo ou iodo.

[0036] De acordo com a natureza dos substituintes e do modo em que os mesmos são unidos, os compostos da fórmula (I) podem estar presentes como estereoisômeros. Se, por exemplo, um ou mais sulfóxidos e/ou átomos de carbono assimetricamente substituídos estiverem presentes, enantiômeros e diastereômeros podem aparecer. Estereoisômeros podem ser obtidos das misturas obtidas na preparação através de métodos de separação habituais, por exemplo, por processos de separação cromatográficos. De modo semelhante, é possível preparar seletivamente estereoisômeros pelo uso de reações estereosseletivas com

uso de auxiliares e/ou materiais de partida opcionalmente ativos.

[0037] A invenção também se refere a todos os estereoisômeros e misturas dos mesmos que são abrangidos pela fórmula (I), mas não definidos especificamente. No entanto, o seguinte texto sempre mencionará, visando a simplicidade, compostos da fórmula (I), mesmo que isso seja entendido como significando não apenas os compostos puros, mas também, se apropriado, misturas com várias quantidades de compostos isoméricos.

[0038] De acordo com a natureza dos substituintes definidos acima, os compostos da fórmula (I) têm propriedades ácidas e podem formar sais e, se adequado, também sais internos ou adutos com bases inorgânicas ou orgânicas ou com íons metálicos. Se os compostos da fórmula (I) carregarem hidroxila, carboxila ou outros grupos que induzem propriedades ácidas, esses compostos podem ser reagidos com bases para gerar sais. As bases adequadas são, por exemplo, hidróxidos, carbonatos, bicarbonatos dos metais alcalinos e metais alcalinos terrosos, em particular, aqueles de sódio, potássio, magnésio e cálcio, ademais, amônia, aminas primárias, secundárias e terciárias que têm grupos (C₁-C₄)-alquila, mono-, di- e trialcanolaminas de (C₁-C₄)-alcanóis, colina e clorocolina, e também aminas orgânicas como trialquilaminas, morfolina, piperidina ou piridina. Esses sais são compostos nos quais o hidrogênio ácido é substituído por um cátion agricolamente adequado, por exemplo, sais de metais, especialmente sais de metais alcalinos ou sais de metais alcalinoterrosos, em particular sais de sódio e potássio,

ou então, sais de amônio, sais com aminas orgânicas ou sais de amônio quaternário, por exemplo, com cátions da fórmula $[NRR'R''R''']^+$ em que R a R''' representam, cada um, independentemente um do outro, um radical orgânico, em particular alquila, arila, aralquila ou alquilarila. Também são adequados sais de alquilsulfônio e alquilsulfoxônio, como sais de (C₁-C₄)-trialquilsulfônio e (C₁-C₄)-trialquilsulfoxônio.

[0039] Os compostos da fórmula (I) podem formar sais através da adição de um ácido orgânico ou inorgânico adequado, por exemplo, ácidos minerais, por exemplo, HCl, HBr, H₂SO₄, H₃PO₄ ou HNO₃, ou ácidos orgânicos, por exemplo, ácidos carboxílicos como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiônico, ácido oxálico, ácido láctico ou ácido salicílico ou ácidos sulfônicos, por exemplo, ácido p-toluenossulfônico, em um grupo básico, por exemplo, amino, alquilamino, dialquilamino, piperidino, morfolino ou piridino. Em tal caso, esses sais compreendem a base de conjugado do ácido como o ânion.

[0040] Os substituintes adequados presentes em forma desprotonada, como, por exemplo, ácidos sulfônicos ou ácidos carboxílicos, podem formar sais internos com grupos que, por sua vez, podem ser protonados, como grupos amino.

[0041] Se um grupo for polissubstituído por radicais, isso significa que esse grupo é substituído por um ou mais radicais idênticos ou diferentes daqueles mencionados.

[0042] Em todas as fórmulas especificadas a seguir no presente documento, os substituintes e símbolos têm o mesmo significado como descrito na fórmula (I), a menos que definido de modo diferente. As setas em uma fórmula

química denotam os pontos em que a mesma é unida ao resto da molécula.

[0043] Segue-se uma descrição de definições preferenciais, particularmente preferenciais e muito particularmente preferenciais de cada um dos substituintes individuais. Os outros substituintes da fórmula geral (I) que não são especificados doravante no presente documento têm a definição dada acima.

[0044] De acordo com uma primeira modalidade da presente invenção,

R^1 e R^2 de preferência, independentemente um do outro representam, cada um, hidrogênio, flúor, cloro ou ciano, ou representam (C_1-C_3) -alquila ou (C_1-C_3) -alcóxi que são, em cada caso, substituídos por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo e ciano.

[0045] Particularmente, de preferência, R^1 e R^2 cada um independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro ou ciano, ou representam metila ou metóxi que são, em cada caso, substituídos por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro.

[0046] Com máxima preferência, R^1 e R^2 representam, cada um, hidrogênio.

[0047] De acordo com uma segunda modalidade da presente invenção,

R^3 de preferência, representa (C_1-C_4) -alquila, (C_3-C_5) -cicloalquila, (C_2-C_4) -alquenila, (C_2-C_4) -alquinila ou (C_1-C_4) -alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo, ciano, (C_1-C_4) -alcóxi e hidróxi.

[0048] Particularmente, de preferência, R^3 representa

(C₁-C₃)-alquila, (C₃-C₄)-cicloalquila, (C₂-C₃)-alquenila, (C₂-C₃)-alquinila ou (C₁-C₃)-alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo, ciano, (C₁-C₂)-alcóxi e hidróxi.

[0049] De acordo com uma terceira modalidade da presente invenção,

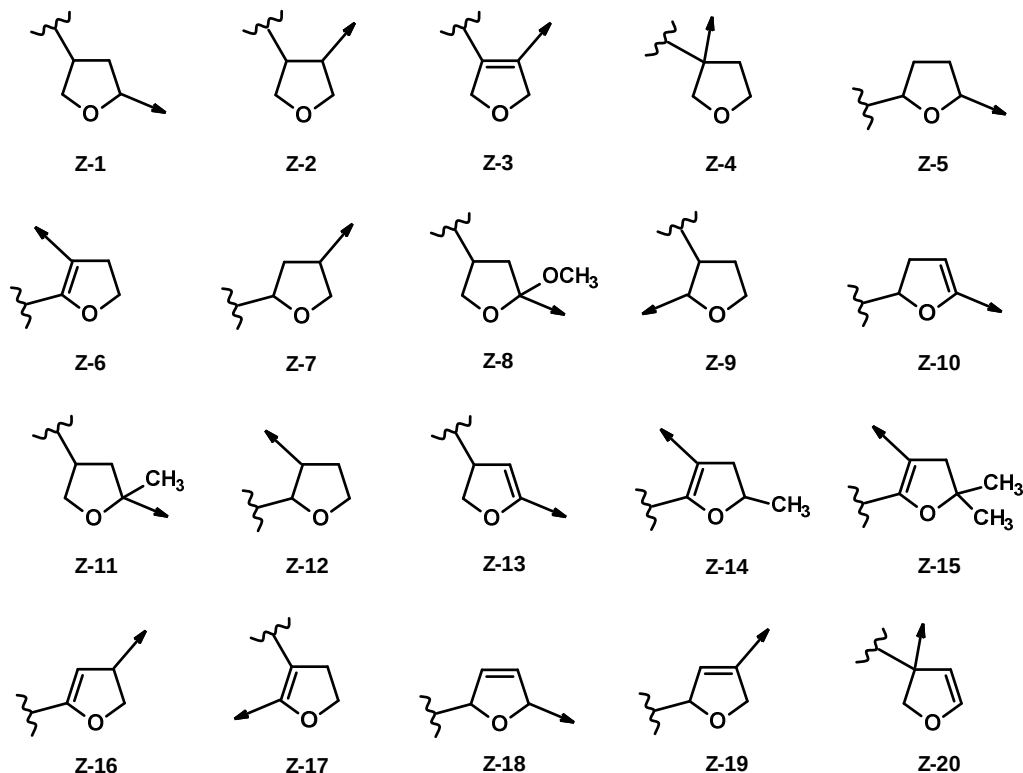
Y representa oxigênio.

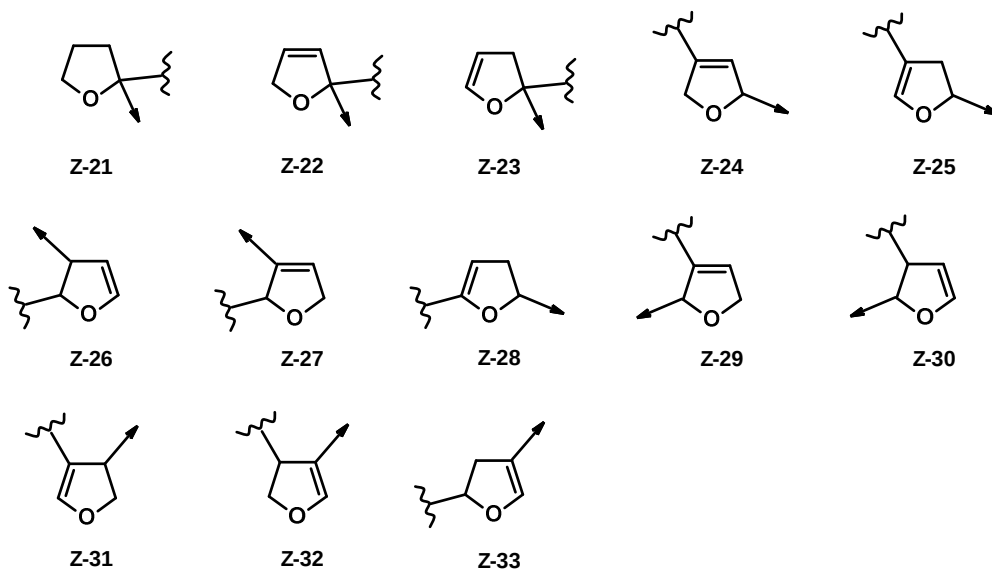
[0050] De acordo com uma quarta modalidade da presente invenção,

W representa oxigênio.

[0051] De acordo com uma sexta modalidade da presente invenção,

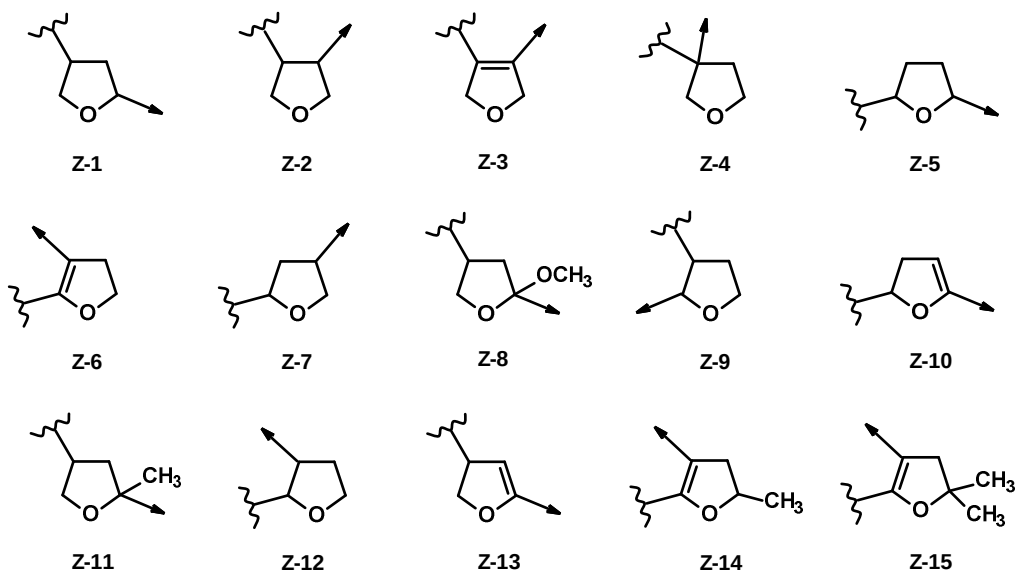
Z de preferência, representa um grupo Z-1 a Z-33, em que Z-1 a Z-33 têm o seguinte significado:





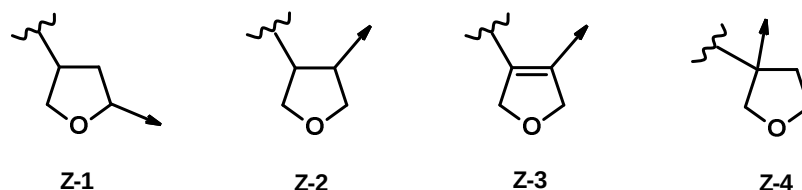
em que a seta em cada caso denota uma ligação ao grupo C=W da fórmula (I).

[0052] Particularmente, de preferência, Z representa um grupo Z-1 a Z-15, em que Z-1 a Z-15 têm o seguinte significado:



em que a seta em cada caso denota uma ligação ao grupo C=W da fórmula (I).

[0053] Com máxima preferência, Z representa Z-1 a Z-4



em que a seta em cada caso denota uma ligação ao grupo $C=W$ da fórmula (I).

[0054] De acordo com uma sétima modalidade da presente invenção,

R^{10} de preferência, representa flúor, cloro, ciano, CO_2H , CO_2CH_3 ou $CO_2CH_2CH_3$, ou representa (C_1-C_2) -alquila ou (C_1-C_2) -alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro.

[0055] De acordo com uma oitava modalidade da presente invenção,

R^{11} de preferência, representa hidrogênio, ou representa (C_1-C_3) -alquila ou (C_3-C_6) -cicloalquila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro.

[0056] De acordo com uma nona modalidade da presente invenção,

R^{12} de preferência, representa hidrogênio, ciano ou hidróxi, ou representa OR^7 , $S(O)_n R^5$, NR^6R^8 , $NR^6CO_2R^8$, (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_2-C_3) -alquenila ou (C_2-C_3) -alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo, ciano ou hidróxi.

[0057] De acordo com uma décima modalidade da presente invenção,

R^{11} e R^{12} juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual os mesmos são fixados formam um anel de cinco ou seis membros

saturado, parcial ou totalmente insaturado que, além desse átomo de nitrogênio, contém r átomos de carbono, n átomos de oxigênio e p elementos do grupo que consiste em NR⁷ e NCOR⁷ como átomos de anel, em que um átomo de carbono carrega p grupos oxo.

[0058] De acordo com uma décima primeira modalidade da presente invenção,

X², X⁴ e X⁶ de preferência, independentemente um do outro representam, cada um, hidrogênio, flúor, cloro, bromo ou ciano, ou representam metila ou metóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro.

[0059] Particularmente preferido, X², X⁴ e X⁶, independentemente um do outro, representam hidrogênio ou flúor.

[0060] De acordo com uma décima segunda modalidade da presente invenção,

X³ e X⁵ de preferência, independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, hidróxi ou ciano, ou representam (C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₃)-alcóxi, (C₃-C₄)-cicloalquila, (C₂-C₃)-alquenila ou (C₂-C₃)-alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e bromo.

[0061] De acordo com uma décima terceira modalidade da presente invenção,

R⁵ de preferência, representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila ou arila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e hidróxi.

[0062] De acordo com uma décima quarta modalidade da presente invenção,

R⁷ de preferência, representa hidrogênio, ou representa (C₁-C₆)-alquila ou (C₃-C₆)-cicloalquila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e (C₁-C₂)-alcóxi.

[0063] De acordo com uma décima quinta modalidade da presente invenção,

R⁸ de preferência, representa hidrogênio, ou representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila ou arila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e (C₁-C₂)-alcóxi.

[0064] De acordo com uma décima sexta modalidade da presente invenção,

m representa o número sequencial 0, 1, 2 ou 3.

[0065] No contexto da presente invenção, os significados mais preferenciais, particularmente preferenciais ou preferenciais individuais dos substituintes R¹ a R³, R⁵ a R⁸, R¹⁰ a R¹², X² a X⁶, W, Y e Z, e os números sequenciais k, m, n, p e r podem ser combinados entre si conforme desejado.

[0066] Isso significa que a presente invenção engloba compostos da fórmula geral (I) em que, por exemplo, o substituinte R¹ tem uma definição preferencial e os substituintes R⁵ a R⁷ têm a definição geral ou, então, o substituinte R² tem uma definição preferencial, o substituinte R³ tem uma definição particularmente preferencial ou muito particularmente preferencial e os substituintes restantes têm uma definição geral.

[0067] Duas dessas combinações das definições dadas acima para os substituintes R¹ a R³, R⁵ a R⁸, R¹⁰ a R¹², X² a X⁶, W, Y e Z, e para os números sequenciais k, m, n, p e r

são ilustradas abaixo por meio de exemplo, e cada uma das mesmas é revelada como uma modalidade adicional:

[0068] De acordo com uma décima sétima modalidade da presente invenção,

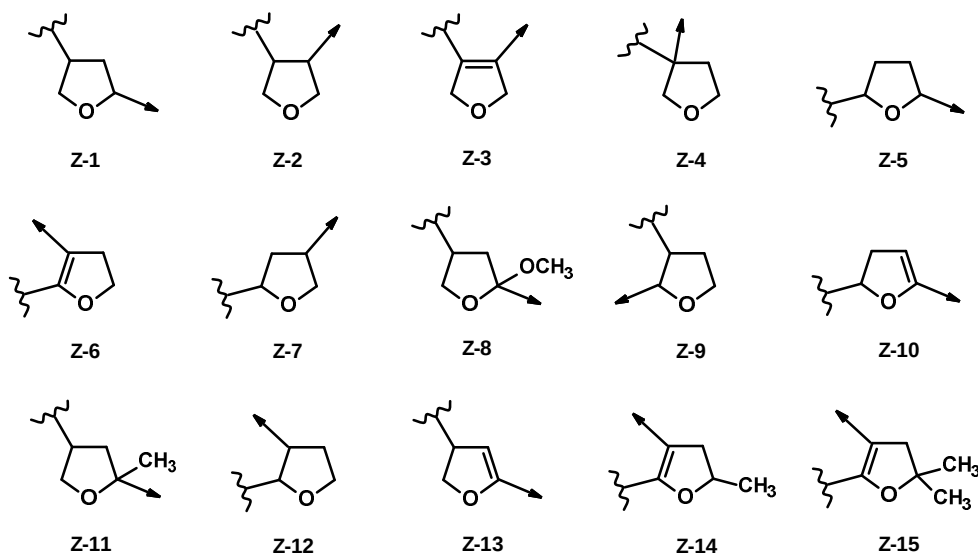
R^1 e R^2 de preferência, independentemente um do outro representam, cada um, hidrogênio, flúor, cloro ou ciano, ou representam (C_1-C_3) -alquila ou (C_1-C_3) -alcóxi que são, em cada caso, substituídos por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo e ciano;

R^3 representa (C_1-C_3) -alquila, (C_3-C_4) -cicloalquila, (C_2-C_3) -alquenila, (C_2-C_3) -alquinila ou (C_1-C_3) -alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo, ciano, (C_1-C_2) -alcóxi e hidróxi;

Y representa oxigênio;

W representa oxigênio;

Z representa um grupo Z-1 a Z-15, em que Z-1 a Z-15 têm o seguinte significado:



em que a seta em cada caso denota uma ligação ao grupo C=W da fórmula (I);

X², X⁴ e X⁶ independentemente um do outro representam, cada um, hidrogênio, flúor, cloro, bromo ou ciano, ou representam metila ou metóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro;

X³ e X⁵ independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, hidróxi ou ciano,

ou

representam (C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₃)-alcóxi, (C₃-C₄)-cicloalquila, (C₂-C₃)-alquenila ou (C₂-C₃)-alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e bromo; e

R⁵ representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila ou arila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e hidróxi;

R⁶ representa hidrogênio ou R⁵;

R⁷ representa hidrogênio,

ou

representa (C₁-C₆)-alquila ou (C₃-C₆)-cicloalquila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e (C₁-C₂)-alcóxi;

R⁸ representa hidrogênio,

ou

representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila ou arila, cada uma das quais é substituída por m

radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e (C₁-C₂)-alcóxi;

R¹¹ representa hidrogênio,

ou

representa (C₁-C₃)-alquila ou (C₃-C₆)-cicloalquila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro;

R¹² representa hidrogênio, ciano ou hidróxi,

ou

representa OR⁷, S(O)_n R⁵, NR⁶R⁸, NR⁶CO₂R⁸, (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₂-C₃)-alquenila ou (C₂-C₃)-alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo, ciano e hidróxi;

ou

R¹¹ e R¹² juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual os mesmos são fixados formam um anel de cinco ou seis membros saturado, parcial ou totalmente insaturado que, além desse átomo de nitrogênio, contém r átomos de carbono, n átomos de oxigênio e p elementos do grupo que consiste em NR⁷ e NCOR⁷ como átomos de anel, em que um átomo de carbono carrega p grupos oxo;

m representa o número sequencial 0, 1, 2 ou 3;

n representa o número sequencial 0, 1 ou 2;

p representa o número sequencial 0 ou 1; e

r representa o número sequencial 3, 4 ou 5.

[0069] De acordo com uma décima oitava modalidade da presente invenção,

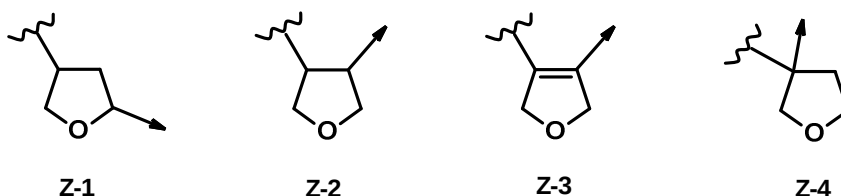
R¹ e R² representam, cada um, hidrogênio;

R³ representa (C₁-C₃)-alquila, (C₃-C₄)-cicloalquila, (C₂-C₃)-alquenila, (C₂-C₃)-alquinila ou (C₁-C₃)-alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo, ciano, (C₁-C₂)-alcóxi e hidróxi;

Y representa oxigênio;

W representa oxigênio;

Z representa um grupo Z-1 a Z-4, em que Z-1 a Z-4 têm o seguinte significado:



em que a seta em cada caso denota uma ligação ao grupo C=W da fórmula (I);

X², X⁴ e X⁶ independentemente um do outro representam, cada um, hidrogênio ou flúor;

X³ e X⁵ independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, hidróxi ou ciano,
ou

representam (C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₃)-alcóxi, (C₃-C₄)-cicloalquila, (C₂-C₃)-alquenila ou (C₂-C₃)-alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e bromo; e

R⁵ representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila ou arila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e hidróxi;

- R⁶ representa hidrogênio ou R⁵;
- R⁷ representa hidrogênio,
ou
representa (C₁-C₆)-alquila ou (C₃-C₆)-cicloalquila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e (C₁-C₂)-alcóxi;
- R⁸ representa hidrogênio,
ou
representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila ou arila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e (C₁-C₂)-alcóxi;
- R¹¹ representa hidrogênio,
ou
representa (C₁-C₃)-alquila ou (C₃-C₆)-cicloalquila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro;
- R¹² representa hidrogênio, ciano ou hidróxi,
ou
representa OR⁷, S(O)_n R⁵, NR⁶R⁸, NR⁶CO₂R⁸, (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₂-C₃)-alquenila ou (C₂-C₃)-alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo, ciano e hidróxi;
ou
- R¹¹ e R¹² juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual os mesmos são fixados formam um anel de cinco ou seis membros saturado, parcial ou totalmente insaturado que, além desse átomo de nitrogênio, contém r átomos de carbono, n átomos de oxigênio

e p elementos do grupo que consiste em NR^7 e NCOR^7 como átomos de anel, em que um átomo de carbono carrega p grupos oxo;

m representa o número sequencial 0, 1, 2 ou 3;

n representa o número sequencial 0, 1 ou 2;

p representa o número sequencial 0 ou 1; e

r representa o número sequencial 3, 4 ou 5.

[0070] Exemplos dos compostos da fórmula geral (I) são mostrados abaixo em forma de tabela. A Tabela 1 abaixo especifica os substituintes definidos em termos gerais na fórmula (I).

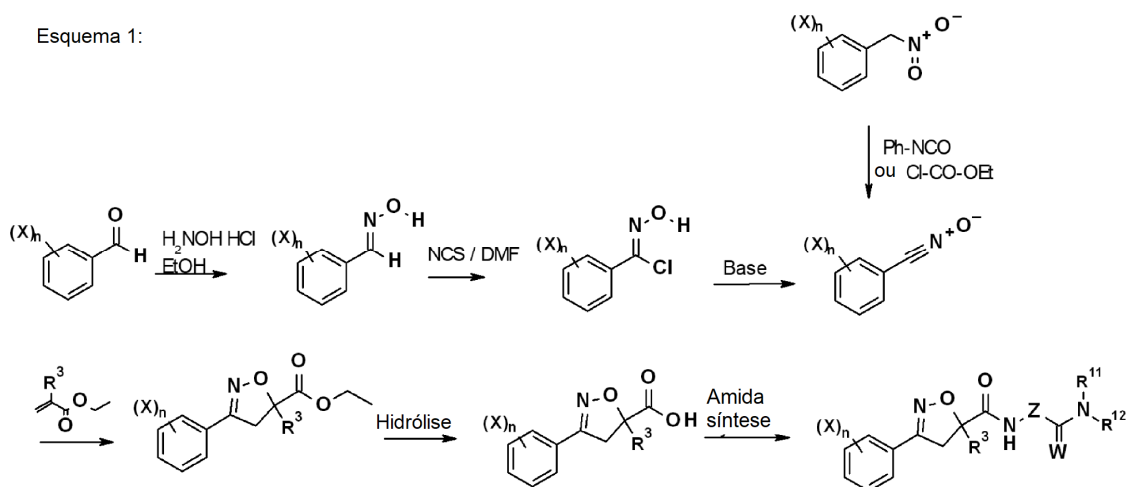
Tabela 1: Compostos da fórmula geral (I) em que $\text{X}^2 = \text{X}^4 = \text{X}^6 = \text{R}^1 = \text{R}^2 = \text{H}$ e representa $\text{Y} = \text{W} = 0$

Nº do Exemplo	X^3	X^5	R^3	Z	R^{11}	R^{12}
I-1	F	F	CH_3	Z-4	H	cic-propila
I-2	F	F	$\text{CH}=\text{CH}_2$	Z-1	H	CH_3
I-3	F	F	CH_3	Z-1		$-(\text{CH}_2)_4-$
I-4	F	F	CH_3	Z-1	H	cic-propila
I-5	F	F	CH_3	Z-1	H	CH_3
I-6	F	F	$\text{CH}=\text{CH}_2$	Z-1		$-(\text{CH}_2)_4-$
I-7	F	F	CH_3	Z-2	H	CH_3
I-8	F	F	CH_3	Z-2	H	cic-propila
I-9	F	F	CH_3	Z-2		$-(\text{CH}_2)_4-$
I-10	F	H	CH_3	Z-1	H	$\text{O}-\text{CH}_3$
I-11	F	F	(S) - $\text{CH}=\text{CH}_2$	Z-1	H	$\text{O}-\text{CH}_3$
I-12	F	F	(S) - $\text{CH}=\text{CH}_2$	Z-1	H	$\text{O}-\text{C}_2\text{H}_5$
I-13	F	F	(S) - $\text{CH}=\text{CH}_2$	Z-1	H	$\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
I-14	F	F	(S) - $\text{CH}=\text{CH}_2$	Z-1	H	SO_2CF_3

Nº do Exemplo	X ³	X ⁵	R ³	Z	R ¹¹	R ¹²
I-15	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	N(CH ₃) ₂
I-16	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	SO ₂ CH ₃
I-17	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	CH ₃	CH ₃
I-18	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	cic-propila
I-19	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	NH-(C=O)-OC(CH ₃) ₃
I-20	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	CH ₂ -CH ₂ -CO ₂ Me
I-21	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	CH ₂ -CO ₂ Me
I-22	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	(3S)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CO ₂ Et
I-23	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	SO ₂ Me
I-24	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	OMe
I-25	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	Me	Me
I-26	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	NMe ₂
I-27	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]metila
I-28	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	SO ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
I-29	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	SO ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
I-30	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	SO ₂ CF ₃

[0071] Os compostos de acordo com a invenção podem ser preparados por meio de vários processos, cujos exemplos são dados abaixo:

Esquema 1:



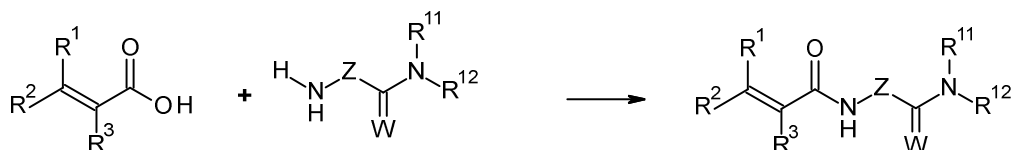
[0072] No Esquema 1 e nos esquemas que seguem, (X)_n representa os substituintes X², X³, X⁴, X⁵ e X⁶. Tais 1,3-dipolar cicloadições de óxidos de nitrila com dipolarofilas adequadas são descritas, por exemplo, nas Reviews: 1,3 dipolar Cycloaddition Chemistry, Padwa, ed. Wiley, Nova York, 1984; Kanemasa e Tsuge, Heterocycles 1990, 30, 719. Para a preparação de cloroximas, vide Kim, Jae N., Riu, Eung K. J. Org. Chem. 1992, 57, 6649).

[0073] Compostos de acordo com a invenção substituídos nas posições 4 e 5 do sistema de anel de isoxazolina podem, igualmente, ser preparados por 1,3-dipolar cicladição com o uso de olefinas 1,2-dissubstituídas adequadamente como dipolarofilas. Frequentemente, essa reação gera misturas de diastereômeros que podem ser separadas por cromatografia em coluna. Isoxazolinas opticamente ativas podem ser obtidas por HPLC quiral de precursores adequados ou produtos finais e também podem ser reações enantiosseletivas, como, por exemplo, éster enzimático ou clivagem de amida ou com o uso de auxiliares quirais na dipolarofila, como descrito por Olssen (J.

Org.Chem. 1988, 53, 2468).

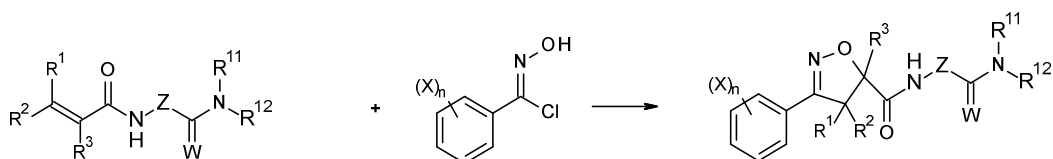
[0074] Para a preparação dos compostos de acordo com a invenção, também é possível usar 2-alcoxiacrilamidas adequadamente substituídas (esquema 3). Essas são obteníveis a partir dos ésteres acrílicos descritos no esquema 2 após hidrólise e formação de amida.

Esquema 2:



[0075] Uma opção para ativar o ácido acrílico são as carbodi-imidas, por exemplo, EDCI (Chen, F. M. F.; Benoiton, N. L. *Synthesis* 1979, 709). Para preparação de acrilamidas, consultar os documentos US 2.521.902, JP60112746, *J. of Polymer Science* 1979, 17 (6), 1655. Acrilamidas adequadamente substituídas podem ser reagidas em uma reação de 1,3-cicloadição com óxidos de nitrila para gerar os compostos, de acordo com a invenção (Esquema 3).

Esquema 3:



[0076] As transformações dos grupos R³ funcionais são possíveis no estágio alceno ou no estágio isoxazolina.

[0077] As coleções de compostos da fórmula (I) e/ou seus sais que podem ser sintetizados pelas reações acima mencionadas também podem ser preparadas de forma paralelizada, caso em que isso pode ser realizado de

maneira manual, parcialmente automatizada ou totalmente automatizada. É possível, por exemplo, automatizar a condução da reação, a constituição ou a purificação dos produtos e/ou intermediários. No geral, entende-se que significa um procedimento como descrito, por exemplo, por D. Tiebes em *Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening* (editor: Günter Jung), Wiley, 1999, nas páginas 1 a 34.

[0078] Os compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção (e/ou sais dos mesmos), referidos coletivamente como "compostos de acordo com a invenção" a seguir no presente documento, têm excelente eficácia herbicida contra um amplo espectro de plantas nocivas anuais monocotiledôneas e dicotiledôneas economicamente importantes.

[0079] Por conseguinte, a presente invenção também proporciona um método para controlar plantas indesejadas ou para regular o crescimento de plantas, de preferência, em culturas em que um ou mais compostos da invenção são aplicados às plantas (por exemplo, plantas prejudiciais tais como ervas daninhas monocotiledôneas ou dicotiledôneas ou culturas indesejadas), à semente (por exemplo, grãos, sementes ou propágulos vegetativos, como tubérculos ou partes de brotos com botões) ou na área em que as plantas crescem (por exemplo, a área cultivada). Os compostos da invenção podem ser aplicados, por exemplo, antes da semeadura (se apropriado também por incorporação no solo), antes da emergência ou após a emergência. Os exemplos específicos de alguns representativos da flora de ervas monocotiledôneas e dicotiledôneas que podem ser

controladas pelos compostos da invenção são como a seguir, embora a enumeração não seja destinada a impor uma restrição às espécies particulares.

[0080] Plantas prejudiciais monocotiledôneas dos gêneros: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

[0081] Ervas daninhas dicotiledôneas do gênero: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

[0082] Quando os compostos de acordo com a invenção são aplicados à superfície do solo antes da germinação, as mudas de vegetações daninhas são impedidas completamente de emergir ou as vegetações daninhas crescem até que tenham atingido o estágio de cotiledôneas, mas, em seguida, param de crescer.

[0083] Se os compostos ativos forem aplicados após a emergência às partes verdes das plantas, o crescimento para após o tratamento e as plantas prejudiciais permanecem no estágio de crescimento do momento da aplicação, ou morrem completamente após certo tempo, de modo que, dessa forma, a concorrência pelas ervas daninhas, que é prejudicial para as culturas, seja eliminada muito cedo e de forma contínua.

[0084] Os compostos, de acordo com a invenção, podem ser seletivos em culturas de plantas úteis e também podem ser empregados como herbicidas não seletivos.

[0085] Em virtude de suas propriedades reguladoras de crescimento herbicidas e vegetais, os compostos ativos também podem ser usados para controlar plantas prejudiciais em culturas de plantas geneticamente modificadas que são conhecidas ou que ainda estão sendo desenvolvidas. Em geral, as plantas transgênicas são caracterizadas por propriedades vantajosas particulares, por exemplo, por resistências a determinados compostos ativos usados na agroindústria, em particular certos herbicidas, resistências a doenças de plantas ou patógenos de doenças de plantas, como certos insetos ou microrganismos como fungos, bactérias ou vírus. Outras características específicas se referem, por exemplo, ao material colhido em relação à quantidade, qualidade, armazenamento, composição e constituintes específicos. Por exemplo, existem plantas transgênicas conhecidas com um teor elevado de amido ou qualidade de amido alterada, ou aquelas com uma composição diferente de ácidos graxos no material colhido. As propriedades particulares adicionais

estão em tolerância ou resistência a fatores de estresse abióticos, por exemplo, calor, frio, seca, salinidade e radiação ultravioleta.

[0086] É dada preferência ao uso dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção ou sais dos mesmos em culturas transgênicas economicamente importantes de plantas úteis e ornamentais.

[0087] Os compostos da fórmula (I) podem ser usados como herbicidas em culturas de plantas úteis que são resistentes, ou que foram tornadas resistentes por engenharia genética, aos efeitos fitotóxicos dos herbicidas.

[0088] As formas convencionais de produção de plantas inovadoras que têm propriedades modificadas em comparação com plantas existentes consistem, por exemplo, em métodos de cultivo tradicionais e na geração de mutantes. Alternativamente, plantas inovadoras com propriedades alteradas podem ser geradas com a ajuda de métodos recombinantes (ver, por exemplo, documentos EP 0221044, EP 0131624). Foram descritos, por exemplo, diversos casos de modificações genéticas de plantas de cultura para fins de modificação do amido sintetizado nas plantas (por exemplo, documentos WO 92/011376 A, WO 92/014827 A, WO 91/019806 A), plantas de cultura transgênicas que são resistentes a determinados herbicidas do tipo glufosinato (consultar, por exemplo, documentos EP 0242236 A, EP 0242246 A) ou do tipo glufosato (documento WO 92/000377A) ou do tipo sulfonilureia (documentos EP 0257993 A, US 5.013.659) ou a combinações ou misturas desses herbicidas através de "empilhamento genético", como plantas de cultura

transgênicas, por exemplo, milho ou soja com o nome comercial ou a designação Optimum™ GAT™ (Glifosato Tolerante a ALS),

- plantas de cultura transgênicas, por exemplo, algodão, com capacidade para produzir toxinas de *Bacillus turingiensis* (toxinas Bt), que tornam as plantas resistentes a pragas específicas (documentos EP 0142924 A, EP 0193259 A),
- plantas de cultura transgênicas que têm uma composição de ácidos graxos modificada (documento WO 91/013972 A),
- plantas de cultura geneticamente modificadas que têm constituintes inovadores ou metabólitos secundários, por exemplo, fitoalexinas inovadoras, que causam um aumento da resistência à doença (documentos EP 0309862 A, EP 0464461 A),
- plantas geneticamente modificadas que têm fotorrespiração reduzida, que têm maior rendimento e maior tolerância a estresse (documento EP 0305398 A),
- plantas de cultura transgênicas que produzem proteínas de importância farmacêutica ou de diagnóstico ("molecular pharming" [farmacêutica molecular]),
- plantas de cultura transgênicas que apresentam maiores rendimentos ou melhor qualidade,
- plantas de cultura transgênicas que são distinguidas por uma combinação, por exemplo, das propriedades inovadoras mencionadas anteriormente ("empilhamento genético").

[0089] Numerosas técnicas de biologia molecular que podem ser usadas para produzir plantas transgênicas inovadoras com propriedades modificadas são conhecidas, em

princípio; ver, por exemplo, I. Potrykus e G. Spangenberg (eds), *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg ou Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

[0090] Para tais manipulações genéticas, as moléculas de ácido nucleico que permitem mutagênese ou alteração de sequência por recombinação de sequências de DNA podem ser introduzidas em plasmídeos. Com a ajuda de métodos padrão, é possível, por exemplo, realizar trocas de bases, remover partes de sequências ou adicionar sequências naturais ou sintéticas. Para a união de fragmentos de DNA uns com os outros, adaptadores ou ligantes podem ser ligados aos fragmentos; consulte, por exemplo, Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2ª edição. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; ou Winnacker "Gene und Klone" [Genes e Clones], VCH Weinheim 2ª edição de 1996.

[0091] Por exemplo, a geração de células de plantas com uma atividade reduzida de um produto de gene pode ser alcançada pela expressão de pelo menos um RNA antissenso correspondente, um RNA senso para alcançar um efeito de cossupressão, ou pela expressão de pelo menos uma ribozima adequadamente construída que cliva especificamente os transcritos do produto genético acima mencionado. Para esse fim, é primeiramente possível usar moléculas de DNA que abrangem toda a sequência de codificação de um produto de gene, incluindo quaisquer sequências de flanqueamento que possam estar presentes, e também moléculas de DNA que abrangem apenas porções da sequência de codificação, no caso em que é necessário que essas porções sejam

suficientemente longas para ter um efeito antissenso nas células. Também é possível usar sequências de DNA que possuem um alto grau de homologia com as sequências de codificação de um produto de gene, mas não são completamente idênticas a elas.

[0092] Ao expressar moléculas de ácido nucleico em plantas, a proteína sintetizada pode estar localizada em qualquer compartimento desejado da célula vegetal. Entretanto, para alcançar a localização em um compartimento particular, é possível, por exemplo, unir a região de codificação a sequências de DNA que garantem a localização em um compartimento particular. Tais sequências são conhecidas dos técnicos no assunto (ver, por exemplo, Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106). As moléculas de ácido nucleico também podem ser expressas nas organelas das células vegetais.

[0093] As células vegetais transgênicas podem ser regeneradas por técnicas conhecidas para dar origem a plantas inteiras. Em princípio, as plantas transgênicas podem ser plantas de quaisquer espécies de planta desejada, isto é, não apenas plantas monocotiledôneas, mas também dicotiledôneas. Assim, podem ser obtidas plantas transgênicas cujas propriedades são alteradas por superexpressão, supressão ou inibição de sequências de genes ou genes homólogos (= naturais) ou expressão de sequências de genes ou genes heterólogos (= estranhos).

[0094] Os compostos (I) de acordo com a invenção podem ser usados com preferência em culturas transgênicas que

são resistentes a reguladores de crescimento, por exemplo, 2,4-D, dicamba, ou a herbicidas que inibem enzimas vegetais essenciais, por exemplo, acetolactato sintases (ALS), EPSP sintases, glutamina sintases (GS) ou hidroxifenilpiruvato dioxigenases (HPPD), ou a herbicidas do grupo das sulfonilureias, dos glifosatos, glufosinatos ou benzoilisoaxazóis e compostos ativos análogos ou a quaisquer combinações desejadas desses compostos ativos.

[0095] Os compostos da invenção podem ser usados com preferência particular em plantas de cultura transgênica que são resistentes a uma combinação de glifosatos e glufosinatos, glifosatos e sulfonilureias ou imidazolinonas. Com máxima preferência, os compostos de acordo com a invenção podem ser usados em plantas de cultura transgênicas como milho ou soja com o nome comercial ou a designação Optimum™ GATM (glifosato tolerante a ALS), por exemplo.

[0096] Quando os compostos ativos da invenção são empregados em culturas transgênicas, não só os efeitos sobre as plantas prejudiciais observadas em outras culturas ocorrem, mas frequentemente também os efeitos que são específicos à aplicação na cultura transgênica particular, por exemplo, um espectro de ervas daninhas alterado ou especificamente ampliado que pode ser controlado, taxas de aplicação alteradas que podem ser usadas para a aplicação, de preferência, boa capacidade de combinação com os herbicidas para os quais a cultura transgênica é resistente, e que influenciam o crescimento e o rendimento das plantas de cultura transgênicas.

[0097] A invenção, portanto, também se refere ao uso dos

compostos de acordo com a invenção da fórmula (I) como herbicidas para controlar plantas prejudiciais em plantas de cultura transgênicas.

[0098] Os compostos da invenção podem ser aplicados na forma de pós molháveis, concentrados emulsionáveis, soluções aspersíveis, produtos em forma de poeira para polvilhar ou grânulos nas formulações habituais. A invenção, portanto, também proporciona composições herbicidas e reguladoras do crescimento vegetal que compreendem os compostos da invenção.

[0099] Os compostos da invenção podem ser formulados de várias maneiras, de acordo com os parâmetros biológicos e/ou físico-químicos necessários. As formulações possíveis incluem, por exemplo: pós molháveis (WP), pós solúveis em água (SP), concentrados solúveis em água, concentrados emulsionáveis (EC), emulsões (EW), como emulsões óleo-em-água e água-em-óleo, soluções aspersíveis, concentrados em suspensão (SC), dispersões à base de óleo ou água, soluções miscíveis com óleo, suspensões de cápsulas (CS), produtos de pó (DP), curativos, grânulos para espalhamento e aplicação no solo, grânulos (GR) sob a forma de microgrânulos, grânulos de aspersão, grânulos de absorção e adsorção, grânulos dispersíveis em água (WG), grânulos solúveis em água (SG), formulações ULV, microcápsulas e ceras. Esses tipos de formulação individuais são conhecidos em princípio e são descritos, por exemplo, em: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4ª Ed. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973, K. Martens, "Spray Drying"

Handbook, 3ª ed., 1979, G. Goodwin Ltd. Londres.

[0100] Os auxiliares de formulação necessários, tais como materiais inertes, surfactantes, solventes e outros aditivos, são igualmente conhecidos e são descritos, por exemplo, em: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2ª Ed., Darland Books, Caldwell N.J.; H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2ª Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide", 2ª Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Enciclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Interface-active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976, Winnacker Küchler, "Chemische Technologie [Chemical Technology]", Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4ª ed., 1986.

[0101] Com base nessas formulações, também é possível produzir combinações com outros compostos ativos, por exemplo, inseticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas e também com protetores, fertilizantes e/ou reguladores do crescimento, por exemplo, na forma de uma formulação pronta ou como uma mistura em tanque.

[0102] Os compostos ativos que podem ser empregados em combinação com os compostos de acordo com a invenção em formulações misturadas ou na mistura de tanque são, por exemplo, compostos ativos conhecidos que têm como base a inibição de, por exemplo, acetolactato sintase, acetil-CoA carboxilase, celulose-sintase, enolpiruvilsiquimato-3-fosfato sintase, glutamina sintetase, p-

hidroxifenilpiruvato dioxigenase, fitoeno desaturase, fotossistema I, fotossistema II, protoporfirinogeno oxidase, como são descritos em, por exemplo, Weed Research 26 (1986) 441-445 ou "The Pesticide Manual", 16ª edição, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2006 e a literatura citada no mesmo. Os herbicidas ou reguladores de crescimento de planta conhecidos que podem ser combinados com os compostos de acordo com a invenção são, por exemplo, os seguintes compostos ativos, em que os ditos compostos são designados com seu "nome comum" de acordo com a Organização Internacional para Padronização (ISO) ou com o nome químico ou com o número de código. Esses sempre abrangem todas as formas de aplicação, como, por exemplo, ácidos, sais, ésteres e também todas as formas isoméricas, como estereoisômeros e isômeros ópticos, mesmo se não mencionado explicitamente.

[0103] Exemplos de tais parceiros de mistura herbicidas são:

acetoclor, acifluorfen, acifluorfen-sódio, alaclor, alidoclor, aloxidim, aloxidim-sódio, ametrin, amicarbazona, amidoclor, amidosulfuron, ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metilfenil)-5-fluoropiridina-2-carboxílico, aminociclopiraclor, aminociclopiraclor-potássio, aminociclopiraclor-metila, aminopirialid, amitrol, amôniosulfamato, anilofós, asulam, atrazina, azafenidin, azimsulfuron, beflubutamid, benazolin, benazolin-etila, benfluralin, benfuresato, bensulfuron, bensulfuron-metila, bensulida, bentazona, benzobiciclon, benzofenap, biciclopiron, bifenox, bilanafós, bilanafós-sódio,

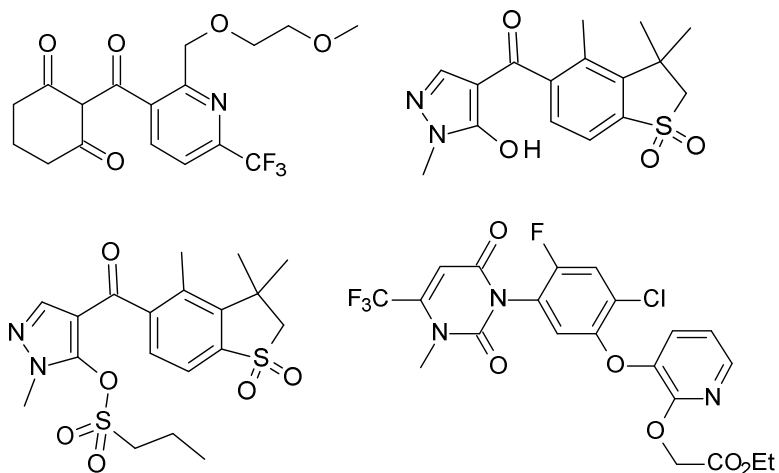
bispiribac, bispiribac-sódio, bromacila, bromobutida, bromofenoxim, bromoxinila, bromoxinil-butirato, -potássio, -heptanoato e -octanoato, busoxinona, butaclor, butafenacila, butamifós, butenaclor, butralin, butroxidim, butilato, cafenstrol, carbetamida, carfentrazona, carfentrazona-etila, cloramben, clorbromuron, clorfenac, clorfenac-sódio, clorfenprop, clorflurenol, clorflurenol-metila, cloridazon, clorimuron, clorimuron-etila, cloroftalim, clorotoluron, clortal-dimetila, clorsulfuron, cinidon, cinidon-etila, cinosulfuron, clacifós, cletodim, clodinafop, clodinafop-propargila, clomazona, clomeprop, clopiralid, cloransulam, cloransulam-metila, cumiluron, cianamida, cianazina, cicloato, ciclopirimorato, ciclosulfamuron, cicloxidim, ci-halofof, ci-halofof-butila, ciprazina, 2,4-D, 2,4-D-butotila, -butila, -dimetilamônio, -diolamina, -etila, -2-etil-hexila, -isobutila, -iso-octila, -isopropilamônio, -potássio, -tri-isopropanolamônio e -trolamina, 2,4-DB, 2,4-DB-butila, -dimetilamônio, -iso-octila, -potássio e -sódio, daimuron (dimron), dalapon, dazomet, n-decanol, desmedifam, detosil-pirazolato (DTP), dicamba, diclobenil, 2-(2,4-diclorobenzil)-4,4-dimetil-1,2-oxazolidin-3-ona, 2-(2,5-diclorobenzil)-4,4-dimetil-1,2-oxazolidin-3-ona, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclofop-metila, diclofop-P-metila, diclosulam, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflufenzopir-sódio, dimefuron, dimepiperato, dimetaclor, dimetametrina, dimetenamid, dimetenamid-P, dimetrasulfuron, dinitramina, dinoterb, difenamid, diquat, dibrometo de diquat, ditiopir, diuron, DNOC, endotal, EPTC, esprocarb, etalfluralin, etametsulfuron, etametsulfuron-metila, etiozin,

etofumesato, etoxifen, etoxifen-etila, etoxisulfuron, etobenzanid, F-5231, isto é, N-[2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoropropil)-4,5-di-hidro-5-oxo-1H-tetrazol-1-il]fenil]etansulfonamida, F-7967, isto é, 3-[7-cloro-5-fluoro-2-(trifluorometil)-1H-benzimidazol-4-il]-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidina-2,4(1H,3H)-diona, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etila, fenoxaprop-P-etila, fenoxasulfona, fenquinoatriona, fentrazamida, flamprop, flamprop-M-isopropila, flamprop-M-metila, flzasulfuron, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butila, fluazifop-P-butila, flucarbazona, flucarbazona-sódio, flucetosulfuron, flucloalalin, flufenacet, flufenpir, flufenpir-etila, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentila, flumioxazin, fluometuron, flurenol, flurenol-butila, -dimetilamônio e -metila, fluoroglicofen, fluoroglicofen-etila, flupropanato, flupirsulfuron, flupirsulfuron-metil-sódio, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, fluroxipir-meptila, flurtamona, flutiacet, flutiacet-metila, fomesafen, fomesafen-sódio, foramsulfuron, fosamina, glufosinato, glufosinato-amônio, glufosinato-P-sódio, glufosinato-P-amônio, glufosinato-P-sódio, glifosato, glifosato-amônio, -isopropilamônio, -diamônio, -dimetilamônio, -potássio, -sódio e -trimésio, H-9201, isto é, O-etil isopropilfosforamidotioato de O-(2,4-dimetil-6-nitrofenila), halauxifen, halauxifen-metila, halosafen, halosulfuron, halosulfuron-metila, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-etoxietila, haloxifop-P-etoxietila, haloxifop-metila, haloxifop-P-metila, hexazinona, HW-02, isto é, (2,4-diclorofenoxi)acetato de 1-(dimetoxifosforil)etila, imazametabenz, imazametabenz-

metila, imazamox, imazamox-amônio, imazapic, imazapic-amônio, imazapir, imazapir-isopropilamônio, imazaquin, imazaquin-amônio, imazetapir, imazetapir-imônio, imazosulfuron, indanofan, indaziflam, iodosulfuron, iodosulfuron-metil-sódio, ioxinila, ioxinil-octanoato, -potássio e -sódio, ipfencarbazona, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxaflutol, carbutilato, KUH-043, isto é, 3-([5-(difluorometil)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfonil)-5,5-dimetil-4,5-di-hidro-1,2-oxazol, cetospiradox, lactofen, lenacila, linuron, MCPA, MCPA-butotila, -dimetilamônio, -2-etil-hexila, -isopropilamônio, -potássio e -sódio, MCPB, MCPB-metila, -etila e -sódio, mecoprop, mecoprop-sódio e -butotila, mecoprop-P, mecoprop-P-butotila, -dimetilamônio, -2-etil-hexila e -potássio, mefenacet, mefluidida, mesosulfuron, mesosulfuron-metila, mesotriona, metabenzthiazuron, metam, metamifop, metamitron, metazaclor, metazosulfuron, metabenzthiazuron, metiopirsulfuron, metiozolin, isotiocianato de metila, metobromuron, metolaclor, S-metolaclor, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron, metsulfuron-metila, molinato, monolinuron, monosulfuron, monosulfuron-ester, MT-5950, isto é, N-[3-cloro-4-(1-metiletil)fenil]-2-metilpentanamida, NGGC-011, napropamida, NC-310, isto é, 4-(2,4-diclorobenzoil)-1-metil-5-benziloxipirazol, neburon, nicosulfuron, ácido nonanoico (ácido pelargônico), norflurazon, ácido oleico (ácidos graxos), orbencarb, ortosulfamuron, orizalin, oxadiargila, oxadiazon, oxasulfuron, oxaziclomefon, oxifluorfen, paraquat, paraquat dicloreto, pebulato, pendimetalina, penoxsulam, pentaclorfenol, pentoxazona, petoxamid, óleos de petróleo,

fenmedifam, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperofós, pretilaclor, primisulfuron, primisulfuron-metila, prodiamina, profoxidim, prometon, prometrin, propaclor, propanila, propaquizafof, propazina, profam, propisoclor, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sódio, propirisulfuron, propizamida, prosulfocarb, prosulfuron, piraclonila, piraflufen, piraflufen-etila, pirasulfotol, pirazolinato (pirazolato), pirazosulfuron, pirazosulfuron-etila, pirazoxifen, piribambenz, piribambenz-isopropila, piribambenz-propila, piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, piriftalid, piriminobac, piriminobac-metila, pirimisulfan, piritiobac, piritiobac-sódio, piroxasulfona, piroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinoclamina, quizalofop, quizalofop-etila, quizalofop-P, quizalofop-P-etila, quizalofop-P-tefurila, rimsulfuron, saflufenacila, setoxidim, siduron, simazina, simetrina, SL-261, sulcotrion, sulfentrazona, sulfometuron, sulfometuron-metila, sulfosulfuron, SYN-523, SYP-249, isto é, 5-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]-2-nitrobenzoato de 1-etoxi-3-metil-1-oxobut-3-en-2-ila, SYP-300, isto é, 1-[7-fluoro-3-oxo-4-(prop-2-in-1-il)-3,4-di-hidro-2H-1,4-benzoxazin-6-il]-3-propil-2-tioxoimidazolidina-4,5-diona, 2,3,6-TBA, TCA (ácido trifluoroacético), TCA-sódio, tebutiuron, tefuriltriona, tembotriona, tepraloxidim, terbacila, terbucarb, terbumeton, terbuthilazina, terbutrina, tenilclor, tiazopir, tiencarbazona, tiencarbazona-metila, tifensulfuron, tifensulfuron-metila, tiobencarb, tiafenacila, tolpiralato, topramezona, tralcoxidim, triafamona, tri-alato, triasulfurona, triaziflam, tribenuron, tribenuron-metila, triclopir, trietazina,

trifloxisulfuron, trifloxisulfuron-sódio, trifludimoxazina, trifluralina, triflusulfuron, triflusulfuron-metila, tritosulfuron, sulfato de ureia, vernolato, XDE-848, ZJ-0862, isto é, 3,4-dicloro-N-{2-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)oxi]benzil}anilina, e também os seguintes compostos:



[0104] Os exemplos de reguladores de crescimento vegetal como possíveis parceiros de mistura são:

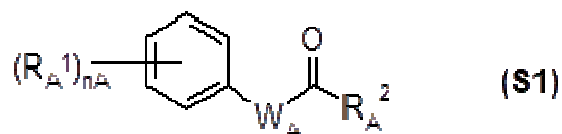
acibenzolar, acibenzolar-S-metila, ácido 5-aminolevulínico, ancimidol, 6-benzilaminopurina, brassinolida, catecol, cloreto de clormequat, cloprop, ciclanilida, ácido 3-(cicloprop-1-enil)propiónico, daminozida, dazomet, n-decanol, dicegulac, dicegulac-sódio, endotal, endotal-dipotássio, -dissódio, e mono(N,N-dimetilalquilamônio), etefon, flumetralina, flurenol, flurenol-butila, flurprimidol, forclorfenurona, ácido giberélico, inabenfida, ácido indol-3-acético (IAA), ácido 4-indol-3-ilbutírico, isoprotiolano, probenazol, ácido jasmônico, éster metílico de ácido jasmônico, hidrazida maleica, cloreto de mepiquat, 1-metilciclopropeno, 2-(1-naftil)acetamida, ácido 1-naftilacético, ácido 2-naftiloxiacético, mistura de nitrofenóxido, ácido 4-oxo-

4[(2-feniletil)amino]butírico, paclobutrazol, ácido N-fenilftalâmico, pro-hexadiona, pro-hexadiona-cálcio, pro-hidrojasmona, ácido salicílico, estrigolactona, tecnazeno, tidiazurona, triacontanol, trinexapac, trinexapac-etila, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P.

[0105] Os protetores que podem ser empregados em combinação com os compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção e opcionalmente em combinação com compostos ativos adicionais como inseticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas conforme listado acima são, de preferência, selecionados a partir do grupo que consiste em:

S1) Compostos da fórmula (S1)

[0106]

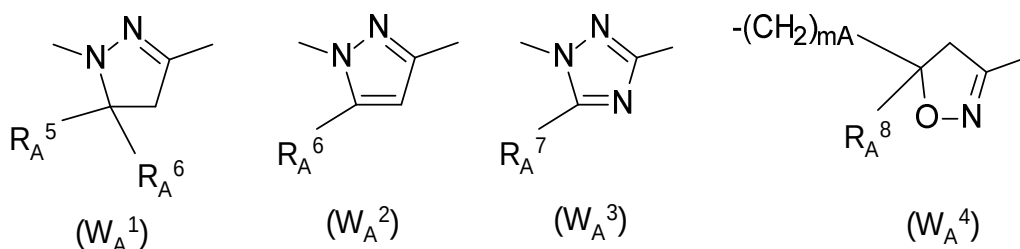


em que os símbolos e índices são definidos como a seguir:

n_A representa um número natural de 0 a 5, de preferência, de 0 a 3;

R_A^1 representa halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi, nitro ou (C_1-C_4) -haloalquila;

W_A representa um radical heterocíclico divalente substituído ou não substituído do grupo dos heterociclos de cinco membros aromáticos ou parcialmente insaturados que têm 1 a 3 heteroátomos de anel do grupo N e O, em que pelo menos um átomo de nitrogênio e, no máximo, um átomo de oxigênio está presente no anel, de preferência, um radical do grupo de (W_A^1) a (W_A^4) ,



m_A representa 0 ou 1;

R_A^2 representa OR_A^3 , SR_A^3 ou $NR_A^3R_A^4$ ou um heterociclo de 3 a 7 membros saturado ou insaturado que tem pelo menos um átomo de hidrogênio e até 3 heteroátomos, de preferência, do grupo que consiste em O e S, que é ligado ao grupo carbonila em (S1) através do átomo de hidrogênio e é não substituído ou substituído por radicais do grupo que consiste em (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi ou fenila opcionalmente substituída, de preferência, um radical da fórmula OR_A^3 , NHR_A^4 ou $N(CH_3)_2$, especificamente da fórmula OR_A^3 ;

R_A^3 representa hidrogênio ou um radical de hidrocarboneto alifático não substituído ou substituído que tem de preferência um total de 1 a 18 átomos de carbono;

R_A^4 representa hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -alcóxi ou fenila substituída ou não substituída;

R_A^5 representa H, (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -haloalquila, (C_1-C_4) -alcoxi- (C_1-C_8) -alquila, ciano ou $COOR_A^9$, em que R_A^9 representa hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -haloalquila, (C_1-C_4) -alcoxi- (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_6) -hidroxialquila, (C_3-C_{12}) -cicloalquila ou tri- (C_1-C_4) -alquilsilila;

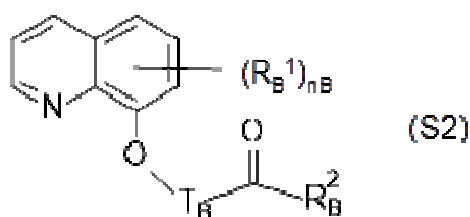
R_A^6 , R_A^7 , R_A^8 são idênticos ou diferentes e representam hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -haloalquila, (C_3-C_{12}) -cicloalquila ou fenila substituída ou não substituída; de preferência:

- a) compostos do tipo ácido diclorofenilpirazolina-3-carboxílico (S1^a), de preferência, compostos, como ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-(etoxicarbonil)-5-metil-2-pirazolina-3-carboxílico, 1-(2,4-diclorofenil)-5-(etoxicarbonil)-5-metil-2-pirazolina-3-carboxilato de etila (S1-1) ("mefenpir-dietila"), e compostos relacionados como descrito no documento W0-A-91/07874;
- b) derivados de ácido diclorofenilpirazolcarboxílico (S1^b), de preferência, compostos como 1-(2,4-diclorofenil)-5-metilpirazol-3-carboxilato de etila (S1-2), 1-(2,4-diclorofenil)-5-isopropilpirazol-3-carboxilato de etila (S1-3), 1-(2,4-diclorofenil)-5-(1,1-dimetiletil)pirazol-3-carboxilato de etila (S1-4) e compostos relacionados como descrito nos documentos EP-A-333 131 e EP-A-269 806;
- c) derivados de ácido 1,5-difenilpirazol-3-carboxílico (S1^c), de preferência, compostos como 1-(2,4-diclorofenil)-5-fenilpirazol-3-carboxilato de etila (S1-5), 1-(2-clorofenil)-5-fenilpirazol-3-carboxilato de metila (S1-6) e compostos relacionados como descrito, no documento EP-A-268 554, por exemplo;
- d) compostos do tipo ácido triazolcarboxílico (S1^d), de preferência, compostos como fenclorazol (éster etílico), isto é, 1-(2,4-diclorofenil)-5-triclorometil-(1H)-1,2,4-triazol-3-carboxilato de etila (S1-7), e compostos relacionados, como descrito nos documentos EP-A-174 562 e EP-A-346 620;
- e) compostos do tipo ácido 5-benzil- ou 5-fenil-2-isoxazolina-3-carboxílico ou ácido 5,5-difenil-2-isoxazolina-3-carboxílico (S1^e), de preferência, compostos como 5-(2,4-diclorobenzil)-2-isoxazolina-3-carboxilato de

etila (S1-8) ou 5-fenil-2-isoxazolina-3-carboxilato de etila (S1-9) e compostos relacionados como descrito no documento W0-A-91/08202, ou ácido 5,5-difenil-2-isoxazolina-3-carboxílico (S1-10) ou 5,5-difenil-2-isoxazolina-3-carboxilato de etila (S1-11) ("isoxadifen-etila") ou 5,5-difenil-2-isoxazolina-3-carboxilato de n-propila (S1-12) ou 5-(4-fluorofenil)-5-fenil-2-isoxazolina-3-carboxilato de etila (S1-13), como descrito no pedido de patente W0-A-95/07897.

S2) Derivados de quinolina da fórmula (S2)

[0107]



em que os símbolos e índices têm os significados abaixo:

R_B^1 representa halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi, nitro ou (C_1-C_4) -haloalquila;

n_B representa um número natural de 0 a 5, de preferência, de 0 a 3;

R_B^2 representa OR_B^3 , SR_B^3 ou $NR_B^3R_B^4$ ou um heterociclo de 3 a 7 membros saturado ou insaturado que tem pelo menos um átomo de hidrogênio e até 3 heteroátomos, de preferência, do grupo de O e S, que é ligado através do átomo de hidrogênio ao grupo carbonila em (S2) e é não substituído ou substituído por radicais do grupo de (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi ou fenila opcionalmente substituída, de preferência, um radical da fórmula OR_B^3 , NHR_B^4 ou $N(CH_3)_2$, especificamente da fórmula OR_B^3 ;

R_B³ representa hidrogênio ou um radical de hidrocarboneto alifático não substituído ou substituído que tem de preferência um total de 1 a 18 átomos de carbono;

R_B⁴ representa hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alcóxi ou fenila substituída ou não substituída;

T_B representa uma cadeia (C₁ ou C₂)-alcanodi-ila que é não substituída ou substituída por um ou dois radicais (C₁-C₄)-alquila ou por [(C₁-C₃)-alcoxi]carbonila; de preferência:

a) compostos do tipo ácido 8-quinolinoxiacético (S2^a), de preferência,

(5-cloro-8-quinolinoxí)acetato de 1-metil-hexila ("cloquintocet-mexila") (S2-1),

(5-cloro-8-quinolinoxí)acetato de (1,3-dimetilbut-1-ila) (S2-2),

(5-cloro-8-quinolinoxí)acetato de 4-aliloxibutíla (S2-3),

(5-cloro-8-quinolinoxí)acetato de 1-aliloxiprop-2-ila (S2-4),

(5-cloro-8-quinolinoxí)acetato de etíla (S2-5),

(5-cloro-8-quinolinoxí)acetato de metíla (S2-6),

(5-cloro-8-quinolinoxí)acetato de alíla (S2-7),

(5-cloro-8-quinolinoxí)acetato de 2-(2-propilidenoiminoxí)-1-etíla (S2-8), (5-cloro-8-quinolinoxí)acetato de 2-oxoprop-1-ila (S2-9) e compostos relacionados, como descrito nos documentos EP-A-86 750, EP-A-94 349 e EP-A-191 736 ou EP-A-0 492 366, e também ácido

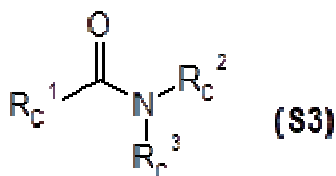
(5-cloro-8-quinolinoxí)acético (S2-10), hidratos e sais dos mesmos, por exemplo, o lítio, sódio, potássio, cálcio, magnésio, alumínio, ferro, amônio, amônio quaternário,

sulfônio ou sais de fosfônio dos mesmos, como descrito no documento WO-A-2002/34048;

b) compostos do tipo ácido (5-cloro-8-quinolinoxim)malônico (S2^b), de preferência, compostos como (5-cloro-8-quinolinoxim)malonato de dietila, (5-cloro-8-quinolinoxim)malonato de dialila, (5-cloro-8-quinolinoxim)malonato de metil etila e compostos relacionados, como descrito no documento EP-A-0 582 198.

S3) Compostos da fórmula (S3)

[0108]



em que os símbolos e índices são definidos como a seguir:

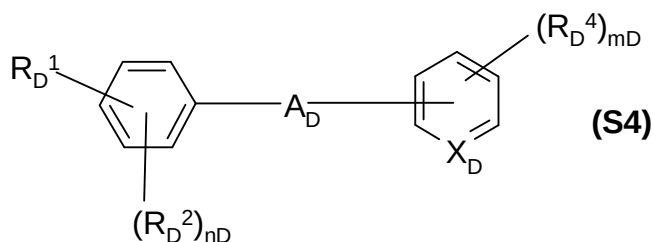
R¹ representa (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₂-C₄)-alquenila, (C₂-C₄)-haloalquenila, (C₃-C₇)-cicloalquila, de preferência, diclorometila;

R², R³ são idênticos ou diferentes e representam hidrogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₂-C₄)-alquenila, (C₂-C₄)-alquinila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₂-C₄)-haloalquenila, (C₁-C₄)-alquilcarbamoil-(C₁-C₄)-alquila, (C₂-C₄)-alquenilcarbamoil-(C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcoxi-(C₁-C₄)-alquila, dioxolanil-(C₁-C₄)-alquila, tiazolila, furila, furilalquila, tienila, piperidila, fenila substituída ou não substituída, ou R² e R³ juntos formam um anel heterocíclico substituído ou não substituído, de preferência, um anel de oxazolidina, tiazolidina, piperidina, morfolina, hexa-hidropirimidina ou benzoxazina; de preferência:

os compostos ativos do tipo dicloroacetamida, que são frequentemente usados como fitoprotetores pré-emergência (fitoprotetores que atuam no solo), por exemplo, "diclormida" (N,N-dialil-2,2-dicloroacetamida) (S3-1), "R-29148" (3-dicloroacetil-2,2,5-trimetil-1,3-oxazolidina) da Stauffer (S3-2), "R-28725" (3-dicloroacetil-2,2-dimetil-1,3-oxazolidina) da Stauffer (S3-3), "benoxacor" (4-dicloroacetil-3,4-di-hidro-3-metil-2H-1,4-benzoxazina) (S3-4), "PPG-1292" (N-alil-N-[(1,3-dioxolan-2-il)metil]dicloroacetamida) da PPG Industries (S3-5), "DKA-24" (N-alil-N-[(alilaminocarbonil)metil]dicloroacetamida) da Sagro-Chem (S3-6), "AD-67" ou "MON 4660" (3-dicloroacetil-1-oxa-3-azaspiro[4,5]decano) da Nitrokemia ou Monsanto (S3-7), "TI-35" (1-dicloroacetilazepano) do TRI-Chemical RT (S3-8), "diclonon" (diciclonon) ou "BAS145138" ou "LAB145138" (S3-9) ((RS)-1-dicloroacetil-3,3,8a-trimetilper-hidropirrolo[1,2-ona]pirimidin-6-ona) da BASF, "furilazol" ou "MON 13900" ((RS)-3-dicloroacetil-5-(2-furil)-2,2-dimetiloxazolidina) (S3-10), e o (R) isômero do mesmo (S3-11).

S4) N-acilsulfonamidas da fórmula (S4) e sais das mesmas,

[0109]



em que os símbolos e os índices são definidos como a seguir:

A_D representa $SO_2-NR_D^3-CO$ ou $CO-NR_D^3-SO_2$

X_D representa CH ou N;

R_D^1 representa $CO-NR_D^5R_D^6$ ou $NHCO-R_D^7$;

R_D^2 representa halogênio, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -haloalcóxi, nitro, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi, (C_1-C_4) -alquilsulfonila, (C_1-C_4) -alcoxicarbonila ou (C_1-C_4) -alquilcarbonila;

R_D^3 representa hidrogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_2-C_4) -alquenila ou (C_2-C_4) -alquinila;

R_D^4 representa, nitro, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -haloalcóxi, (C_3-C_6) -cicloalquila, fenila, (C_1-C_4) -alcóxi, ciano, (C_1-C_4) -alquiltio, (C_1-C_4) -alquilsulfinila, (C_1-C_4) -alquilsulfonila, (C_1-C_4) -alcoxicarbonila ou (C_1-C_4) -alquilcarbonila;

R_D^5 representa hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_6) -alquinila, (C_5-C_6) -cicloalquenila, fenila ou heterociclila de 3 a 6 membros que contêm heteroátomos v_D do grupo que consiste em nitrogênio, oxigênio e enxofre, em que os sete últimos radicais mencionados são substituídos por substituintes v_D do grupo que consiste em halogênio, (C_1-C_6) -alcóxi, (C_1-C_6) -haloalcóxi, (C_1-C_2) -alquilsulfinila, (C_1-C_2) -alquilsulfonila, (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_1-C_4) -

alcoxicarbonila, (C₁-C₄)-alquilcarbonila e fenila e, no caso de radicais cíclicos, também (C₁-C₄)-alquila e (C₁-C₄)-haloalquila;

R_D⁶ representa hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₂-C₆)-alquenila ou (C₂-C₆)-alquinila, em que os três últimos radicais mencionados são substituídos por radicais v_D do grupo que consiste em halogênio, hidróxi, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcóxi e (C₁-C₄)-alquiltio, ou

R_D⁵ e R_D⁶ juntamente com o átomo de hidrogênio que porta os mesmos formam um radical de pirrolidinila ou piperidinila;

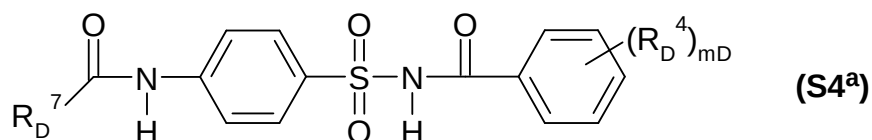
R_D⁷ representa hidrogênio, (C₁-C₄)-alquilamino, di-(C₁-C₄)-alquilamino, (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, em que os 2 últimos radicais mencionados são substituídos por substituintes v_D do grupo que consiste em halogênio, (C₁-C₄)-alcóxi, (C₁-C₆)-haloalcóxi e (C₁-C₄)-alquiltio e, no caso de radicais cíclicos, também (C₁-C₄)-alquila e (C₁-C₄)-haloalquila;

n_D representa 0, 1 ou 2;

m_D representa 1 ou 2;

v_D representa 0, 1, 2 ou 3;

dentre esses, é dada preferência a compostos do tipo N-acilsulfonamida, por exemplo, da fórmula (S4^a) abaixo, que são conhecidos, por exemplo, a partir do documento W0-A-97/45016



em que

R_D⁷ representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, em que os 2 últimos radicais mencionados são substituídos por

substituintes v_D do grupo que consiste em halogênio, (C_1-C_4) -alcóxi, (C_1-C_6) -haloalcóxi e (C_1-C_4) -alquiltio e, no caso de radicais cíclicos, também (C_1-C_4) -alquila e (C_1-C_4) -haloalquila;

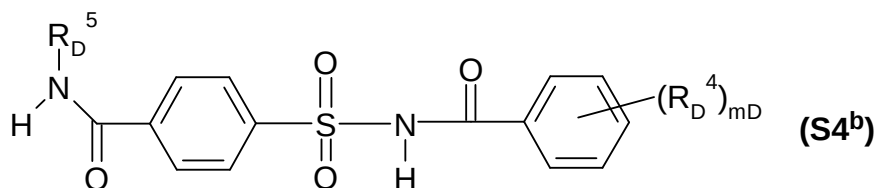
R_D^4 representa halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi, CF_3 ;

m_D representa 1 ou 2;

v_D representa 0, 1, 2 ou 3;

e

acilsulfamoilbenzamidás, por exemplo, da fórmula (S4^b) abaixo, que são conhecidas, por exemplo, a partir do documento WO-A-99/16744,



por exemplo, aqueles em que

R_D^5 = ciclopropila e (R_D^4) = 2-OMe ("ciprossulfamida", S4-1),

R_D^5 = ciclopropila e (R_D^4) = 5-Cl-2-OMe (S4-2),

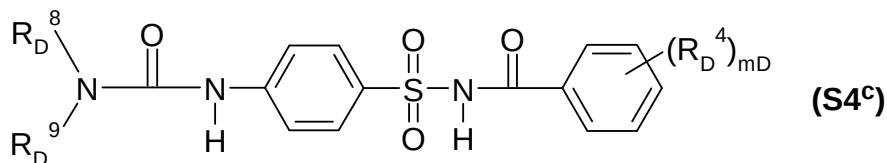
R_D^5 = etila e (R_D^4) = 2-OMe (S4-3),

R_D^5 = isopropila e (R_D^4) = 5-Cl-2-OMe (S4-4) e

R_D^5 = isopropila e (R_D^4) = 2-OMe (S4-5)

e

compostos do tipo N-acilsulfamoilfenilureia, da fórmula (S4^c), que são conhecidos, por exemplo, a partir do documento EP-A-365484,



em que

R_D^8 e R_D^9 independentemente um do outro representam hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_6) -alquenila, (C_3-C_6) -alquinila,

R_D^4 representa halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi, CF_3 ,

m_D representa 1 ou 2;

por exemplo,

1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3-metilureia,

1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3,3-

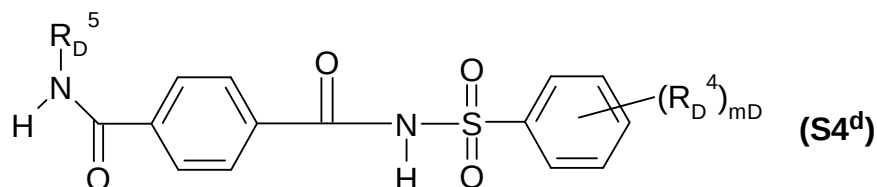
dimetilureia,

1-[4-(N-4,5-dimetilbenzoilsulfamoil)fenil]-3-

metilureia,

e

N-fenilsulfoniltereftalamidas da fórmula (S4^d), que são conhecidas, por exemplo, a partir do documento CN 101838227,



por exemplo, aqueles em que

R_D^4 representa halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi, CF_3 ;

m_D representa 1 ou 2;

R_D^5 representa hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_6) -alquinila, (C_5-C_6) -cicloalquenila.

S5) Compostos ativos da classe dos hidroxiaromáticos e os derivados de ácido carboxílico aromáticos-alifáticos (S5),

por exemplo,

[0110]

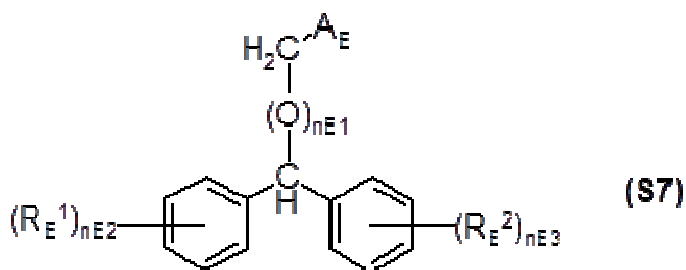
3,4,5-triacetoxibenzoato de etila, ácido 3,5-dimetoxi-4-hidroxibenzoico, ácido 3,5-di-hidroxibenzoico, ácido 4-hidroxissalicílico, ácido 4-fluorossalicílico, ácido 2-hidroxicinâmico, ácido 2,4-diclorocinâmico, como descrito nos documentos WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001.

S6) Compostos ativos da classe das 1,2-di-hidroquinoxalin-2-onas (S6), por exemplo,

[0111]

1-metil-3-(2-tienil)-1,2-di-hidroquinoxalin-2-ona, 1-metil-3-(2-tienil)-1,2-di-hidroquinoxalina-2-tiona, cloridrato de 1-(2-aminoetil)-3-(2-tienil)-1,2-di-hidroquinoxalin-2-ona, 1-(2-metilsulfonilaminoetil)-3-(2-tienil)-1,2-di-hidroquinoxalin-2-ona, como descrito no documento WO-A-2005/112630.

S7) Compostos da fórmula (S7), como descrito no documento WO-A-1998/38856,



em que os símbolos e os índices são definidos como a seguir:

R_E^1 , R_E^2 independentemente um do outro representam halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -alquilamino, di- (C_1-C_4) -alquilamino,

nitro;

A_E representa $COOR_E^3$ ou $COSR_E^4$

R_E^3 , R_E^4 independentemente um do outro representam hidrogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_4) -alquinila, cianoalquila, (C_1-C_4) -haloalquila, fenila, nitrofenila, benzila, halobenzila, piridinilalquila e alquilamônio,

n_E^1 representa 0 ou 1

n_E^2 , n_E^3 independentemente um do outro representam 0, 1 ou 2,

de preferência:

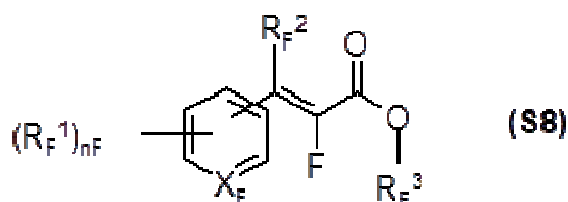
ácido difenilmetoxiacético,

difenilmetoxiacetato de etila,

difenilmetoxiacetato de metila (nº de reg. de CAS 41858-19-9) (S7-1).

S8) Compostos da fórmula (S8), como descrito no documento WO-A-98/27049,

[0112]



em que

X_F representa CH ou N,

n_F no caso em que $X_F=N$ é um número inteiro de 0 a 4 e

no caso em que $X_F=CH$ é um número inteiro de 0 a 5,

R_F^1 representa halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -alcóxi, (C_1-C_4) -haloalcóxi, nitro, (C_1-C_4) -alquiltio, (C_1-C_4) -alquilsulfonila, (C_1-C_4) -alcoxicarbonila, fenila opcionalmente substituída, fenóxi

opcionalmente substituído,

R_F^2 representa hidrogênio ou (C_1-C_4) -alquila,

R_F^3 representa hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_2-C_4) -alquenila, (C_2-C_4) -alquinila ou arila, em que cada um dos radicais contendo carbono supracitados é não substituído ou substituído por um ou mais, de preferência, até três radicais idênticos ou diferentes do grupo que consiste em halogênio e alcóxi; ou sais dos mesmos, de preferência, compostos em que

X_F representa CH,

n_F representa um número inteiro de 0 a 2,

R_F^1 representa halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -alcóxi, (C_1-C_4) -haloalcóxi,

R_F^2 representa hidrogênio ou (C_1-C_4) -alquila,

R_F^3 representa hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_2-C_4) -alquenila, (C_2-C_4) -alquinila ou arila, em que cada um dos radicais contendo carbono supracitados é não substituído ou substituído por um ou mais, de preferência, até três radicais idênticos ou diferentes do grupo que consiste em halogênio e alcóxi, ou sais dos mesmos.

S9) Compostos ativos da classe das 3-(5-tetrazolilcarbonil)-2-quinolonas (S9), por exemplo,

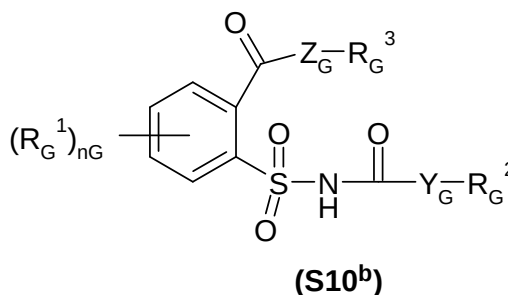
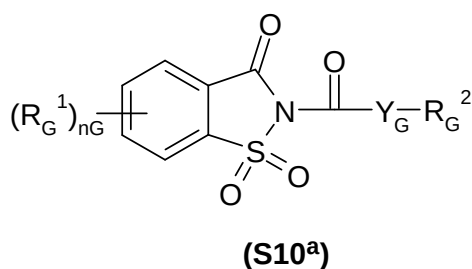
[0113]

1,2-di-hidro-4-hidroxi-1-etil-3-(5-tetrazolilcarbonil)-2-quinolona (nº de reg. de CAS 219479-18-2), 1,2-di-hidro-4-hidroxi-1-metil-3-(5-tetrazolilcarbonil)-2-quinolona (nº de reg. de CAS 95855-00-8), como descrito no documento WO-A-1999/000020.

S10) Compostos da fórmula (S10^a) ou (S10^b)

[0114]

como descrito nos documentos WO-A-2007/023719 e WO-A-2007/023764



em que

R_G^1 representa halogênio, (C₁-C₄)-alquila, metóxi, nitro, ciano, CF₃, OCF₃,

Y_G , Z_G independentemente um do outro representam O ou S,

n_G representa um número inteiro de 0 a 4,

R_G^2 representa (C₁-C₁₆)-alquila, (C₂-C₆)-alquenila, (C₃-C₆)-cicloalquila, arila; benzila, halobenzila,

R_G^3 representa hidrogênio ou (C₁-C₆)-alquila.

S11) Compostos ativos do tipo composto oxi-imino (S11), que são conhecidos como agentes de peliculização de semente, por exemplo,

[0115]

"oxabetrinila" ((Z)-1,3-dioxolan-2-ilmetoxi-imino(fenil)acetonitrila) (S11-1), que é conhecido como um protetor de peliculização de semente para painço/sorgo contra danos de metolaclor,

"fluxofenim" (1-(4-clorofenil)-2,2,2-trifluoro-1-etanone O-(1,3-dioxolan-2-ilmetil)oxima) (S11-2), que é conhecido como um protetor de peliculização de semente para painço/sorgo contra danos de metolaclor, e

"ciometrinila" ou "CGA-43089" ((Z)-cianometoxi-imino(fenil)acetonitrila) (S11-3), que é conhecido como um fitoprotetor de peliculização de semente para painço/sorgo contra danos de metolaclor.

S12) Compostos ativos da classe das isotiocromanonas (S12), por exemplo,

[0116]

[(3-oxo-1H-2-benzotiopiran-4(3H)-ilideno)metoxi]acetato de metila (nº de Reg. de CAS 205121-04-6) (S12-1) e compostos relacionados do documento WO-A-1998/13361.

S13) Um ou mais compostos do grupo (S13):

[0117]

"anidrido naftálico" (anidrido 1,8-naftalenodicarboxílico) (S13-1), que é conhecido como um fitoprotetor de peliculização de semente para milho contra danos de herbicida tiocarbamato,

"fenclorim" (4,6-dicloro-2-fenilpirimidina) (S13-2), que é conhecido como um fitoprotetor para pretilaclor em arroz semeado,

"flurazol" (2-cloro-4-trifluorometil-1,3-tiazol-5-carboxilato de benzila) (S13-3), que é conhecido como um fitoprotetor de peliculização de semente para painço/sorgo contra danos de alaclor e metolaclor,

"CL 304415" (nº de Reg. de CAS 31541-57-8)

(ácido 4-carboxi-3,4-di-hidro-2H-1-benzopiran-4-acético) (S13-4) da American Cyanamid, que é conhecido como um fitoprotetor para milho contra danos por imidazolinonas,

"MG 191" (nº de Reg. de CAS 96420-72-3) (2-diclorometil-2-metil-1,3-dioxolano) (S13-5) da Nitrokemia, que é conhecido como um fitoprotetor para milho,

"MG 838" (nº de Reg. de CAS 133993-74-5)
 (1-oxa-4-azaspiro[4.5]decano-4-carboditioato de 2-propenila) (S13-6) de Nitroquemia,
 "disulfoton" (fosforoditioato de 0,0-dietil S-2-etiltioetila) (S13-7),
 "dietolato" (fosforotioato de 0,0-dietil O-fenila) (S13-8),
 "mefenato" (metilcarbamato de 4-clorofenila) (S13-9).

S14) Compostos ativos que, além de ação herbicida contra plantas prejudiciais, também têm ação de fitoprotetor em plantas de cultura como arroz, por exemplo,

[0118]

"dimepiperato" ou "MY 93" (1-feniletilpiperidina-1-carbotioato de S-1-metila), que é conhecido como um fitoprotetor para arroz contra danos pelo herbicida molinato,

"daimuron" ou "SK 23" (1-(1-metil-1-feniletil)-3-p-tolilureia), que é conhecido como fitoprotetor para arroz contra danos de herbicida imazossulfurona,

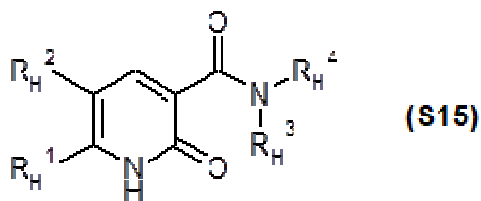
"cumiluron" = "JC 940" (3-(2-clorofenilmetil)-1-(1-metil-1-feniletil)ureia, consulte o documento JP-A-60087254), que é conhecido como fitoprotetor para arroz contra danos por alguns herbicidas,

"metoxifenona" ou "NK 049" (3,3'-dimetil-4-metoxibenzofenona), que é conhecido como um fitoprotetor para arroz contra danos por alguns herbicidas,

"CSB" (1-bromo-4-(clorometilsulfonil)benzeno) da Kumiai, (nº de Reg. de CAS 54091-06-4), que é conhecido como um fitoprotetor contra danos por alguns herbicidas em arroz.

S15) Compostos da fórmula (S15) ou tautômeros dos mesmos

[0119]



como descrito nos documentos WO-A-2008/131861 e WO-A-2008/131860,

em que

R_H^1 representa um radical (C_1-C_6) -haloalquila e

R_H^2 representa hidrogênio ou halogênio e

R_H^3 , R_H^4 independentemente um do outro representam hidrogênio, (C_1-C_{16}) -alquila, (C_2-C_{16}) -alquenila ou (C_2-C_{16}) -alquinila,

em que cada um dos 3 últimos radicais mencionados é não substituído ou substituído por um ou mais radicais do grupo de halogênio, hidroxila, ciano, (C_1-C_4) -alcóxi, (C_1-C_4) -haloalcóxi, (C_1-C_4) -alquiltio, (C_1-C_4) -alquilamino, di $[(C_1-C_4)$ -alquil]amino, $[(C_1-C_4)$ -alcoxi]carbonila, $[(C_1-C_4)$ -haloalcoxi]carbonila, (C_3-C_6) -cicloalquila que é não substituído ou substituído, fenila que é não substituída ou substituída, e heterociclila que é não substituída ou substituída,

ou (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_4-C_6) -cicloalquenila, (C_3-C_6) -cicloalquila fusionada em um lado do anel a um anel carbocíclico de 4 a 6 membros saturado ou insaturado, ou (C_4-C_6) -cicloalquenila fusionada em um lado do anel a um anel carbocíclico de 4 a 6 membros saturado ou insaturado, em que cada um dos 4 últimos radicais mencionados é não substituído ou substituído por um ou mais radicais do grupo que consiste em halogênio, hidroxila, ciano, (C_1-C_4) alquila, (C_1-C_4) haloalquila, (C_1-C_4) alcóxi, $(C_1-$

C₄)haloalcóxi, (C₁-C₄)alquiltio, (C₁-C₄)alquilamino, di[(C₁-C₄)alquil]amino, [(C₁-C₄)alcoxi]carbonila, [(C₁-C₄)haloalcoxi]carbonila, (C₃-C₆)cicloalquila que é não substituída ou substituída, fenila que é não substituída ou substituída, e heterociclila que é não substituída ou substituída,

ou

R_H³ representa (C₁-C₄)-alcóxi, (C₂-C₄)-alquenilóxi, (C₂-C₆)-alquiniloxi ou (C₂-C₄)-haloalcóxi e

R_H⁴ representa hidrogênio ou (C₁-C₄)-alquila ou

R_H³ e R_H⁴ juntamente com o átomo de nitrogênio diretamente fixo representam um anel heterocíclico de quatro a oito membros que, assim como o átomo de nitrogênio, também pode conter adicionalmente heteroátomos de anel, de preferência, até dois heteroátomos de anel adicionais do grupo de N, O e S, e que é não substituído ou substituído por um ou mais radicais do grupo de halogênio, ciano, nitro, (C₁-C₄)alquila, (C₁-C₄)haloalquila, (C₁-C₄)alcóxi, (C₁-C₄)haloalcóxi e (C₁-C₄)alquiltio.

S16) Compostos ativos que são usados principalmente como herbicidas, mas também têm ação de fitoprotetor em plantas de cultura, por exemplo,

[0120]

ácido (2,4-diclorofenoxi)acético (2,4-D),

ácido (4-clorofenoxi)acético,

ácido (R,S)-2-(4-cloro-o-toliloxi)propiónico (mecoprop),

ácido 4-(2,4-diclorofenoxi)butírico (2,4-DB),

ácido (4-cloro-o-toliloxi)acético (MCPA),

ácido 4-(4-cloro-o-toliloxi)butírico,

ácido 4-(4-clorofenoxi)butírico,

ácido 3,6-dicloro-2-metoxibenzoico (dicamba),
3,6-dicloro-2-metoxibenzoato de 1-(etoxicarbonil)etila
(lactidiclor-etila).

[0121] Fitoprotetores particularmente preferenciais são mefenpir-dietila, ciprosulfamida, isoxadifen-etila, cloquintocet-mexila, benoxacor e diclormida.

[0122] Os pós molháveis são preparações que podem ser dispersas uniformemente em água e, além do composto ativo, além de um diluente ou substância inerte, também incluem agentes tensoativos do tipo iônico e/ou não iônico (agentes umectantes, dispersantes), por exemplo, alquilfenóis polioxietilados, álcoois graxos polioxietilados, aminas graxas polioxietiladas, sulfatos de éter de poliglicol de álcool graxo, alcanossulfonatos, alquilbenzenossulfonatos, lignossulfonato de sódio, 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-dissulfonato de sódio, dibutilnaftalenossulfonato de sódio ou, então, oleilmetiltaurato de sódio. Para produzir os pós molháveis, os compostos herbicidas ativos são finamente triturados, por exemplo, em aparelhos usuais como moinhos de martelos, moinhos de soprador e moinhos a jato de ar e, simultaneamente ou subsequentemente, misturados com os auxiliares de formulação.

[0123] Os concentrados emulsionáveis são produzidos por dissolução do composto ativo em um solvente orgânico, por exemplo, butanol, ciclo-hexanona, dimetilformamida, xileno, ou ainda compostos aromáticos ou hidrocarbonetos de ponto de ebulição relativamente elevado, ou misturas dos solventes orgânicos, com adição de um ou mais tensoativos iônicos e/ou não iônicos (emulsificantes). Os

exemplos de emulsificantes que podem ser usados são: alquilarilsulfonatos de cálcio, como dodecilbenzenossulfonato de cálcio ou emulsificantes não iônicos, como ésteres de poliglicol de ácidos graxos, éteres de alquilaril poliglicol, éteres de poliglicol de álcool graxo, produtos de condensação de óxido de propileno e óxido de etileno, poliéteres de alquila, ésteres de sorbitano, por exemplo, ésteres de ácidos graxos de sorbitano, ou ésteres de polioxietileno sorbitano, por exemplo, ésteres de ácidos graxos de polioxietileno sorbitano.

[0124] Os produtos de pulverização são obtidos através da trituração do composto ativo com sólidos finamente distribuídos, por exemplo, talco, argilas naturais, como caulim, bentonita e pirofilita ou terra de diatomáceas.

[0125] Os concentrados de suspensão podem ser à base de água ou de óleo. Eles podem ser preparados, por exemplo, por moagem por via úmida por meio de moinhos de esferas comerciais e adição opcional de tensoativos, como já foi listado acima para os outros tipos de formulação.

[0126] As emulsões, por exemplo, emulsões de óleo-em-água (EW) podem ser produzidas, por exemplo, por meio de agitadores, moinhos coloidais e/ou misturadores estáticos usando solventes orgânicos aquosos e opcionalmente tensoativos como já mencionados acima, por exemplo, para os outros tipos de formulação.

[0127] Os grânulos podem ser produzidos por aspersão do composto ativo em material inerte granular adsorativo ou pela aplicação de concentrados de compostos ativos na superfície de veículos, como areia, caulinitas ou material

inerte granular, por meio de adesivos, por exemplo, álcool polivinílico, poliacrilato de sódio ou outros óleos minerais. Os compostos ativos adequados também podem ser granulados do modo habitual para a produção de grânulos de fertilizantes - se desejado como uma mistura com fertilizantes.

[0128] Os grânulos dispersáveis em água são produzidos geralmente pelos processos habituais, como secagem por aspersão, granulação em leito fluidizado, granulação em prato, mistura com misturadores de alta velocidade e extrusão sem material inerte sólido.

[0129] Para a produção de grânulos em prato, em leito fluidizado, por extrusão e aspersão, vide, por exemplo, processos em "Spray-Drying Handbook", 3ª Ed. 1979, G. Goodwin Ltd., Londres, Reino Unido, J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, páginas 147 ff.; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5ª Ed., McGraw - Hill, Nova York 1973, páginas 8-57.

[0130] Para detalhes adicionais relacionados à formulação de composições de proteção de cultura, consulte, por exemplo, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley e Sons, Inc., Nova York, 1961, páginas 81-96 e J.D. Freier, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5ª edição, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

[0131] As preparações agroquímicas contêm geralmente 0,1 a 99 % em peso, especialmente 0,1 a 95 % em peso, de compostos da invenção. Em pós molháveis, a concentração do composto ativo é, por exemplo, cerca de 10 % a 90 % em peso, o restante até 100 % em peso, que consiste em

constituintes de formulação habituais. Em concentrados emulsificantes, a concentração de composto ativo pode ser de cerca de 1 % a 90 % e, de preferência, 5 % a 80 % em peso. As formulações na forma de poeiras compreendem 1 % a 30 % em peso de composto ativo, de preferência, usualmente 5 % a 20 % em peso de composto ativo; soluções pulverizáveis contêm cerca de 0,05 % a 80 % em peso, de preferência, 2 % a 50 % em peso de composto ativo. No caso de grânulos dispersíveis em água, o teor de composto ativo depende parcialmente se o composto ativo está presente na forma líquida ou sólida e em quais auxiliares de granulação, enchimentos, etc., são usados. Nos grânulos dispersíveis em água, o teor de composto ativo está, por exemplo, entre 1 % e 95 % em peso, de preferência, entre 10 % e 80 % em peso.

[0132] Além disso, as formulações de compostos ativos mencionadas compreendem opcionalmente os respectivos habituais adesivos, umectantes, dispersantes, emulsificantes, penetrantes, conservantes, agentes anticongelantes e solventes, enchimentos, carreadores e corantes, antiespumantes, inibidores de evaporação e agentes que influenciam o pH e a viscosidade.

[0133] Com base nessas formulações, também é possível produzir combinações com outras substâncias pesticidamente ativas, por exemplo, inseticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas e também com fitoprotetores, fertilizantes e/ou reguladores do crescimento, por exemplo, na forma de uma formulação pronta ou como uma mistura em tanque.

[0134] Para aplicação, as formulações na forma comercial são, se apropriado, diluídas de uma maneira habitual, por

exemplo, no caso de pós molháveis, concentrados emulsionáveis, dispersões e grânulos dispersáveis em água, com água. As preparações do tipo poeira, grânulos para aplicação no solo ou grânulos para dispersão e soluções aspersíveis não são normalmente diluídas adicionalmente com outras substâncias inertes antes da aplicação.

[0135] A taxa de aplicação necessária dos compostos da fórmula (I) varia com as condições externas, incluindo, entre outros, temperatura, umidade e o tipo de herbicida usado. Pode variar dentro de amplos limites, por exemplo, entre 0,001 e 1,0 kg/ha ou mais de substância ativa, mas está de preferência entre 0,005 e 750 g/ha.

[0136] Um carreador é uma substância natural ou sintética, orgânica ou inorgânica com a qual os compostos ativos são misturados ou combinados para melhor aplicabilidade, em particular, para aplicação em plantas ou partes de planta ou semente. O carreador, que pode ser sólido ou líquido, geralmente é inerte e deve ser adequado para uso na agricultura.

[0137] Os carreadores sólidos ou líquidos incluem: por exemplo, sais de amônio e poeiras de rochas naturais, como caulins, argilas, talco, giz, quartzo, atapulgita, montmorilonita ou terras diatomáceas, e poeiras de rochas sintéticas, como sílica finamente dividida, alumina e silicatos naturais ou sintéticos, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, água, álcoois, especialmente butanol, solventes orgânicos, óleos minerais e vegetais e derivados destes. Também é possível usar misturas de tais carreadores. Os carreadores úteis para grânulos incluem: por exemplo, rochas naturais fracionadas e esmagadas como

calcita, mármore, pedra-pomes, sepiolita, dolomita, e também grânulos sintéticos de farinhas inorgânicas e orgânicas, e grânulos de material orgânico como serragem, cascas de coco, espigas de milho e caules de tabaco.

[0138] Os extensores ou carreadores gasosos liquefeitos adequados são líquidos que são gasosos à temperatura padrão e sob pressão atmosférica, por exemplo, propelentes em aerossol como hidrocarbonetos halogenados, ou também butano, propano, nitrogênio e dióxido de carbono.

[0139] Nas formulações é possível usar acentuadores de pegajosidade como carboximetilcelulose, polímeros naturais e sintéticos na forma de pós, grânulos ou látices, como goma arábica, álcool polivinílico e acetato de polivinila, ou então fosfolipídios naturais, como cefalinas e lecitinas e fosfolipídios sintéticos. Aditivos adicionais podem ser óleos minerais e vegetais.

[0140] Quando o extensor usado for água, também será possível usar, por exemplo, solventes orgânicos como solventes auxiliares. Os solventes líquidos adequados são essencialmente: aromáticos como xileno, tolueno ou alquilnaftalenos, hidrocarbonetos alifáticos clorados e aromáticos clorados como clorobenzenos, cloroetilenos ou diclorometileno, hidrocarbonetos alifáticos como ciclo-hexano ou parafinas, por exemplo, frações de óleo mineral, óleos vegetais e minerais, álcoois como butanol ou glicol e seus éteres e ésteres, cetonas como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona ou ciclo-hexanona, solventes fortemente polares como dimetilformamida e sulfóxido de dimetila e, também, água.

[0141] As composições de acordo com a invenção

compreendem adicionalmente componentes adicionais, como, por exemplo, tensoativos. Tensoativos úteis são emulsionantes e/ou espumantes, dispersantes ou agentes molhantes que têm propriedades iônicas ou não iônicas, ou misturas desses tensoativos. Os exemplos desses são sais de ácido poliacrílico, sais de ácido lignossulfônico, sais de ácido fenolsulfônico ou ácido naftalenossulfônico, policondensados de óxido de etileno com álcoois graxos ou com ácidos graxos ou com aminas graxas, fenóis substituídos (de preferência, alquilfenóis ou arilfenóis), sais de ésteres sulfossuccínicos, derivados de taurina (de preferência, tauratos de alquila), ésteres fosfóricos de álcoois ou fenóis de polietoxilados, ésteres de ácido graxo de polióis, e derivados dos compostos que contêm sulfatos, sulfonatos e fosfatos, por exemplo, alquilaril poliglicol éteres, sulfonatos de alquila, sulfatos de alquila, sulfonatos de arila, hidrolisados de proteína, licores de refugo de lignossulfito e metilcelulose. A presença de um tensoativo será necessária se um dos compostos ativos e/ou um dos carreadores inertes for insolúvel em água e quando a aplicação for efetuada em água. A proporção de tensoativos está entre 5 e 40 por cento em peso da composição inventiva. É possível usar corantes como pigmentos inorgânicos, por exemplo, óxido de ferro, óxido de titânio e azul da Prússia, e corantes orgânicos como corantes de alizarina, corantes azo e corantes à base de ftalocianina metálica, e oligonutrientes como sais de ferro, manganês, boro, cobre, cobalto, molibdênio e zinco.

[0142] Se for apropriado, também é possível que outros

componentes adicionais estejam presentes, por exemplo, coloides protetores, aglutinantes, adesivos, espessantes, substâncias tixotrópicas, agentes de penetração, estabilizantes, sequestrantes, agentes complexantes. Em geral, os compostos ativos podem ser combinados com qualquer aditivo sólido ou líquido comumente usado para fins de formulação. Em geral, as composições e formulações de acordo com a invenção contêm entre 0,05 e 99 % em peso, 0,01 e 98 % em peso, de preferência, entre 0,1 e 95 % em peso e com mais preferência, entre 0,5 e 90 % de composto ativo, com máxima preferência, entre 10 e 70 por cento em peso. Os compostos ativos ou composições de acordo com a invenção podem ser usados como tal ou, dependendo de suas propriedades físicas e/ou químicas respectivas, na forma de suas formulações ou formas de uso preparadas a partir das mesmas, como aerossóis, suspensões em cápsula, concentrados de nebulização a frio, concentrados de nebulização a quente, grânulos encapsulados, grânulos finos, concentrados fluxíveis para o tratamento de semente, soluções prontas para uso, pós polvilháveis, concentrados emulsificáveis, emulsões de óleo em água, emulsões de água em óleo, macrogrânulos, microgrânulos, pós dispersíveis em óleo, concentrados fluxíveis miscíveis em óleo, líquidos miscíveis em óleo, espumas, pastas, semente revestida com pesticida, concentrados de suspensão, concentrados solúveis, suspensões, pós molháveis, pós solúveis, poeiras e grânulos, grânulos ou tablets solúveis em água, pós solúveis em água e dispersíveis em água para o tratamento de semente, pós molháveis, produtos naturais e substâncias sintéticas

impregnadas com composto ativo, e também microencapsulações em substâncias poliméricas e em materiais de revestimento para semente, e também formulações de nebulização a quente e de nebulização a frio de ULV.

[0143] As formulações mencionadas podem ser produzidas de uma maneira conhecida por si, por exemplo, ao misturar os compostos ativos com pelo menos um extensor comum, solvente ou diluente, emulsificante, dispersante e/ou aglutinante ou agente fixador, agente umectante, repelente de água, opcionalmente secantes e estabilizadores de UV e, opcionalmente corantes e pigmentos, antiespumantes, conservantes, espessantes secundários, agentes de pegajosidade, giberelinas e outros auxiliares de processamento.

[0144] As composições de acordo com a invenção incluem não apenas formulações que já estão prontas para uso e podem ser dispostas com um aparelho adequado na planta ou a semente, mas também concentrados comerciais que têm que ser diluídos com água antes do uso.

[0145] Os compostos ativos, de acordo com a invenção, podem estar presentes como tais ou em suas formulações (padrão comercial), ou, além disso, nas formas de uso preparadas a partir dessas formulações como uma mistura com outros compostos ativos (conhecidos), como inseticidas, agentes atrativos, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, reguladores de crescimento, herbicidas, fertilizantes, agentes fitoprotetores ou semioquímicos.

[0146] O tratamento de acordo com a invenção das plantas

e partes de planta com os compostos ativos ou composições é realizado diretamente ou por ação de seus arredores, habitat ou espaço de armazenamento com o uso de métodos de tratamento comuns, por exemplo, por imersão, aspersão, atomização, irrigação, evaporação, pulverização, vaporização, difusão, formação de espuma, pintura, espalhamento, alimentação com água (demolhagem), irrigação por gotejamento e, no caso de material de propagação, em particular, no caso de sementes, adicionalmente como um pó para tratamento de semente a seco, uma solução para tratamento de semente, um pó solúvel em água para tratamento de pasta fluida, por incrustação, por revestimento com um ou mais revestimentos, etc. É possível, além disso, aplicar os compostos ativos pelo método de volume ultrabaixo ou injetar a preparação de composto ativo ou do próprio composto ativo no solo.

[0147] Uma das vantagens da presente invenção é que as propriedades sistêmicas específicas dos ingredientes ativos e composições inventivos significam que o tratamento da semente com esses ingredientes ativos e composições não apenas protege a própria semente, como também as plantas resultantes após emergência, contra fungos fitopatogênicos. Dessa maneira, o tratamento imediato da cultura no tempo de semeadura ou logo depois pode ser abolido.

[0148] É igualmente considerado vantajoso que os ingredientes ativos ou composições inventivos também possam ser especialmente usados para semente transgênica, em cujo caso a planta que cresce a partir dessa semente é capaz de expressar uma proteína que age contra pragas. O

tratamento de tal semente com os ingredientes ativos ou composições inventivos, meramente através da expressão da proteína, por exemplo, uma proteína inseticida, pode resultar no controle de determinadas pragas. Surpreendentemente, pode ser observado nesse caso um efeito sinérgico adicional, que aumenta adicionalmente a eficácia para a proteção contra ataques por pragas.

[0149] As composições de acordo com a invenção são adequadas para proteção de semente de qualquer variedade de planta que é usada na agricultura, na estufa, em florestas ou em horticultura e viticultura. Em particular, essa é a semente de cereais (como trigo, cevada, centeio, triticales, sorgo/painço e aveias), milho, algodão, soja, arroz, batatas, girassol, feijão, café, beterraba (por exemplo, beterraba sacarina e beterraba forrageira), amendoim, colza oleaginosa, papoula, azeitona, coco, cacau, cana-de-açúcar, tabaco, vegetais (como tomate, pepinos, cebolas e alface), relva e plantas ornamentais (vide abaixo também). O tratamento da semente de cereais (como trigo, cevada, centeio, triticales e aveias), milho e arroz é de importância específica.

[0150] Conforme também descrito abaixo, o tratamento de semente transgênica com os compostos ativos da presente invenção ou composições é de significância particular. Isso se refere à semente de plantas que contêm pelo menos um gene heterólogo que permite a expressão de um polipeptídeo ou proteína que tem propriedades inseticidas. Esse gene heterólogo em semente transgênica pode se originar, por exemplo, de microrganismos das espécies de *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*,

Clavibacter, Glomus ou Gliocladium. Esse gene heterólogo se origina, de preferência, de Bacillus sp., nesse caso o produto de gene é eficaz contra a broca europeia do milho e/ou o verme da raiz do milho ocidental. O gene heterólogo se origina, com mais preferência, de Bacillus thuringiensis.

[0151] No contexto da presente invenção, a composição inventiva é aplicada à semente por si só ou em uma formulação adequada. De preferência, a semente é tratada em um estado em que está suficientemente estável para que nenhum dano ocorra ao longo do tratamento. Em geral, a semente pode ser tratada em qualquer momento entre colheita e semeadura. É habitual usar a semente que foi separada da planta e livre de espigas, cascas, caules, revestimentos, pelos ou a polpa dos frutos. Por exemplo, é possível usar a semente que foi colhida, limpa e seca até um teor de umidade menor que 15 % em peso. Alternativamente, também é possível usar a semente que, após a secagem, por exemplo, foi tratada com água e, então, seca novamente.

[0152] Em geral, quando se trata a semente, deve-se garantir que a quantidade da composição de acordo com a invenção e/ou aditivos adicionais aplicados à semente seja escolhida de tal modo que a germinação da semente não seja prejudicada e a planta proveniente da mesma não seja danificada. Isso deve ser garantido particularmente no caso de compostos ativos que podem exibir efeitos fitotóxicos a certas taxas de aplicação.

[0153] As composições de acordo com a invenção podem ser aplicadas diretamente, isto é, sem conter quaisquer outros

componentes e sem terem sido diluídas. Em geral, é preferencial aplicar as composições à semente na forma de uma formulação adequada. Formulações e métodos adequados para tratamento de semente são conhecidos àqueles versados na técnica e são descritos, por exemplo, nos seguintes documentos: US 4.272.417 A, US 4.245.432 A, US 4.808.430, US 5.876.739, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

[0154] Os compostos ativos que podem ser usados de acordo com a invenção podem convertidos nas formulações para peliculização de semente comuns, tais como soluções, emulsões, suspensões, pó, espumas, pastas fluidas ou outras composições de revestimento para sementes e também formulações de ULV.

[0155] Essas formulações são produzidas de uma maneira conhecida, ao misturar os compostos ativos com aditivos comuns, por exemplo, extensores e solventes ou diluentes comuns, corantes, agentes umectantes, dispersantes, emulsificantes, antiespumas, conservantes, espessantes secundários, adesivos, giberelinas, e também água.

[0156] Os corantes que podem estar presentes nas formulações de peliculização de semente utilizáveis de acordo com a invenção são todos corantes que são comuns para tais propósitos. É possível usar pigmentos, que são parcimoniosamente solúveis em água, ou corantes, que são solúveis em água. Os exemplos incluem os corantes conhecidos pelos nomes Rhodamina B, C.I. Pigment Red 112 e C.I. Solvent Red 1.

[0157] Os agentes umectantes utilizáveis que podem estar presentes nas formulações de peliculização de semente

utilizáveis de acordo com a invenção são todas substâncias que promovem umedecimento e que são comuns para a formulação de compostos agroquimicamente ativos. Os naftalenossulonatos de alquila, como naftalenossulonatos de di-isopropila ou di-isobutila, podem ser usados com preferência.

[0158] Os dispersantes e/ou emulsificantes adequados que podem estar presentes nas formulações de peliculização de semente úteis de acordo com a invenção são, todos, dispersantes não iônicos, aniônicos e catiônicos comuns para a formulação de compostos agroquimicamente ativos. É dada preferência ao uso de dispersantes não iônicos ou aniônicos ou misturas de dispersantes não iônicos ou aniônicos. Os dispersantes não iônicos adequados incluem especialmente polímeros em bloco de óxido de etileno-óxido de propileno, alquilfenol poliglicol éteres e tristirilfenol poliglicol éter e os derivados fosfatados ou sulfatados dos mesmos. Os dispersantes aniônicos adequados são especialmente lignossulfonatos, sais de ácido poliacrílico e condensados de arilssulfonato-formaldeído.

[0159] Antiespumantes que podem estar presentes nas formulações de peliculização de semente utilizáveis de acordo com a invenção são todas as substâncias inibitórias de espuma comuns para a formulação de compostos agroquimicamente ativos. Os antiespumantes de silicone e estearato de magnésio podem ser usados com preferência.

[0160] Os conservantes que podem estar presentes nas formulações de peliculização de semente utilizáveis de acordo com a invenção são todas as substâncias utilizáveis

para tais propósitos em composições agroquímicas. Os exemplos incluem diclorofeno e álcool benzílico hemiformal.

[0161] Os espessantes secundários que podem estar presentes nas formulações de peliculização de semente utilizáveis de acordo com a invenção são todas as substâncias utilizáveis para tais propósitos em composições agroquímicas. Os exemplos preferidos incluem derivados de celulose, derivados de ácido acrílico, xantana, argilas modificadas e sílica finamente dividida.

[0162] Os adesivos utilizáveis que podem estar presentes nas formulações de peliculização de semente utilizáveis de acordo com a invenção são todos os ligantes comuns utilizáveis em produtos de peliculização de semente. Os exemplos preferidos incluem polivinilpirrolidona, acetato de polivinila, álcool polivinílico e tilose.

[0163] As formulações de peliculização de semente usáveis de acordo com a invenção podem ser usadas, seja diretamente ou após terem sido anteriormente diluídas com água, para o tratamento de uma ampla gama de sementes diferentes, incluindo a semente de plantas transgênicas. Nesse caso, os efeitos sinérgicos adicionais também podem ocorrer em interação com as substâncias formadas por expressão.

[0164] Para o tratamento de semente com as de peliculização de semente utilizáveis de acordo com a invenção ou com as preparações preparadas a partir da mesma por meio de adição de água, o equipamento útil são todas as unidades de mistura utilizáveis para a peliculização de semente. Especificamente, o procedimento

de formação de semente deve colocar a semente em um misturador, adicionar a quantidade desejada particular de formulações de formação de semente, como ou após a diluição anterior com água, e misturar as mesmas até que a formulação seja distribuída de modo homogêneo na semente. Se for apropriado, isso é seguido por uma operação de secagem.

[0165] Os compostos ativos de acordo com a invenção, dada a boa compatibilidade de planta, toxicidade homeotérmica favorável e boa compatibilidade ambiental, são adequados para a proteção de plantas e órgãos de plantas, para aumentar os campos de colheita e para aprimorar a qualidade da cultura colhida. As mesmas podem, de preferência, ser usadas como agentes de proteção de cultura. Os mesmos são ativos contra espécies normalmente sensíveis e resistentes e também contra todos ou estágios de desenvolvimento específicos.

[0166] As plantas que podem ser tratadas de acordo com a invenção incluem as seguintes plantas de cultura: milho, soja, algodão, sementes oleaginosas de Brassica, como Brassica napus (por exemplo, canola), Brassica rapa, B. Juncea (por exemplo, mostarda (campo)) e Brassica carinata, arroz, trigo, beterraba sacarina, cana-de-açúcar, aveias, centeio, cevada, painço e sorgo, triticales, linho, uvas e várias frutas e vegetais de vários táxons botânicos, por exemplo, Rosaceae sp. (por exemplo, pomóideas, como maçãs e peras, mas também frutas com caroço, como damascos, cerejas, amêndoas e pêssegos, e frutas de baga, como morangos), Ribesioideae sp., Juglandaceae sp., Betulaceae sp., Anacardiaceae sp.,

Fagaceae sp., Moraceae sp., Oleaceae sp., Actinidaceae sp., Lauraceae sp., Musaceae sp. (por exemplo, bananeiras e plantações de banana), Rubiaceae sp. (por exemplo, café), Theaceae sp., Sterculiaceae sp., Rutaceae sp. (por exemplo, limões, laranjas e toranja); Solanaceae sp. (por exemplo, tomates, batatas, pimentões, beringelas), Liliaceae sp., Compositae sp. (por exemplo, alface, alcachofras e chicória - incluindo raiz de chicória, endívia ou chicória comum)), Umbelliferae sp. (por exemplo, cenouras, salsa, aipo e aipo-rábano), Cucurbitaceae sp. (por exemplo, pepino-picles, pepinos, melancias, cabaças e melões), Alliaceae sp. (por exemplo, alhos-poró e cebolas), Cruciferae sp. (por exemplo, repolho branco, repolho roxo, brócolis, couve-flor, couve-de-Bruxelas, pak choi, couve-rábano, rabanetes, raiz-forte, agrião e repolho chinês), Leguminosae sp. (por exemplo, amendoins, ervilhas e feijões - por exemplo, feijões comuns e favas), Chenopodiaceae sp. (por exemplo, acelga, beterraba forrageira, espinafre, beterraba), Malvaceae (por exemplo, quiabo), Asparagaceae (por exemplo, aspargo); plantas úteis e plantas ornamentais no jardim e madeiras; e, em cada caso, tipos geneticamente modificados dessas plantas.

[0167] Conforme mencionado acima, é possível tratar todas as plantas e suas partes de acordo com a invenção. Em uma modalidade preferencial, as espécies de planta selvagem e cultivares de planta, ou aqueles obtidos através de métodos de melhoramento biológico convencionais, como cruzamento ou fusão protoplástica, e partes dos mesmos, são tratadas. Em uma modalidade

preferida adicional, são tratadas plantas transgênicas e cultivares de planta obtidos por métodos de engenharia genética, se for apropriado, em combinação com métodos convencionais (organismos geneticamente modificados), e partes das mesmas. O termo "partes" ou "partes de plantas" foi explicado acima. É dada preferência particular de acordo com a invenção ao tratamento de plantas dos respectivos cultivares de planta comercialmente costumeiros ou os que estão em uso. Os cultivares de planta são entendidos como plantas com novas propriedades ("traços") que cresceram por reprodução convencional, por mutagênese ou por técnicas de DNA recombinante. Os mesmos podem ser cultivares, variedades, biotipos ou genótipos.

[0168] O método de tratamento de acordo com a invenção pode ser usado para o tratamento de organismos geneticamente modificados (GMOs), por exemplo, plantas ou sementes. As plantas geneticamente modificadas (ou plantas transgênicas) são plantas em que um gene heterólogo foi estavelmente integrado no genoma. O termo "gene heterólogo" significa essencialmente um gene que é fornecido ou montado fora de uma planta e que, mediante introdução no genoma nuclear, o genoma de cloroplasto ou o genoma mitocondrial, confere à planta transformada traços inovadores ou agronômicos aprimorados ou outro traços devido ao fato de que expressa uma proteína ou polipeptídeo de interesse ou um outro gene que está presente na planta, ou outros genes que estão presentes são regulados descendentemente ou desativados (por exemplo, por meio de tecnologia antissenso, tecnologias de cossupressão ou tecnologias de RNAi [interferência de

RNA]). Um gene heterólogo que está localizado no genoma também é denominado como um transgene. Um transgene que é definido por sua presença específica no genoma de planta é chamado de transformação ou evento transgênico.

[0169] Dependendo da espécie da planta ou dos cultivares da planta, de suas condições de localização e crescimento (solos, clima, período da vegetação, dieta), o tratamento inventivo também pode resultar em efeitos superaditivos ("sinérgicos"). Por exemplo, os seguintes efeitos que excedem os efeitos de fato esperados são possíveis: taxas de aplicação reduzida e/ou espectro ampliado de atividade e/ou eficácia aumentada dos ingredientes ativos e composições que podem ser usados de acordo com a invenção, melhor crescimento vegetal, tolerância aumentada para temperaturas altas ou baixas, tolerância aumentada para seca ou para salinidade da água ou do solo, desempenho de florescimento aumentado, colheita mais fácil, maturação acelerada, campos de colheita maiores, frutas maiores, altura de planta maior, cor de folha mais verde, florescimento mais fácil, qualidade superior e/ou um valor nutricional maior dos produtos colhidos, concentração de açúcar maior nas frutas, melhor estabilidade em armazenamento e/ou processabilidade dos produtos colhidos.

[0170] Em determinadas taxas de aplicação, as combinações de ingrediente ativo inventivas também podem ter um efeito fortificante nas plantas. Consequentemente, as mesmas são adequadas para mobilizar o sistema defensivo da planta contra o ataque por fungos fitopatogênicos e/ou microrganismos e/ou vírus indesejados. Essa pode ser, possivelmente, uma das razões para a atividade

intensificada das combinações inventivas, por exemplo, contra fungos. As substâncias de fortificação de planta (que induzem resistência) devem ser compreendidas para significar, no presente contexto, também aquelas substâncias ou combinações de substâncias que têm capacidade de estimular o sistema de defesa das plantas de tal modo que, quando substancialmente inoculadas com fungos fitopatogênicos indesejados, as plantas tratadas exibem um grau substancial de resistência a esses fungos fitopatogênicos indesejados. As substâncias inventivas podem, portanto, ser usadas para a proteção de plantas contra o ataque por patógenos mencionados dentro de um determinado período de tempo após o tratamento. O período dentro do qual a proteção é obtida geralmente se estende de 1 a 10 dias, de preferência, 1 a 7 dias, após o tratamento das plantas com os ingredientes ativos.

[0171] As plantas e cultivares de planta que são, de preferência, tratados de acordo com a invenção incluem todas as plantas que têm material genético que confere traços particularmente vantajosos úteis para essas plantas (se obtidas por melhoramento e/ou meios biotecnológicos).

[0172] As plantas e cultivares de planta que são igualmente, de preferência, tratados de acordo com a invenção são resistentes a um ou mais fatores de estresse biótico, o que significa que essas plantas têm uma melhor defesa contra pragas animal e microbianas, como nematódeos, insetos, ácaros, fungos fitopatogênicos, bactérias, vírus e/ou viroides.

[0173] Exemplos de plantas resistentes a nematódeo são descritas, por exemplo, nos seguintes pedidos de patente

US: 11/765.491, 11/765.494, 10/926.819, 10/782.020, 12/032.479, 10/783.417, 10/782.096, 11/657.964, 12/192.904, 11/396.808, 12/166.253, 12/166.239, 12/166.124, 12/166.209, 11/762.886, 12/364.335, 11/763.947, 12/252.453, 12/209.354, 12/491.396 e 12/497.221.

[0174] Plantas e cultivares de planta que também podem ser tratados de acordo com a invenção são aquelas plantas que são resistentes a um ou mais fatores de estresse abiótico. As condições de estresse abiótico podem incluir, por exemplo, seca, exposição à temperatura fria, exposição ao calor, estresse osmótico, inundação, salinidade de solo aumentada, exposição aumentada a minerais, exposição a ozônio, exposição a luz forte, disponibilidade limitada de nutrientes à base de nitrogênio, disponibilidade limitada de nutrientes fosforosos ou falta de sombra.

[0175] As plantas e variedades de planta que também pode ser tratados de acordo com a invenção são aquelas plantas caracterizadas por características de rendimento aumentado. A produtividade melhorada nas ditas plantas pode ser o resultado de, por exemplo, fisiologia de planta aprimorada, crescimento e desenvolvimento, como eficiência de uso de água, eficiência de retenção de água, uso de nitrogênio aprimorado, assimilação de carbono melhorada, fotossíntese aprimorada, eficiência de germinação aumentada e maturação acelerada. A produtividade pode ser adicionalmente afetada por arquitetura de planta aprimorada (sob condições de estresse e não estresse), incluindo, mas sem limitação a, florescimento precoce, controle de florescimento para produção de semente

híbrida, vigor de muda, tamanho de planta, número e distância entre nós, crescimento de raiz, tamanho de semente, tamanho de fruta, tamanho de vagem, número de espiga ou vagem, número de semente por vagem ou espiga, massa de semente, preenchimento de semente melhorado, dispersão de semente reduzida, deiscência de vagem reduzida e resistência a acamamento. Os traços de produtividade adicionais incluem composição de semente, como teor de carboidrato, teor de proteína, teor de óleo e composição de óleo, valor nutricional, redução em compostos antinutricionais, processabilidade aprimorada e melhor estabilidade em armazenamento.

[0176] As plantas que podem ser tratadas de acordo com a invenção são plantas híbridas que já expressam as características de heterose ou efeito híbrido, que resulta, geralmente, em maior rendimento, vigor, saúde melhor e resistência a fatores de estresse biótico e abiótico. Tais plantas são tipicamente produzidas através do cruzamento de uma linhagem parental estéril macho consanguínea (o genitor de cruzamento fêmea) com uma outra linhagem parental fértil macho consanguínea (o genitor de cruzamento macho). A semente híbrida é tipicamente colhida a partir das plantas estéreis machos e vendida para os cultivadores. As plantas macho estéreis podem ser, às vezes, (por exemplo, no milho) produzidas por despendoamento (isto é, a remoção mecânica dos órgãos reprodutores masculinos ou flores masculinas), mas, mais tipicamente, a esterilidade masculina é o resultado de determinantes genéticos no genoma da planta. Nesse caso, e especialmente quando a semente é o produto desejado a ser

colhido das plantas híbridas, é tipicamente benéfico assegurar que a fertilidade macho em plantas híbridas, que contêm os determinantes genéticos responsáveis pela esterilidade macho, seja completamente restaurada. Isso pode ser realizado ao assegurar que genitores de cruzamento tenham genes restauradores de fertilidade apropriados que têm capacidade de restaurar a fertilidade macho em plantas híbridas que contêm os determinantes genéticos responsáveis para esterilidade macho. Os determinantes genéticos para esterilidade de macho podem estar localizados no citoplasma. Exemplos de macho-esterilidade citoplasmática (CMS) foram descritos, por exemplo, para espécies de Brassica. No entanto, determinantes genéticos para esterilidade de macho também podem ser localizados no genoma nuclear. As plantas estéreis também podem ser obtidas por métodos de biotecnologia de planta como engenharia genética. Um meio particularmente útil de obter plantas estéreis machos é descrito no documento WO 89/10396 em que, por exemplo, uma ribonuclease como uma barnase é seletivamente expressada nas células de tapetum nos estames. A fertilidade pode ser, então, recuperada pela expressão nas células do tapete de um inibidor de ribonuclease, como barstar.

[0177] Plantas ou cultivares de planta (obtidos por métodos de biotecnologia vegetal, como engenharia genética) que podem ser tratados de acordo com a invenção são plantas tolerantes a herbicida, isto é, plantas tornadas tolerantes a um ou mais determinados herbicidas. Tais plantas podem ser obtidas por transformação genética, ou por seleção de plantas que contêm uma mutação que

confere tal tolerância a herbicida.

[0178] As plantas tolerantes a herbicida são, por exemplo, plantas tolerantes a glifosato, isto é, plantas tornadas tolerantes a herbicida glifosato ou sais do mesmo. Plantas podem ser tornadas tolerantes a glifosato através de vários métodos. Dessa forma, por exemplo, as plantas tolerantes a glifosato podem ser obtidas pela transformação da planta com um gene que codifica a enzima 5-enolpiruvilchiquimato-3-fosfato sintase (EPSPS). Exemplos de tais genes EPSPS são o gene AroA (CT7 mutante) da bactéria *Salmonella typhimurium* (Comai et al., 1983, *Science* 221, 370-371), o gene CP4 da bactéria *Agrobacterium* sp. (Barry et al., 1992, *Curr. Topics Plant Physiol.* 7, 139-145), os genes que codificam uma EPSPS de petúnia (Shah et al., 1986, *Science* 233, 478-481), uma EPSPS de tomate (Gasser et al., 1988, *J. Biol. Chem.* 263, 4280-4289) ou uma EPSPS de Eleusina (documento WO 01/66704). A mesma também pode ser uma EPSPS submetida a mutação. As plantas tolerantes a glifosato também podem ser obtidas pela expressão de um gene que codifica uma enzima glifosato oxidoredutase. As plantas tolerantes a glifosato também podem ser obtidas pela expressão de um gene que codifica uma enzima glifosato acetiltransferase. As plantas tolerantes a glifosato também podem ser obtidas selecionando-se plantas que contêm mutações de ocorrência natural dos genes mencionados acima. As plantas que expressam genes EPSPS que conferem tolerância a glifosato foram descritas. As plantas que expressam outros genes que conferem tolerância, por exemplo, genes de decarboxilase, foram descritas.

[0179] Outras plantas resistentes a herbicida são, por exemplo, plantas tornadas tolerantes a herbicidas que inibem a enzima glutamina sintase, como bialafós, fosfinotricina ou glufosinato. Tais plantas podem ser obtidas pela expressão de uma enzima que desintoxica o herbicida ou um mutante da enzima glutamina sintase que é resistente à inibição. Um exemplo de tal um enzima de desintoxicação eficaz é uma enzima que codifica uma fosfinotricina acetiltransferase (como a proteína bar ou pat da espécie *Streptomyces*). As plantas que expressam fosfofinotricina acetiltransferase exógena foram descritas.

[0180] Plantas tolerantes a herbicida adicionais são também plantas que foram tornadas tolerantes aos herbicidas que inibem a enzima hidroxifenilpiruvato dioxigenase (HPPD). As hidroxifenilpiruvato dioxigenases são enzimas que catalisam a reação em que para-hidroxifenilpiruvato (HPP) é convertido em homogentisato. Plantas tolerantes a inibidores de HPPD podem ser transformadas com um gene que codifica uma enzima HPPD resistente de ocorrência natural, ou um gene que codifica uma enzima HPPD mutada ou quimérica, como descrito nos documentos WO 96/38567, WO 99/24585, WO 99/24586, WO 2009/144079, WO 2002/046387 ou US 6.768.044. A tolerância a inibidores de HPPD também pode ser obtida pela transformação de plantas com genes que codificam certas enzimas que possibilitam a formação de homogentisato apesar da inibição da enzima HPPD nativa pelo inibidor de HPPD. Tais plantas são descritas nos documentos WO 99/34008 e WO 02/36787. A tolerância de plantas a

inibidores de HPPD também pode ser aprimorada pela transformação de plantas com um gene que codifica uma enzima prefenato desidrogenase além de um gene que codifica uma enzima tolerante a HPPD, como descrito no documento WO 2004/024928. Além disso, as plantas podem ser tornadas mais tolerantes a inibidores de HPPD inserindo-se no genoma das mesmas um gene que codifica uma enzima que metaboliza ou degrada inibidores de HPPD, por exemplo, enzimas CYP450 (vide documentos WO 2007/103567 e WO 2008/150473).

[0181] Outras plantas resistentes a herbicida são plantas que foram tornadas tolerantes a inibidores acetolactato sintase (ALS). Os inibidores de ALS conhecidos incluem, por exemplo, herbicidas sulfonilureia, imidazolinona, triazolopirimidinas, pirimidiniloxi(tio)benzoatos e/ou sulfonilaminocarboniltriazolinona. Sabe-se que diferentes mutações na enzima ALS (também conhecida como ácido aceto-hidróxi sintase, AHAS) conferem tolerância a diferentes herbicidas e grupos de herbicidas, como descrito, por exemplo, em Tranel e Wright (Weed Science 2002, 50, 700-712). A produção de plantas tolerantes à sulfonilureia e plantas tolerantes à imidazolinona foi descrita. Plantas tolerantes à sulfonilureia e imidazolinona adicionais também foram descritas.

[0182] Mais plantas tolerantes à imidazolinona e/ou sulfonilureia podem ser obtidas por mutagênese induzida, por seleção em culturas celulares na presença do herbicida por melhoramento de mutação (consulte, por exemplo, para soja no documento US 5.084.082, para arroz no documento

WO 97/41218, para beterraba sacarina no documento US 5.773.702 e WO 99/057965, para alface no documento US 5.198.599, ou para girassol no documento WO 01/065922).

[0183] Plantas ou variedades de planta (obtidas por meio de métodos de biotecnologia vegetal, como engenharia genética) que também podem ser tratadas de acordo com a invenção são plantas transgênicas resistentes a insetos, isto é, plantas tornadas resistentes ao ataque de certos insetos-alvo. Tais plantas podem ser obtidas por transformação genética ou por seleção de plantas que contêm uma mutação que confere tal resistência a insetos.

[0184] O termo "planta transgênica resistente a inseto", como usado no presente documento, inclui qualquer planta contendo pelo menos um transgene que compreende uma sequência de codificação que codifica:

1) uma proteína em cristal inseticida de *Bacillus thuringiensis* ou uma porção inseticida da mesma, como a proteína em cristal inseticidas compilada por Crickmore et al., *Microbiology and Molecular Biology Reviews* 1998, 62, 807-813, atualizada por Crickmore et al. (2005) na nomenclatura de toxina de *Bacillus thuringiensis* (online em:

http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/), ou porções inseticidas da mesma, por exemplo, proteínas das classes Cry de proteína Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1B, Cry1C, Cry1D, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Aa ou Cry3Bb ou porções inseticidas da mesma (por exemplo, documentos EP A 1999141 e WO 2007/107302), ou aquelas proteínas codificadas por genes sintéticos, como descrito no pedido de patente US 12/249.016; ou

- 2) uma proteína cristal de *Bacillus thuringiensis* ou uma porção da mesma que é inseticida na presença de uma segunda proteína cristal além da *Bacillus thuringiensis* ou uma porção da mesma, como a toxina binária composta pelas proteínas cristal Cy34 e Cy35 (Nat. Biotechnol. 2001, 19, 668-72; Applied Environm. Microbiol. 2006, 71, 1765-1774) ou a toxina binária composta pelas proteínas Cry1A ou Cry1F e pelas proteínas Cry2Aa ou Cry2Ab ou Cry2Ae (pedido de patente US 12/214.022 e EP08010791.5); ou
- 3) uma proteína inseticida híbrida que compreende partes de duas proteínas de cristal inseticidas de *Bacillus thuringiensis*, como um híbrido das proteínas de 1) acima ou um híbrido das proteínas de 2) acima, por exemplo, a proteína Cry1A.105 produzida por evento de milho MON98034 (documento WO 2007/027777); ou
- 4) uma proteína de qualquer uma dentre 1) a 3) acima, em que alguns, particularmente 1 a 10, aminoácidos foram substituídos por outro aminoácido para obter uma maior atividade inseticida a uma espécie de inseto-alvo, e/ou para expandir o alcance de espécies de inseto-alvo afetadas, e/ou devido a alterações introduzidas no DNA de codificação durante clonagem ou transformação, como a proteína Cry3Bb1 em eventos de milho MON863 ou MON88017, ou a proteína Cry3A no evento de milho MIR604; ou
- 5) uma proteína secretada inseticida de *Bacillus thuringiensis* ou *Bacillus cereus*, ou uma porção inseticida da mesma, como as proteínas inseticidas vegetativas (VIP) listadas em:
http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por exemplo, proteínas da classe de proteína

VIP3Aa; ou

6) uma proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* ou *Bacillus cereus* que é inseticida na presença de uma segunda proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* ou *B. cereus*, como a toxina binária constituída das proteínas VIP1A e VIP2A (documento WO 94/21795); ou

7) uma proteína inseticida híbrida que compreende partes de diferentes proteínas secretadas de *Bacillus thuringiensis* ou *Bacillus cereus*, como um híbrido das proteínas em 1) acima ou um híbrido das proteínas em 2) acima; ou

8) uma proteína de qualquer um dos pontos 5) a 7) acima em que alguns, particularmente 1 a 10, aminoácidos foram substituídos por um outro aminoácido para obter uma atividade inseticida superior para uma espécie de inseto-alvo, e/ou para expandir a faixa de espécies de inseto-alvo afetada, e/ou por causa de alterações induzidas na DNA de codificação durante a clonagem ou transformação (enquanto ainda codifica uma proteína inseticida), como a proteína VIP3Aa em evento de algodão COT 102; ou

9) uma proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* ou *Bacillus cereus* que é inseticida na presença de uma proteína cristal de *Bacillus thuringiensis*, como a toxina binária composta pelas proteínas VIP3 e Cry1A ou Cry1F (pedidos de patente US 61/126083 e 61/195019), ou a toxina binária composta pela proteína VIP3 e pelas proteínas Cry2Aa ou Cry2Ab ou Cry2Ae (pedido de patente US 12/214.022 e documento EP 08010791.5); ou

10) uma proteína de acordo com o ponto 9) acima, em que alguns, particularmente 1 a 10, aminoácidos foram

substituídos por outro aminoácido para obter uma maior atividade inseticida a uma espécie de inseto-alvo, e/ou para expandir o alcance de espécies de inseto-alvo afetadas, e/ou devido a alterações induzidas no DNA de codificação durante clonagem ou transformação (enquanto ainda codifica uma proteína inseticida).

[0185] Obviamente, as plantas transgênicas resistentes a inseto, como usado no presente documento, também incluem qualquer planta que compreende uma combinação de genes que codificam as proteínas de qualquer uma das classes mencionadas acima 1 a 10. Em uma modalidade, uma planta resistente a inseto contém mais que um transgene que codifica uma proteína de qualquer uma das classes acima 1 a 10, para expandir a faixa das espécies de inseto-alvo afetadas ou para atrasar o desenvolvimento de resistência a inseto para as plantas, através do uso de diferentes proteínas inseticidas para a mesma espécie de inseto-alvo, mas que tem um modo de ação diferente, como ligação para diferentes sítios de ligação de receptor no inseto.

[0186] No presente contexto, uma "planta transgênica resistente a inseto" inclui adicionalmente qualquer planta que contém pelo menos um transgene que compreende uma sequência para produção de RNA com filamento duplo que, após consumo de alimento por uma praga de inseto, impede o crescimento dessa praga.

[0187] As plantas ou os cultivares de planta (obtidos por métodos de biotecnologia de planta como engenharia genética) que também podem ser tratadas de acordo com a invenção são tolerantes a fatores de estresse abiótico. Tais plantas podem ser obtidas por transformação genética

ou por seleção de plantas que contêm uma mutação que confere tal resistência ao estresse. As plantas tolerantes a estresse particularmente úteis incluem as seguintes:

- a. plantas que contêm um transgene capaz de reduzir a expressão e/ou a atividade de gene da poli(ADP-ribose) polimerase (PARP) nas células vegetais ou plantas;
- b. plantas que contêm um transgene intensificador de tolerância a estresse capaz de reduzir a expressão e/ou a atividade da PARP que codifica genes das plantas ou células vegetais;
- c. plantas que contêm um transgene que intensifica a tolerância a estresse que codifica uma enzima funcional de planta da trajetória de biossíntese de recuperação de dinucleotídeo de nicotinamida-adenina, incluindo nicotinamidase, nicotinato fosforibosiltransferase, ácido nicotínico mononucleotídeo adeniltransferase, nicotinamida adenina dinucleotídeo sintetase ou nicotinamida fosforibosiltransferase.

[0188] As plantas ou os cultivares de planta (obtidos por métodos de biotecnologia de planta como engenharia genética) que também podem ser tratados de acordo com a invenção mostram quantidade, qualidade e/ou estabilidade de armazenamento alteradas do produto colhido e/ou propriedades alteradas de componentes específicos do produto colhido como, por exemplo:

- 1) Plantas transgênicas que sintetizam um amido modificado que, em suas características físico-químicas, em particular, o teor de amilose ou a razão amilose/amilopectina, o grau de ramificação, o comprimento de cadeia médio, a distribuição de cadeia lateral, o

comportamento de viscosidade, a intensidade de gelificação, o tamanho de grânulo de amido e/ou a morfologia de grânulo de amido, são alteradas em comparação com o amido sintetizado em células de planta do tipo selvagem ou plantas, de modo que seu teor modificado seja mais bem adequado para aplicações específicas.

2) As plantas transgênicas que sintetizam polímeros de carboidrato não amido ou que sintetizam polímeros de carboidrato não amido com propriedades alteradas em comparação com plantas do tipo selvagem sem modificação genética. Os exemplos são plantas que produzem polifrutose, especialmente do tipo de inulina e levano, plantas que produzem alfa-1,4-glucanos, plantas que produzem alfa-1,6-ramificados alfa-1,4-glucanos, e plantas que produzem alternano.

3) Plantas transgênicas que produzem hialuronano.

4) Plantas transgênicas ou plantas híbridas como cebolas com propriedades específicas, como "alto teor de sólidos solúveis", "baixa pungência" (LP) e/ou "armazenamento longo" (LS).

[0189] Plantas ou cultivares de planta (obtidos por métodos de biotecnologia de planta como engenharia genética) que também podem ser tratados de acordo com a invenção são plantas, como plantas de algodão, com características de fibra alteradas. Tais plantas podem ser obtidas por transformação genética, ou por seleção de plantas contendo uma mutação que confere tais características de fibra aumentadas e incluem:

a) plantas, como plantas de algodão, que contêm uma forma alterada de genes de celulose sintase;

- b) plantas, como plantas de algodão, que contêm uma forma alterada de ácidos nucleicos homólogos rsw2 ou rsw3, como plantas de algodão com uma expressão aumentada de sacarose fosfato sintase;
- c) plantas, como plantas de algodão, com expressão aumentada de sacarose sintase;
- d) plantas, como plantas de algodão, em que a temporização do acoplamento de plasmodesmo na base da célula de fibra é alterado, por exemplo, através de regulação descendente de β -1,3-glucanase seletiva de fibra;
- e) plantas, como plantas de algodão, que têm fibras com reatividade alterada, por exemplo, através da expressão do gene N-acetilglucosaminatransferase, incluindo nodC, e genes quitina sintase.

[0190] Plantas ou cultivares de planta (obtidos por meio de métodos de biotecnologia vegetal, como engenharia genética) que também podem ser tratados de acordo com a invenção são plantas, como colza oleaginosa ou plantas de Brassica relacionadas, com características alteradas de perfil oleaginoso. Tais plantas podem ser obtidas por transformação genética, ou por seleção de plantas contendo uma mutação que confere tais características de óleo alteradas e incluem:

- a) plantas, como plantas de semente oleaginosa de colza, que produzem óleo que tem um teor de ácido oleico alto;
- b) plantas, como plantas de semente oleaginosa de colza, que produzem óleo que tem um teor de ácido linolênico baixo;
- c) plantas, como plantas de colza oleaginosa, que produzem óleo que tem um baixo nível de ácidos graxos

saturados.

[0191] Plantas ou culturas de plantas (que podem ser obtidas por métodos biológicos vegetais, como modificação genética) que também pode ser tratadas de acordo com a invenção são plantas, como batatas que são resistentes a vírus, por exemplo, ao vírus Y da batata (eventos SY230 e SY233 de Tecnoplant, Argentina), ou que são resistentes a doenças, como míldio da batateira (por exemplo, gene RB), ou que exibe sabor doce induzido por frio reduzido (que possui os genes Nt-Inh, II-INV) ou que exibe o fenótipo de nanismo (gene A-20 oxidase).

[0192] Plantas ou cultivares de planta (obtidos por meio de métodos de biotecnologia vegetal, como engenharia genética) que também podem ser tratados de acordo com a invenção são plantas, como colza oleaginosa ou plantas de Brassica relacionadas, com características alteradas de despedaçamento da semente. Tais plantas podem ser obtidas por transformação genética ou por seleção de plantas que contêm uma mutação que confere tais características alteradas e incluem plantas como colza oleaginosa com despedaçamento de semente retardado ou reduzido.

[0193] Plantas transgênicas particularmente úteis que podem ser tratadas de acordo com a invenção são plantas com eventos de transformação ou combinações de eventos de transformação que são a matéria de concessão ou pendência de petições para estados não regulados nos EUA no Serviço de Inspeção de Saúde Vegetal (Animal and Plant Health Inspection Service - APHIS) do Departamento da Agricultura dos Estados Unidos (United States Department of Agriculture - USDA). Informações relacionadas a isso estão disponíveis

a qualquer momento na APHIS (4700 River Road Riverdale, MD 20737, EUA), por exemplo, por meio do site da web http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html. Na data de depósito deste pedido, as petições com as seguintes informações foram concedidas ou estão pendentes na APHIS:

- Petição: Número de identificação da petição. A descrição técnica do evento de transformação pode ser encontrada no documento de petição específico disponibilizada pela APHIS no site da web por meio do número de petição. Essas descrições são reveladas no presente documento a título de referência.
- Extensão de uma petição: Referência a uma petição anterior para a qual uma extensão do escopo ou termo é solicitada.
- Instituição: Nome da pessoa que enviou a petição.
- Artigo regulamentado: As espécies de planta em questão.
- Fenótipo transgênico: O traço conferido à planta pelo evento de transformação.
- Linhagem ou evento de transformação: O nome do evento (ou eventos) (às vezes também referido como linhagem (ou linhagens)) para o qual a situação não regulada está sendo solicitada.
- Documentos do APHIS: Diversos documentos que foram publicados por APHIS com relação à petição ou que podem ser obtidos da APHIS mediante solicitação.

[0194] As plantas transgênicas particularmente úteis que podem ser tratadas de acordo com a invenção são plantas que compreendem um ou mais genes que codificam uma ou mais toxinas são, por exemplo, as plantas transgênicas que são

comercializadas sob os seguintes nomes comerciais: YIELD GARD® (por exemplo, milho, algodão, soja), KnockOut® (por exemplo, milho), BiteGard® (por exemplo, milho), BT-Xtra® (por exemplo, milho), StarLink® (por exemplo, milho), Bollgard® (algodão), Nucotn® (algodão), Nucotn 33B® (algodão), NatureGard® (por exemplo, milho), Protecta® e NewLeaf® (batata). Os exemplos de plantas tolerantes a herbicida incluem variedades de milho, variedades de milho e variedades de feijão-soja que estão disponíveis sob os seguintes nomes comerciais: Roundup Ready® (tolerância a glifosatos, por exemplo, milho, algodão, soja), Liberty Link® (tolerância a fosfinotricina, por exemplo, semente oleaginosa de colza), IMI® (tolerância à imidazolinona) e SCS® (tolerância à sulfonilureia), por exemplo, milho. As plantas resistentes a herbicida (plantas reproduzidas de uma maneira convencional para tolerância a herbicida) que podem ser mencionadas incluem as variedades vendidas sob o nome Clearfield® (por exemplo, milho).

[0195] As plantas transgênicas particularmente úteis que podem ser tratadas de acordo com a invenção são plantas que contêm eventos de transformação, ou uma combinação de eventos de transformação, e que são listados, por exemplo, na base de dados de várias agências reguladoras regionais ou nacionais (consulte, por exemplo, http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx e http://cera-gmc.org/index.php?evidcode=&hstIDXCode=&gType=&AbbrCode=&atCode=&stCode=&coIDCode=&action=gm_crop_database&mode=Submit).

[0196] Os compostos ativos ou composições de acordo com

a invenção também podem ser usados na proteção de materiais, para a proteção de materiais industriais contra o ataque e a destruição por microrganismos indesejados, por exemplo, fungos ou insetos.

[0197] Além disso, os compostos de acordo com a invenção podem ser usados como composições anti-incrustação, em separado ou em combinações com outros compostos ativos.

[0198] Os materiais industriais no presente contexto são entendidos como materiais não vivos que foram preparados para uso na indústria. Por exemplo, os materiais industriais que devem ser protegidos pelos compostos ativos de acordo com a invenção contra alteração ou destruição microbiana podem ser adesivos, películas, papel, papel de parede e papelão, produtos têxteis, carpetes, couro, madeira, tintas e artigos plásticos, lubrificantes de resfriamento e outros materiais que podem ser infectados com ou distribuídos por microrganismos. A gama de materiais a serem protegidos também inclui partes de usinas de produção e edifícios, por exemplo, circuitos de água de resfriamento, sistemas de resfriamento e aquecimento, e ventilação e sistemas condicionadores de ar, que podem ser prejudicados pela proliferação de microrganismos. Materiais industriais dentro do escopo da presente invenção incluem, de preferência, adesivos, películas, papel e papelão, couro, madeira, tintas, lubrificantes de resfriamento e fluidos de transferência de calor, particularmente com mais preferência, madeira. Os compostos ativos ou composições de acordo com a invenção podem prevenir efeitos adversos, como podridão, decadência, descoloração, descolorização ou formação de

mofo. Além disso, os compostos de acordo com a invenção podem ser usados para a proteção de objetivo que entram em contato com água salgada ou água salobra, especialmente cascos, telas, redes, edificações, amarras e sistemas de sinalização, contra incrustação.

[0199] O método de acordo com a invenção para controlar fungos indesejados também pode ser empregado para proteger mercadorias armazenadas. No presente documento, os produtos de armazenamento devem ser compreendidos como substâncias naturais de origem vegetal ou animal ou produtos de processamento das mesmas de origem natural, para os quais a proteção a longo prazo é desejada. Os produtos de armazenamento de origem vegetal, por exemplo, plantas ou partes de plantas, como talos, folhas, tubérculos, sementes, frutos, grãos, podem ser protegidas colhidas frescas ou após o processamento por (pré)secagem, umedecimento, trituração, moagem, compressão ou torrefação. Os produtos de armazenamento também incluem madeira bruta, tanto não processada, como madeira bruta de construção, postes e barreiras de eletricidade, ou na forma de produtos finais, como móveis. As mercadorias armazenadas de origem animal são, por exemplo, peles, couro, pelos e cabelos. Os compostos ativos de acordo com a invenção podem prevenir efeitos adversos, como podridão, decadência, descoloração, descolorização ou formação de mofo.

[0200] Os exemplos não limitantes de patógenos de doenças fúngicas que podem ser tratadas de acordo com a invenção incluem: As doenças causadas por patógenos de míldio, como, por exemplo, espécies de *Blumeria*, como, por

exemplo, *Blumeria graminis*; espécies de *Podosphaera*, como, por exemplo, *Podosphaera leucotricha*; espécies de *Sphaerotheca*, como, por exemplo, *Sphaerotheca fuliginea*; espécies de *Uncinula*, como, por exemplo, *Uncinula necator*; doenças causadas por patógenos da doença de ferrugem, como, por exemplo, espécies de *Gymnosporangium*, como, por exemplo, *Gymnosporangium sabinae*; espécies de *Hemileia*, como, por exemplo, *Hemileia vastatrix*; espécies de *Phakopsora*, como, por exemplo, *Phakopsora pachyrhizi* e *Phakopsora meibomia*; espécies de *Puccinia*, como, por exemplo, *Puccinia recondita* ou *Puccinia trititica*; espécies de *Uromyces*, como, por exemplo, *Uromyces appendiculatus*; doenças causadas por patógenos do grupo dos Oomycetes, como, por exemplo, espécies de *Bremia*, como, por exemplo, *Bremia lactucae*; espécies de *Peronospora*, como, por exemplo, *Peronospora pisi* ou *P. brassicae*; espécies de *Phytophthora*, como, por exemplo, *Phytophthora infestans*; espécies de *Plasmopara*, como, por exemplo, *Plasmopara viticola*; espécies de *Pseudoperonospora*, como, por exemplo, *Pseudoperonospora humuli* ou *Pseudoperonospora cubensis*; espécies de *Pythium*, como, por exemplo, *Pythium ultimum*; doenças de mancha foliar e doenças de murcha foliar causadas, por exemplo, por espécies de *Alternaria*, como, por exemplo, *Alternaria solani*; espécies de *Cercospora*, como, por exemplo, *Cercospora beticola*; espécies de *Cladosporium*, como, por exemplo, *Cladosporium cucumerinum*; espécies de *Cochliobolus*, como, por exemplo, *Cochliobolus sativus* (forma conídica: *Drechslera*, sinônimo: *Helminthosporium*); espécies de *Colletotrichum*, por exemplo, *Colletotrichum*

lindemuthanium; espécies de *Cycloconium*, por exemplo, *Cycloconium oleaginum*; espécies de *Diaporthe*, por exemplo, *Diaporthe citri*; espécies de *Elsinoe*, por exemplo, *Elsinoe fawcettii*; espécies de *Gloeosporium*, por exemplo, *Gloeosporium laeticolor*; espécies de *Glomerella*, por exemplo, *Glomerella cingulata*; espécies de *Guignardia*, por exemplo, *Guignardia bidwelli*; espécies de *Leptosphaeria*, por exemplo, *Leptosphaeria maculans*; espécies de *Magnaporthe*, por exemplo, *Magnaporthe grisea*; espécies de *Microdochium*, por exemplo, *Microdochium nivale*; espécies de *Mycosphaerella*, por exemplo, *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* ou *Mycosphaerella fijiensis*; espécies de *Phaeosphaeria*, por exemplo, *Phaeosphaeria nodorum*; espécies de *Pyrenophora*, por exemplo, *Pyrenophora teres* ou *Pyrenophora tritici repentis*; espécies de *Ramularia*, por exemplo, *Ramularia collo-cygni* ou *Ramularia areola*; espécies de *Rhynchosporium*, por exemplo, *Rhynchosporium secalis*; espécies de *Septoria*, por exemplo, *Septoria apii* ou *Septoria lycopersici*; espécies de *Stagonospora*, por exemplo, *Stagonospora nodorum*; espécies de *Typhula*, por exemplo, *Typhula incarnata*; espécies de *Venturia*, por exemplo, *Venturia inaequalis*; doenças radiculares e de caule causadas, por exemplo, por espécies de *Corticium*, por exemplo, *Corticium graminearum*; espécies de *Fusarium*, por exemplo, *Fusarium oxysporum*; espécies de *Gaeumannomyces*, por exemplo, *Gaeumannomyces graminis*; espécies de *Rhizoctonia*, como, por exemplo, *Rhizoctonia solani*; espécies de *Tapesia*, por exemplo, *Tapesia acuformis*; espécies de *Thielaviopsis*, por exemplo,

Thielaviopsis basicola; doenças de orelha e panículo (incluindo espigas de milho) causadas, por exemplo, por espécies de Alternaria, por exemplo, Alternaria spp.; espécies de Aspergillus, por exemplo, Aspergillus flavus; espécies de Cladosporium, por exemplo, Cladosporium cladosporioides; espécies de Claviceps, por exemplo, Claviceps purpurea; espécies de Fusarium, por exemplo, Fusarium culmorum; espécies de Gibberella, por exemplo, Gibberella zeae; espécies de Monographella, por exemplo, Monographella nivalis; espécies de Septoria, por exemplo, Septoria nodorum; doenças causadas por fungos de fuligem, por exemplo, espécies de Sphacelotheca, por exemplo, Sphacelotheca reiliana; espécies de Tilletia, por exemplo, Tilletia caries, T. controversa; espécies de Urocystis, por exemplo, Urocystis occulta; espécies de Ustilago, por exemplo, Ustilago nuda, U. nuda tritici; podridão causado, por exemplo, por espécies de Aspergillus, por exemplo, Aspergillus flavus; espécies de Botrytis, por exemplo, Botrytis cinerea; espécies de Penicillium, por exemplo, Penicillium expansum ou P. purpurogenum; espécies de Sclerotinia, por exemplo, Sclerotinia sclerotiorum; espécies de Verticilium, por exemplo, Verticilium alboatrum; doenças de murcha e podridão transmitidas pela semente e solo, e também doenças de plântulas, causadas, por exemplo, por espécies de Fusarium, por exemplo, Fusarium culmorum; espécies de Phytophthora, por exemplo, Phytophthora cactorum; espécies de Pythium, por exemplo, Pythium ultimum; espécies de Rhizoctonia, por exemplo, Rhizoctonia solani; espécies de Sclerotium, por exemplo, Sclerotium rolfsii; cânceres, galhas e vassouras-de-bruxa

causadas, por exemplo, por espécies de *Nectria*, por exemplo, *Nectria galligena*;
doenças de murcha causadas, por exemplo, por espécies de *Monilinia*, por exemplo *Monilinia laxa*;
deformações de folhas, flores e frutas causadas, por exemplo, por espécies de *Taphrina*, por exemplo, *Taphrina deformans*; doenças degenerativas de plantas lenhosas causadas, por exemplo, por espécies de *Esca*, por exemplo, *Phaemoniella clamydospora* e *Phaeoacremonium aleophilum* e *Fomitiporia mediterranea*; doenças de flores e sementes causadas, por exemplo, por espécies de *Botrytis*, por exemplo, *Botrytis cinerea*; doenças de tubérculos vegetais causadas, por exemplo, por espécies de *Rhizoctonia*, por exemplo, *Rhizoctonia solani*; espécies de *Helminthosporium*, por exemplo, *Helminthosporium solani*; doenças causadas por patógenos bacterianos, por exemplo, espécies de *Xanthomonas*, por exemplo, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; espécies de *Pseudomonas*, por exemplo, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; espécies de *Erwinia*, por exemplo, *Erwinia amylovora*.

[0201] As seguintes doenças da soja podem ser controladas com preferência:

doenças fúngicas em folhas, hastes, vagens e sementes causadas, por exemplo, por mancha foliar de alternaria (*Alternaria* esp. *atrans tenuissima*), Anthracnose (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), mancha parda (*Septoria glycines*), crestamento foliar de cercospora (*Cercospora kikuchii*), ressecamento foliar por choanephora (*Choanephora infundibulifera trispora* (Sin.)), mancha foliar por dactuliophora (*Dactuliophora glycines*),

míldio (*Peronospora manshurica*), ressecamento por drechslera (*Drechslera glycini*), mancha olho-de-rã (*Cercospora sojae*), mancha foliar por leptosphaerulina (*Leptosphaerulina trifolii*), mancha foliar por phyllosticta (*Phyllosticta sojaecola*), ressecamento de vagem e haste (*Phomopsis sojae*), oídio (*Microsphaera diffusa*), mancha foliar por pyrenochaeta (*Pyrenochaeta glycines*), mela causada por rhizoctonia aerial, folhagem e mela (*Rhizoctonia solani*), ferrugem (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiae*), sarna (*Sphaceloma glycines*), ressecamento foliar por stemphylium (*Stemphylium botryosum*), mancha-alvo (*Corynespora cassiicola*).

[0202] As doenças fúngicas em raízes e base da haste causadas, por exemplo, por podridão de raiz negra (*Calonectria crotalariae*), podridão de carvão (*Macrophomina phaseolina*), ressecamento ou murcha por fusarium, podridão de raiz e podridão de vagem e colo (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), podridão de raiz por mycoleptodiscus (*Mycoleptodiscus terrestris*), neocosmospora (*Neocosmospora vasinfecta*), ressecamento de vagem e haste (*Diaporthe phaseolorum*), cancro-da-haste (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), podridão por phytophthora (*Phytophthora megasperma*), podridão parda da haste (*Phialophora gregata*), podridão causada por pythium (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), podridão radicular de rhizoctonia, necrose do caule, e tombamento (*Rhizoctonia solani*), necrose do caule causada por sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), murcha-de-

esclerócio (*Sclerotinia rolfii*), podridão radicular causada por *thielaviopsis* (*Thielaviopsis basicola*).

[0203] Os microrganismos com capacidade de degradar ou alterar os materiais industriais incluem, por exemplo, bactérias, fungos, leveduras, algas e organismos de limo. Os compostos ativos de acordo com a invenção agem, de preferência, contra fungos, especialmente, mofos, fungos de descoloração de madeira e de destruição de madeira (*Basidiomycetes*) e contra organismos de limo e algas. Exemplos incluem microrganismos dos seguintes gêneros: *Alternaria*, como *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, como *Aspergillus niger*; *Chaetomium*, como *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, como *Coniophora puetana*; *Lentinus*, como *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, como *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, como *Polyporus versicolor*; *Aureobasidium*, como *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, como *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, como *Trichoderma viride*; *Escherichia*, como *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, como *Pseudomonas aeruginosa*; e *Staphylococcus*, como *Staphylococcus aureus*.

[0204] Além disso, os compostos ativos de acordo com a invenção também têm atividade antimicótica muito boa. Os mesmos têm um espectro de atividade antimicótica muito amplo, em particular, contra dermatófitos e leveduras, mofos e fungos difásicos (por exemplo, contra as espécies de *Candida*, como *Candida albicans*, *Candida glabrata*) e *Epidermophyton floccosum*, espécies de *Aspergillus*, como *Aspergillus niger* e *Aspergillus fumigatus*, espécies de *Trichophyton*, como *Trichophyton mentagrophytes*, espécies de *Microsporon* como *Microsporon canis* e *audouinii*. A

enumeração desses fungos não constitui, de modo algum, uma restrição do espectro micótico que pode ser controlado, e é meramente caráter ilustrativo.

[0205] Os compostos ativos de acordo com a invenção podem ser, portanto, usados tanto em aplicações médicas quanto em aplicações não médicas.

[0206] Se adequado, os compostos de acordo com a invenção também podem ser, a certas concentrações ou taxas de aplicação, usados como herbicidas, agentes de proteção, reguladores de crescimento ou agentes para melhorar propriedades de planta, ou como microbicidas, por exemplo, como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluindo agentes contra viroides) ou como agentes contra MLO (organismos similares a mycoplasma) e RLO (organismos similares a rickettsia). Os mesmos também podem, conforme pode ser o caso, ser usados como intermediários ou precursores para a síntese de outros compostos ativos.

A. Exemplos químicos

[0207] Os dados de RMN dos exemplos revelados são listados em forma convencional (valores δ , divisão de multipletos, número de átomos de hidrogênio) ou como as denominadas listas de pico de RMN. No método de lista de pico de RMN, os dados de RMN dos exemplos selecionados são registrados na forma de lista de pico de RMN, em que para cada pico de sinal primeiro o valor de δ em ppm e, então, separados por um espaço, a intensidade de sinal são listados. Os pares de número de intensidade de sinal/valor δ para diferentes picos de sinal são listados com separação de um para o outro por ponto-e-vírgula.

[0208] A lista de pico para um exemplo, portanto, assume

a forma de:

δ_1 (intensidade₁); δ_2 (intensidade₂);.....; δ_i
(intensidade_i);.....; δ_n (intensidade_n)

[0209] A intensidade de sinais agudos está correlacionada com a altura dos sinais em um exemplo impresso de um espectro de RMN em cm e mostra as razões verdadeiras das intensidades de sinal. No caso de sinais largos, vários picos ou o meio do sinal e uma intensidade relativa do mesmo podem ser mostrados em comparação com o sinal mais intenso no espectro.

[0210] Para calibração do deslocamento químico de espectros de ^1H RMN, usa-se tetrametilsilano e/ou o deslocamento químico do solvente, particularmente no caso de espectros que são medidos em DMSO. Portanto, o pico de tetrametilsilano pode, mas não precisa ocorrer em listas de pico de RMN.

[0211] As listas dos picos de ^1H RMN são similares às cópias de ^1H RMN convencionais e, então, contêm usualmente todos os picos listados em uma interpretação convencional de RMN.

[0212] Além disso, como as impressões de ^1H RMN convencionais, as mesmas podem mostrar sinais de solvente, sinais de estereoisômeros dos compostos-alvo que são fornecidos de modo semelhante pela invenção, e/ou picos de impurezas.

[0213] No relatório dos sinais de composto dentro da faixa de delta de solventes e/ou água, as presentes listas de picos de ^1H RMN mostram os picos de solvente padrão, por exemplo, picos de DMSO em DMSO- D_6 e o pico de água, que têm usualmente uma alta intensidade em média.

[0214] Os picos de estereoisômeros dos compostos-alvo e/ou picos de impurezas usualmente têm uma menor intensidade em média do que os picos dos compostos-alvo (por exemplo, com uma pureza de > 90 %).

[0215] Tais estereoisômeros e/ou impurezas podem ser típicos do processo de preparação particular. Seus picos podem, então, auxiliar na identificação da reprodução de nosso processo de preparação com referência a "perfis cromatográficos de subproduto".

[0216] Um especialista que calcula os picos dos compostos endereçados através de métodos conhecidos (MestreC, simulação de ACD, mas também com valores esperados empiricamente avaliados) pode, se requerido, isolar os picos dos compostos endereçados, opcionalmente com o uso de filtros de intensidade adicionais. Esse isolamento seria semelhante à seleção de pico relevante na interpretação de ^1H RMN clássica.

[0217] Mais detalhes das listas de pico de ^1H RMN podem ser encontrados no Research Disclosure Database [Banco de Dados de Revelação de Pesquisa] Número 564025.

[0218] Os exemplos a seguir ilustram a invenção em detalhes.

Intermediário 1

Preparação de cloreto de 3,5-difluoro-N-hidroxibenzenocarboximidoila

[0219] Analogamente ao procedimento no documento W02012/130798 para cloreto de 3,5-dicloro-N-hidroxibenzenocarboximidoíla, cloreto de 3,5-difluoro-N-hidroxibenzenocarboximidoíla foi preparado a partir de 3,5-difluorobenzaldeído em duas etapas.

Intermediário 2

Preparação de 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxilato de metila

[0220] Analogamente ao procedimento no documento W02012/130798 para 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxilato de metila, 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxilato de metila foi preparado a partir de 3,5-difluorobenzaldeído em três etapas.

Intermediário 3

Preparação de ácido 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxílico

[0221] Analogamente ao procedimento no documento W02012/130798 para ácido 3-(3,5-diclorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxílico, o ácido 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxílico foi preparado por hidrólise de 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxilato de metila.

Intermediário 4

Preparação de cloreto de 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonila

[0222] Analogamente ao procedimento no documento W02012/130798 para N-*terc*-butil-3-(3,5-diclorofenil)-5-metil-4,5-di-hidro-1,2-oxazol-5-carboxamida, o 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-cloreto de carbonila foi preparado a partir de ácido de 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxílico por reação com cloreto de oxalila e usado como produto bruto sem purificação adicional.

Intermediário 5

Preparação de 3-(3,5-difluorofenil)-5-(1-hidroxietil)-4H-

isoxazol-5-carboxilato de metila

[0223] 19,9 g (104 mmol) de cloreto de 3,5-difluoro-N-hidroxibenzimidoila (consultar Intermediário 1) foram dissolvidos em 330 ml de 2-propanol, e 15,0 g (104 mmol) de 3-hidroxi-2-metilenobutanoato de metila foram adicionados. Após a adição de 43,8 g (522 mmol) de bicarbonato de sódio, a suspensão foi aquecida para 50 °C e a temperatura foi mantida por 2 h até a conversão completa do material de partida. A suspensão foi filtrada e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida. O resíduo resultante foi tomado em diclorometano e, então, lavado com solução de cloreto de sódio saturado e a fase orgânica foi seca com sulfato de sódio e, após a filtração, concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto assim obtido foi tomado em tolueno e, por adição de n-heptano, cristalizado. Isso gerou 25,5 g (86 %) de 3-(3,5-difluorofenil)-5-(1-hidroxietil)-4H-isoxazol-5-carboxilato de metila na forma de cristais incolores.

[0224] Diastereoisômero 1: ^1H RMN (CDCl_3): δ = 1,20 (d, 3H), 2,36 (d, 1H), 3,52 (d, 1H), 3,72 (d, 1H), 3,83 (s, 3H), 4,34 (m, 1H), 6,88 (m, 1H), 7,20 (m, 2H).

[0225] Diastereoisômero 2: ^1H RMN (CDCl_3): δ = 1,29 (d, 3H), 2,12 (d, 1H), 3,58 (d, 1H), 3,68 (d, 1H), 3,83 (s, 3H), 4,23 (m, 1H), 6,88 (m, 1H), 7,20 (m, 2H).

Intermediário 6

Preparação de 3-(3,5-difluorofenil)-5-[1-(trifluorometilsulfonilo)etil]-4H-isoxazol-5-carboxilato de metila

[0226] 29,9 (105 mmol) de 3-(3,5-difluorofenil)-5-(1-hidroxietil)-4H-isoxazol-5-carboxilato de metila em 660 ml

de diclorometano foram resfriados a 0 °C, e 16,3 g (210 mmol) de piridina foram adicionados. Uma solução de 38,6 g (137 mmol) de anidrido trifluorometanossulfônico em 80 ml de diclorometano foram, então, lentamente adicionados. Após 30 minutos a 0 °C, 300 ml de diclorometano foram adicionados e a fase orgânica foi lavada três vezes, em cada caso, com 200 ml de uma solução de solução de cloreto de sódio saturado e ácido clorídrico a 1 N (3:1). A fase orgânica foi, então, lavada duas vezes com solução de cloreto de sódio aquosa saturada e seca em sulfato de sódio, e o solvente foi removido sob pressão reduzida. O produto bruto resultante foi usado na próxima etapa sem purificação adicional.

[0227] Diastereoisômero 1: ^1H RMN (CDCl_3): δ = 1,54 (d, 3H), 3,44 (d, 1H), 3,89 (s, 3H), 3,94 (d, 1H), 5,49 (q, 1H), 6,91 (m, 1H), 7,20 (m, 2H).

[0228] Diastereoisômero 2: ^1H RMN (CDCl_3): δ = 1,59 (d, 3H), 3,53 (d, 1H), 3,89 (s, 3H), 3,90 (d, 1H), 5,57 (q, 1H), 6,91 (m, 1H), 7,20 (m, 2H).

Intermediário 7

Preparação de 3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxilato de metila

[0229] 43,0 g (103 mmol) do produto bruto a partir da etapa anterior (3-(3,5-difluorofenil)-5-[1-(trifluorometilsulfonilo)etil]-4H-isoxazol-5-carboxilato de metila) foram dissolvidos em 500 ml de dimetilacetamida, e uma solução de 18,8 g (124 mmol) de DBU em 50 ml de dimetilacetamida foram adicionados por gotejamento ao longo de 20 minutos. A mistura de reação foi agitada em temperatura ambiente por 2 h e, então,

despejada em 1 l de ácido clorídrico 2 N gelado e extraída duas vezes com 500 ml de éter dietílico. As fases orgânicas combinadas foram secas com sulfato de sódio, filtradas e concentradas sob pressão reduzida. Após a purificação cromatográfica em gel de sílica com o uso do diclorometano de fase móvel o produto bruto foi cristalizado a partir de ciclo-hexano. Isso produz 23,4 g (85 %) de cristais incolores.

[0230] ^1H RMN (CDCl_3): δ = 3,34 (d, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,93 (d, 1H), 5,38 (d, 1H), 5,55 (d, 1H), 6,14 (dd, 1H), 6,88 (m, 1H), 7,19 (m, 2H).

Intermediário 8

Preparação de ácido 3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxílico

[0231] 21 ml de solução aquosa a 2 N de hidróxido de sódio foram adicionados a 7,5 g (28,0 mmol) de 3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxilato de metila e a mistura foi aquecida a refluxo por 8 h. Após o resfriamento a mistura de reação foi lavada com acetato de etila, a fase aquosa foi acidificada a pH 1 com ácido clorídrico a 2 N e o precipitado incolor foi filtrado e seco a ar. O rendimento foi de 6,8 g (96 %).

[0232] ^1H RMN (CDCl_3): δ = 3,40 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 5,00 (dd, 1H), 5,45 (d, 1H), 5,63 (d, 1H), 6,16 (dd, 1H), 6,87-6,93 (m, 1H), 7,16-7,21 (m, 2H).

Intermediário 9

Preparação de cloreto de 3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carbonila

[0233] 2,70 g (10,6 mmol) de ácido 3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxílico foram

adicionados a 45 ml de diclorometano, e três gotas de dimetilformamida (DMF) seguidas por 2,03 g (15,9 mmol) de cloreto de oxalila foram, então, adicionados. Uma evolução vigorosa de gás foi observada. A mistura foi agitada a temperatura ambiente por 6 h e o solvente e excesso de cloreto de oxalila foram, então, evaporados sob pressão reduzida. O produto bruto resultante foi usado na próxima etapa sem purificação adicional.

Intermediário 10

Preparação de 4-aminotetra-hidrofuran-3-carboxilato de metila

[0234] 4-Aminotetra-hidrofuran-3-carboxilato de metila pode ser preparado pelo método descrito por G.R. Ott et al.; *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2008, 694-699.

Intermediário 11

Preparação de cloridrato de cis-4-aminotetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila

[0235] Cloridrato de cis-4-aminotetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila pode ser preparado pelo método descrito por D.P. Walker et al., *Synthesis* 2011, 1113-1119.

Intermediário 12

Preparação de cloridrato de [cis-4-aminotetra-hidrofuran-2-il](pirrolidin-1-il)metanona

[0236] 1,15 ml (13,7 mmol) de pirrolidina foram adicionados a 100 mg (0,55 mmol) de cloridrato de cis-4-aminotetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 3 dias. A mistura de reação foi, então, concentrada sob pressão reduzida. Isso produziu o composto do título como um produto bruto

que foi usado para a próxima etapa sem purificação adicional.

Intermediário 13

Preparação de cloridrato de cis-4-amino-N-ciclopropiltetra-hidrofuran-2-carboxamida

[0237] 0,95 ml (13,7 mmol) de ciclopropilamina foram adicionados a 100 mg (0,55 mmol) de cloridrato de cis-4-aminotetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 3 dias. A mistura de reação foi, então, concentrada sob pressão reduzida. Isso produziu o composto do título como um produto bruto que foi usado para a próxima etapa sem purificação adicional.

Intermediário 14

Preparação de cloridrato de cis-4-amino-N-metiltetra-hidrofuran-2-carboxamida

[0238] 0,20 ml (2,75 mmol) de uma solução de metilamina com 40 % de força foi adicionado a 100 mg (0,55 mmol) de cloridrato de cis-4-aminotetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila em 2,5 ml de metanol, e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 3 dias. A mistura de reação foi, então, concentrada sob pressão reduzida. Isso produziu o composto do título como um produto bruto que foi usado para a próxima etapa sem purificação adicional.

Intermediário 15

Preparação de cis-4-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila

[0239] 1,15 ml de trietilamina foi adicionado a 601 mg (4,14 mmol) de cloridrato de cis-4-aminotetra-hidrofuran-

2-carboxilato de metila em 12,5 ml de diclorometano, 750 mg (2,76 mmol) de cloridrato de carbonila Intermediário 9 em 12,5 ml de diclorometano foram adicionados a 0 °C, a mistura foi agitada por 6 h aquecendo até temperatura ambiente e, por fim, a água foi adicionada. A fase orgânica foi removida, seca com sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. A cromatografia do resíduo de evaporação produziu 1,00 g (91 %) de cis-4-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila.

Intermediário 16

Preparação de cis-4-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila

[0240] 292 mg (2,88 ml) de trietilamina foram adicionados a 262 mg (1,44 mmol) de Intermediário 14 em 5 ml de diclorometano, 250 mg (0,96 mmol) de cloridrato de carbonila (intermediário 4) em 6 ml de diclorometano foram adicionados a 0 °C, a mistura foi agitada por 6 h aquecendo até temperatura ambiente e, por fim, a água foi adicionada. A fase orgânica foi removida, seca com sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. A cromatografia do resíduo de evaporação produziu 75 mg (21 %) de cis-4-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila.

Intermediário 17

Preparação de cis-4-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila

[0241] De modo análogo ao preparo do Intermediário 9,

primeiro, o cloridrato de carbonila correspondente foi preparado, o qual foi convertido de modo análogo a Intermediário 15 no composto do título.

[0242] Dessa maneira, 246 mg (1,35 mmol) de cloridrato de cis-4-aminotetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila e 228 mg (0,90 mmol) de cloridrato de carbonila geraram 110 mg (31 %) de cis-4-[[5S)-3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila.

Intermediário 18

Preparação de cis-4-[[3-(3-fluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila

[0243] De modo análogo ao preparo do Intermediário 4, primeiro, o cloridrato de carbonila correspondente foi preparado, o qual foi convertido de modo análogo a Intermediário 16 no composto-alvo.

[0244] Dessa maneira, 169 mg (0,93 mmol) de cloridrato de cis-4-aminotetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila e 150 mg (0,62 mmol) de cloridrato de carbonila produziram 171 mg (75 %) de cis-4-[[3-(3-fluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila.

Intermediário 19

Preparação de ácido cis-4-[[3-(3-fluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxílico

[0245] 1 ml de ácido clorídrico a 2 N foi adicionado a 85 mg (0,24 mmol) de cis-4-[[3-(3-fluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxilato de metila e a mistura foi mantida a temperatura ambiente

por 3 dias. A mistura de reação foi, então, concentrada em um evaporador giratório. Dessa maneira, 33 mg (40 %) de ácido *cis*-4-[[3-(3-fluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxílico foram obtidos.

Intermediário 20

Preparação de 3-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-3-carboxilato de metila e ácido 3-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-3-carboxílico

[0246] Primeiro, o cloridrato de carbonila intermediário 4 foi preparado, que foi reagido de modo análogo ao Intermediário 16 para produzir o composto do título.

[0247] Dessa maneira, 787 mg (4,33 mmol) de cloridrato de 3-aminotetra-hidrofuran-3-carboxilato de metila e 750 mg (2,88 mmol) de cloridrato de carbonila geraram, após finalização e cromatografia em gel de sílica, 223 mg (21 %) de 3-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-3-carboxilato de metila e 535 mg (47 %) de ácido 3-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-3-carboxílico.

Intermediário 21

Preparação de 4-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-3-carboxilato de metila

[0248] Primeiro, o cloridrato de carbonila correspondente foi preparado, que foi reagido de modo análogo à preparação do Intermediário 16 com 4-aminotetra-hidrofuran-3-carboxilato de metila para render o composto

do título.

[0249] Dessa maneira, 419 mg (8,66 mmol) de 4-aminotetra-hidrofuran-3-carboxilato de metila e 500 mg (1,92 mmol) de cloridrato de carbonila produziram 657 mg (91 %) de 4-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-3- carboxilato de metila.

Intermediário 22

Preparação de ácido cis-4-[[[(5S)-3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carboxílico

[0250] 0,52 g do éster metílico foi dissolvido em 8 ml de tetra-hidrofurano e resfriado para 0 °C. Uma solução de 98 mg de hidróxido de lítio em 4 ml de água foi adicionada a essa solução por gotejamento com agitação. Com agitação, levou-se a mistura de reação à temperatura ambiente durante 1 h. Então, a mistura de reação foi diluída com água, acidificada com ácido clorídrico aquoso a 0,5 M e extraída com acetato de etila. A fase de acetato de etila resultante foi, então, seca e concentrada sob pressão reduzida.

[0251] Para purificação adicional, o produto bruto foi, então, tomado em solução aquosa a 2 M de hidróxido de sódio e lavado com acetato de etila. A fase aquosa foi subsequentemente acidificada com ácido clorídrico aquoso a 2 M e extraída com diclorometano. A fase de diclorometano foi seca e concentrada. Isso gerou 0,53 g de ácido carboxílico (84 % de rendimento).

[0252] Dados analíticos para os intermediários

Intermediário nº	RMN
Intermediário - 16	^1H -RMN(400,0 MHz, CDCl_3): δ = 7,518(1,0);7,260(181,8);7,171(1,8);7,166(2,2);7,162(1,3);7,155(1,2);7,151(2,2);7,146(1,8);6,996(1,0);6,898(0,6);6,883(0,7);6,882(0,7);6,878(1,2);6,876(1,2);6,870(0,6);6,854(0,6);4,578(1,1);4,573(0,7);4,569(1,1);4,560(0,5);4,554(1,6);4,545(1,3);4,530(1,0);4,521(0,8);4,065(0,8);4,052(0,8);4,042(1,3);4,029(1,7);4,017(0,8);4,006(1,1);3,993(1,0);3,967(0,7);3,962(0,7);3,900(0,6);3,896(0,6);3,834(14,5);3,785(16,0);3,773(2,0);3,756(1,8);3,730(2,2);3,712(2,0);3,190(1,9);3,182(2,0);3,146(1,6);3,138(1,8);2,558(0,7);2,541(0,9);2,524(0,8);2,506(0,5);2,019(0,5);1,710(11,3);1,687(10,3);1,541(35,4);0,008(2,1);0,000(68,8);-0,008(1,9)
Intermediário - 17	^1H -RMN(400,0 MHz, CDCl_3): δ = 7,262(28,6);7,180(2,2);7,174(2,6);7,171(1,5);7,163(1,5);7,160(2,6);7,154(2,1);6,903(0,8);6,887(0,9);6,882(1,6);6,876(0,8);6,860(0,8);6,176(2,0);6,150(2,3);6,133(2,4);6,106(2,5);5,560(1,8);5,558(1,8);5,544(1,7);5,543(1,7);5,517(1,5);5,515(1,5);5,501(1,5);5,500(1,4);5,357(1,6);5,356(1,6);5,343(1,5);5,342(1,5);5,330(1,5);5,329(1,5);5,

	316(1,4);5,315(1,4);5,299(9,2);4,603(0,5);4,596(0,6);4,591(0,6);4,585(0,6);4,579(0,6);4,574(1,1);4,565(1,2);4,558(1,1);4,550(1,4);4,542(0,9);4,534(0,9);4,525(0,8);4,056(0,8);4,043(0,9);4,041(0,9);4,033(1,3);4,028(0,8);4,020(1,3);4,017(1,4);4,004(1,1);3,950(0,7);3,946(0,7);3,944(0,7);3,929(1,1);3,922(2,7);3,905(0,5);3,899(2,3);3,878(2,2);3,856(2,2);3,814(15,9);3,800(16,0);3,322(1,9);3,313(1,9);3,279(1,6);3,270(1,7);2,566(0,5);2,564(0,5);2,555(0,6);2,549(0,5);2,546(0,5);2,540(0,6);2,538(0,6);2,531(0,6);2,529(0,6);2,514(0,5);2,511(0,6);2,094(0,6);2,060(0,5);2,052(0,5);2,044(0,6);1,577(5,9);0,000(11,4)
Intermediário - 18	^1H-RMN(400,0 MHz, CDCl_3): δ= 7,518(1,2);7,394(1,4);7,389(2,4);7,374(5,0);7,365(4,2);7,358(0,6);7,310(0,7);7,268(1,5);7,265(3,0);7,259(207,2);7,253(1,0);7,252(0,8);7,251(0,6);7,145(0,8);7,140(0,6);7,130(1,0);7,121(0,9);7,113(0,6);7,110(0,6);6,995(1,2);4,577(1,2);4,567(1,1);4,557(0,6);4,553(1,2);4,550(1,2);4,544(1,0);4,540(1,1);4,526(0,9);4,517(0,8);4,072(0,8);4,059(0,8);4,048(1,3);4,035(1,6);4,021(0,8);4,010(1,1);3,997(0,9);3,966(0,7);3,961(0,8);3,896(0,6);3,890(0,6);3,

	835(14,3);3,800(2,0);3,785(2,1);3,778(16,0);3,762(0,6);3,757(2,3);3,742(2,1);3,223(1,9);3,215(2,1);3,180(1,7);3,172(1,9);2,561(0,8);2,549(0,5);2,543(0,9);2,526(0,9);2,520(0,5);2,509(0,5);2,503(0,5);2,018(0,6);1,983(0,5);1,725(0,6);1,714(1,4);1,708(11,3);1,697(0,7);1,686(10,3);1,666(0,6);1,606(2,7);0,008(2,2);0,000(86,6);-0,008(2,6)
Intermediário - 19	¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,147(0,6);8,130(0,6);8,087(0,6);8,069(0,6);7,526(2,2);7,524(2,3);7,517(3,2);7,512(2,2);7,498(2,4);7,469(1,1);7,465(0,9);7,349(0,6);7,341(0,6);7,334(0,7);7,326(1,0);7,322(0,9);7,315(0,6);7,308(0,6);7,303(0,7);5,756(5,0);4,380(0,6);4,365(1,4);4,359(0,8);4,349(1,0);4,343(1,5);4,327(0,9);4,318(0,8);4,303(0,8);3,911(0,7);3,895(0,7);3,889(0,9);3,873(0,8);3,868(0,7);3,853(0,7);3,847(0,8);3,831(0,7);3,761(1,3);3,740(1,5);3,717(1,6);3,696(1,9);3,678(0,8);3,671(0,7);3,660(0,8);3,647(0,7);3,638(0,6);3,625(0,6);3,390(1,8);3,385(1,7);3,346(1,9);3,341(2,0);3,322(43,8);2,670(0,6);2,544(0,8);2,524(1,3);2,519(2,0);2,510(32,8);2,506(72,0);2,501(100,7);2,497(70,3);2,492(31,4);2,468(0,8);2,456(1,2);2,451(1,0);2,447(1,1);2,436(0,5);2,425(0,7);2,328(0

	, 6); 2,048(0,5); 1,979(0,6); 1,963(0,6); 1,947(0,6); 1,567(1,4); 1,534(16,0); 0,000(1,8)
Intermediário - 20	^1H -RMN(400,0 MHz, CDCl_3): δ = 7,260(62,3); 7,217(0,8); 7,186(1,3); 7,181(2,3); 7,178(1,4); 7,175(1,5); 7,171(1,1); 7,167(1,6); 7,164(1,3); 7,161(2,3); 7,155(1,1); 6,919(0,5); 6,913(0,9); 6,897(1,1); 6,891(1,8); 6,886(0,9); 6,876(0,5); 6,870(0,9); 4,239(1,7); 4,215(2,1); 4,203(1,6); 4,179(1,9); 4,012(1,6); 4,002(2,5); 3,996(1,5); 3,993(2,0); 3,988(1,1); 3,982(2,1); 3,977(2,8); 3,968(0,9); 3,964(0,9); 3,946(1,3); 3,922(1,1); 3,769(1,9); 3,760(1,7); 3,724(14,8); 3,716(2,1); 3,706(16,0); 3,208(3,1); 3,165(2,8); 2,624(0,6); 2,603(0,5); 2,590(0,9); 2,584(0,6); 2,570(0,6); 2,551(0,8); 2,252(0,6); 2,236(0,5); 2,219(0,5); 2,190(0,6); 2,174(0,6); 1,723(14,0); 1,547(5,9); 0,008(0,7); 0,000(23,6); -0,008(0,7)
Intermediário - 21	^1H -RMN(400,0 MHz, CDCl_3): δ = 7,263(33,4); 7,258(0,6); 7,179(0,5); 7,174(1,4); 7,168(1,8); 7,165(2,3); 7,159(2,1); 7,157(1,5); 7,154(2,0); 7,148(2,2); 7,145(1,7); 7,140(1,3); 7,040(0,7); 7,021(0,7); 6,916(0,8); 6,910(0,8); 6,900(0,8); 6,894(1,7); 6,888(1,5); 6,882(0,6); 6,879(0,7); 6,872(1,0); 6,866(0,8); 4,715(0,8); 4,710(0,6); 4,706(0,8); 4,700(0,6)

	); 4,696(0,8); 4,690(0,5); 4,225(0,7); 4,203(1,7); 4,181(1,8); 4,159(0,9); 4,149(0,6); 4,131(1,6); 4,113(1,6); 4,095(0,6); 4,038(0,9); 4,023(0,9); 4,014(1,8); 4,000(1,8); 3,991(1,0); 3,976(1,1); 3,950(1,0); 3,934(1,0); 3,927(0,9); 3,922(1,0); 3,911(0,9); 3,907(1,1); 3,899(0,9); 3,884(0,9); 3,792(2,0); 3,780(2,0); 3,774(0,6); 3,772(0,5); 3,757(0,9); 3,746(16,0); 3,741(1,2); 3,737(6,0); 3,731(1,2); 3,725(1,0); 3,710(0,6); 3,704(0,6); 3,691(16,0); 3,680(1,1); 3,665(0,9); 3,656(0,8); 3,541(3,0); 3,211(2,8); 3,188(0,6); 3,168(2,4); 3,145(0,5); 3,007(1,0); 2,045(7,1); 1,722(10,8); 1,715(13,2); 1,688(2,5); 1,277(2,6); 1,264(1,8); 1,260(5,3); 1,242(2,3); 0,899(0,9); 0,882(3,1); 0,864(1,2); 0,000(13,7)
Intermediário - 22	¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,520(1,5); 7,343(1,5); 7,322(1,6); 7,305(1,7); 7,284(1,9); 7,261(268,6); 7,179(1,2); 7,177(1,2); 7,166(5,7); 7,164(8,0); 7,161(9,1); 7,158(8,3); 7,147(8,5); 7,144(8,8); 7,141(7,4); 7,139(5,1); 7,129(1,0); 6,997(1,5); 6,906(1,3); 6,900(2,2); 6,896(1,6); 6,890(2,3); 6,884(3,3); 6,878(4,5); 6,874(3,2); 6,869(4,3); 6,863(3,1); 6,857(2,3); 6,853(1,6); 6,847(2,1); 6,841(0,9); 6,168(4,3); 6,156(4,4); 6,141(4,9); 6,130(5,1); 6,124(5,4); 6,113(5,2)

	); 6,098(5,5); 6,086(5,4); 5,544(7,8); 5,543(6,8); 5,532(7,5); 5,531(6,8); 5,501(6,8); 5,500(6,0); 5,489(6,7); 5,355(7,2); 5,346(7,0); 5,328(6,8); 5,319(6,4); 5,299(16,0); 4,609(3,9); 4,598(7,8); 4,588(5,5); 4,585(6,1); 4,575(8,8); 4,565(5,7); 4,553(2,3); 4,546(2,1); 4,540(1,5); 4,527(1,2); 4,380(0,5); 4,150(1,0); 4,132(2,6); 4,115(2,7); 4,103(3,0); 4,097(1,2); 4,090(3,0); 4,079(7,4); 4,066(7,2); 4,056(4,9); 4,042(4,5); 4,012(3,1); 4,007(3,1); 3,988(2,1); 3,983(4,6); 3,976(3,1); 3,958(1,9); 3,952(1,8); 3,926(7,3); 3,915(7,6); 3,884(8,4); 3,872(8,6); 3,698(0,6); 3,332(7,6); 3,325(7,6); 3,289(6,6); 3,282(6,7); 2,681(1,5); 2,664(1,6); 2,657(1,6); 2,646(2,1); 2,640(3,3); 2,629(2,0); 2,623(3,4); 2,616(1,7); 2,605(3,7); 2,599(1,8); 2,588(1,8); 2,582(1,8); 2,564(1,6); 2,226(1,3); 2,219(2,1); 2,210(1,3); 2,192(1,2); 2,184(3,0); 2,176(3,1); 2,167(1,4); 2,150(1,1); 2,141(1,8); 2,133(1,1); 2,116(4,1); 2,046(10,8); 1,432(3,6); 1,304(1,2); 1,277(5,0); 1,265(5,9); 1,259(10,0); 1,242(3,6); 0,899(3,2); 0,882(11,0); 0,864(4,2); 0,008(2,5); 0,000(95,7); -0,008(2,8)
--	---

Exemplo I-01

Preparação de N-[3-(ciclopropilcarbamoil)tetra-hidrofuran-

3-il]-3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0253] Em temperatura ambiente, 100 mg (0,28 mmol) de ácido 3-[[3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-3-carboxílico, 20 mg (0,35 mmol) de ciclopropilamina, 11,4 mg (0,08 mmol) de 1-hidroxi-1H-benzotriazol e 65 mg (0,33 mmol) de cloridrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodi-imida foram adicionados a 5 ml de diclorometano. 41 mg (0,35 mmol) de N,N-dietilisopropilamina foram, então, adicionados, e a mistura de reação foi agitada em temperatura ambiente por 16 h. Mais 2 ml de diclorometano, 20 mg (0,35 mmol) de ciclopropilamina, 11,4 mg (0,08 mmol) de 1-hidroxi-1H-benzotriazol e 65 mg (0,33 mmol) de cloridrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodi-imida foram, então, adicionados e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 16 h. A água foi, então, adicionada à mistura de reação e a fase orgânica foi separada, seca com sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo de evaporação foi cromatografado em gel de sílica (fase móvel: acetato de etila / n-heptano). Isso rendeu 91 mg (82 %) do composto do título.

Exemplo I-02

Preparação de 3-(3,5-difluorofenil)-N-[cis-5-(metilcarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0254] 0,47 ml (6,57 mmol) de uma solução de metilamina com 40 % de força em metanol foi adicionado a 100 mg (0,26 mmol) de carboxilato de metila intermediário 15 em 2 ml de metanol, e a mistura foi agitada em temperatura ambiente

por 16 h. A mistura de reação foi, então, concentrada sob pressão reduzida. Isso rendeu 73 mg (72 %) do composto do título.

Exemplo I-03

Preparação de 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-N-[cis-5-(pirrolidina-1-carbonil)tetra-hidrofuran-3-il]-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0255] 106 mg (0,57 mmol) de carboxamida intermediário 12 foram adicionados a 100 mg (0,38 mmol) de cloridrato de carbonila intermediário 4 em 8 ml de diclorometano, 117 mg (1,15 mmol) de trietilamina foram, então, adicionados a 0 °C e a mistura foi agitada por 6 h, aquecendo até temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo obtido foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica (fase móvel n-heptano/acetato de etila). Isso rendeu 96 mg (61 %) de 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-N-[cis-5-(pirrolidina-1-carbonil)tetra-hidrofuran-3-il]-4H-isoxazol-5-carboxamida.

Exemplo I-04

Preparação de N-[cis-5-(ciclopropilcarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0256] 98 mg (0,57 mmol) de carboxamida intermediário 13 foram adicionados a 100 mg (0,38 mmol) de cloridrato de carbonila intermediário 4 em 8 ml de diclorometano, 117 mg (1,15 mmol) de trietilamina foram, então, adicionados a 0 °C e a mistura foi agitada por 6 h, aquecendo até temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo obtido foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica (fase móvel n-

heptano/acetato de etila). Isso rendeu 101 mg (65 %) de N-[cis-5-(ciclopropilcarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxamida.

Exemplo I-05

Preparação de 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-N-[cis-5-(metilcarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0257] 83 mg (0,57 mmol) de carboxamida intermediário 14 foram adicionados a 100 mg (0,38 mmol) de cloridrato de carbonila intermediário 4 em 8 ml de diclorometano, 117 mg (1,15 mmol) de trietilamina foram, então, adicionados a 0 °C e a mistura foi agitada por 6 h, aquecendo até temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo obtido foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica (fase móvel n-heptano/acetato de etila). Isso rendeu 50 mg (34 %) de 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-N-[cis-5-(metilcarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-4H-isoxazol-5-carboxamida.

Exemplo I-06

Preparação de 3-(3,5-difluorofenil)-N-[cis-5-(pirrolidin-1-carbonil)tetra-hidrofuran-3-il]-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0258] 0,52 ml (6,57 mmol) de pirrolidina foi adicionado a 100 mg (0,26 mmol) de carboxilato de metila intermediário 15, e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 16 h. A mistura de reação foi, então, concentrada sob pressão reduzida e o resíduo obtido foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica (fase móvel n-heptano/acetato de etila). Isso rendeu 57 mg

(48 %) do composto do título.

Exemplo I-07

Preparação de 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-N-[4-(metilcarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0259] 0,15 ml (2,00 mmol) de uma solução de metilamina com 40 % de força em metanol foi adicionado a 150 mg (0,40 mmol) de carboxilato de metila intermediário 21 em 5 ml de metanol, e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 3 dias. A mistura de reação foi, então, concentrada sob pressão reduzida. Isso rendeu 125 mg (84 %) do composto do título bruto.

Exemplo I-08

Preparação de N-[4-(ciclopropilcarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0260] 0,51 ml (6,10 mmol) de ciclopropilamina foi adicionado a 150 mg (0,40 mmol) de carboxilato de metila intermediário 21, e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 3 dias. A mistura de reação foi, então, concentrada sob pressão reduzida. Isso rendeu 193 mg do composto do título bruto.

Exemplo I-09

Preparação de 3-(3,5-difluorofenil)-5-metil-N-[4-(pirrolidina-1-carbonil)tetra-hidrofuran-3-il]-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0261] 0,51 ml (6,10 mmol) de pirrolidina foi adicionado a 150 mg (0,40 mmol) de carboxilato de metila intermediário 21, e a mistura foi agitada em temperatura ambiente por 3 dias. A mistura de reação foi, então,

concentrada sob pressão reduzida e o resíduo obtido foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica (fase móvel n-heptano/acetato de etila). Isso rendeu 58 mg (34 %) do composto do título.

Exemplo I-10

Preparação de 3-(3-fluorofenil)-N-[cis-5-(metoxycarbamoyl)tetra-hidrofuran-3-il]-5-metil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0262] 0,11 g de ácido carboxílico intermediário 19 e 30 mg de cloridrato de (amino-oxi)metano foram dissolvidos em diclorometano, e 0,08 g de trietilamina e 0,28 g de uma solução de anidrido propilfosfônico (50 % de força) em tetra-hidrofurano foram adicionados em sucessão. A mistura de reação foi, então, agitada em temperatura ambiente por 2,5 h. A mistura de reação foi, então, lavada com solução de bicarbonato de sódio aquoso saturado, seca e concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica. Isso produz 0,10 g (86 %) de éster hidroxâmico.

Exemplo I-11

Preparação de (5S)-3-(3,5-difluorofenil)-N-[cis-5-(metoxycarbamoyl)tetra-hidrofuran-3-il]-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0263] 100 mg de ácido carboxílico intermediário 22 e 27 mg de cloridrato de (amino-oxi)metano foram dissolvidos em diclorometano, e 0,08 g de trietilamina e 0,26 g de uma solução de anidrido propilfosfônico (50 % de força) em tetra-hidrofurano foram adicionados em sucessão. A mistura de reação foi, então, agitada em temperatura ambiente por 3 h. A mistura de reação foi, então, lavada com solução de

bicarbonato de sódio aquoso saturado, seca e concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica. Isso rendeu 96 mg de éster hidroxâmico (89 % de rendimento).

Exemplo I-12

Preparação de (5S)-3-(3,5-difluorofenil)-N-[cis-5-(etoxicarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0264] 80 mg de ácido carboxílico intermediário 22 e 26 mg de cloridrato de (amino-oxi)etano foram dissolvidos em diclorometano, e 0,07 g de trietilamina e 0,21 g de uma solução de anidrido propilfosfônico (50 % de força) em tetra-hidrofurano foram adicionados em sucessão. A mistura de reação foi, então, agitada em temperatura ambiente por 3 h. A mistura de reação foi, então, lavada com solução de bicarbonato de sódio aquoso saturado, seca e concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica. Isso rendeu 87 mg de éster hidroxâmico (98 % de rendimento).

Exemplo I-13

Preparação de (5S)-3-(3,5-difluorofenil)-N-[cis-5-(isopropoxicarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0265] 96 mg de ácido carboxílico intermediário 22 e 29 mg de cloridrato de 2-(amino-oxi)propano foram dissolvidos em diclorometano, e 0,07 g de trietilamina e 0,21 g de uma solução de anidrido propilfosfônico (50 % de força) em tetra-hidrofurano foram adicionados em sucessão. A mistura de reação foi, então, agitada em temperatura ambiente por 3 h. A mistura de reação foi, então, lavada com solução de

bicarbonato de sódio aquoso saturado, seca e concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica. Isso rendeu 95 mg de éster hidroxâmico (86 % de rendimento).

Exemplo I-14

Preparação de (5S)-3-(3,5-difluorofenil)-N-[cis-5-(trifluorometilsulfonilcarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0266] 0,11 g de ácido carboxílico intermediário 22 e 6 mg de 4-dimetilaminopiridina foram dissolvidos em 5 ml de diclorometano. Com a agitação em temperatura ambiente, 65 mg de cloridrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodi-imida seguido por 0,17 g de 1,1,1-trifluorometanosulfonamida foram, então, adicionados, e a mistura de reação foi deixada para agitar em temperatura ambiente por 2 h e, então, nessa temperatura por 3 dias. A mistura de reação foi lavada com ácido clorídrico aquoso a 0,5 M, seca e concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica. Isso rendeu 94 mg de acilsulfonamida (81 % de rendimento).

Exemplo I-15

Preparação de (5S)-3-(3,5-difluorofenil)-N-[cis-5-(dimetilaminocarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxamida

e

Exemplo I-16

Preparação de (5S)-3-(3,5-difluorofenil)-N-[cis-5-(metilsulfonilcarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0267] 0,12 g de ácido carboxílico intermediário 22 e 94 mg de 1-hidroxibenzotriazol com 86 % de força foram dissolvidos em 3 ml de diclorometano e agitados em temperatura ambiente por 15 min. 0,16 g de metanosulfonamida foi, então, adicionado, seguido por uma solução de 94 mg de cloridrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodi-imida e 0,09 g de N-etil-N-isopropilpropano-2-amina em 3 ml de diclorometano. A mistura de reação foi agitada em temperatura ambiente por 0,5 h e, então, permitida a repousar por 2 dias. A mistura de reação foi, então, lavada com ácido clorídrico aquoso 0,5 M, seca e concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica. Isso rendeu 43 mg de acilsulfonamida (29 % de rendimento).

Exemplo I-17

Preparação de (5S)-3-(3,5-difluorofenil)-N-[cis-5-(dimetilcarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0268] 97 mg de ácido carboxílico intermediário 22 e 24 mg de 1,1-dimetil-hidrazina foram dissolvidos em 5 ml de diclorometano. Com agitação em temperatura ambiente, 80 mg de trietilamina seguido por 0,51 g de uma solução de anidrido propilfosfônico (50 % de força) em tetra-hidrofurano foram adicionados, e a mistura de reação foi, então, agitada em temperatura ambiente por 4 h. A mistura de reação foi, então, lavada com solução de bicarbonato de sódio aquoso saturado, seca e concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica. Isso rendeu 0,08 g da

dimetil-hidrazida I-15 (73 % de rendimento) e 0,01 g da dimetilamida I-17 (9 % de rendimento).

Exemplo I-18

Preparação de (5S)-N-[cis-5-(ciclopropilcarbamoil)tetra-hidrofuran-3-il]-3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carboxamida

[0269] 93 mg de ácido carboxílico intermediário 22 e 17 mg de ciclopropilamina foram dissolvidos em 5 ml de diclorometano. Com agitação em temperatura ambiente, 77 mg de trietilamina seguido por 0,48 g de uma solução de anidrido propilfosfônico (50 % de força) em tetra-hidrofurano foram adicionados, e a mistura de reação foi, então, agitada em temperatura ambiente por 2,5 h. A mistura de reação foi, então, lavada com solução de bicarbonato de sódio aquoso saturado, seca e concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica. Isso rendeu 95 mg de ciclopropilamida (91 % de rendimento).

Exemplo I-19

Preparação de N-[[cis-4-[[[(5S)-3-(3,5-difluorofenil)-5-vinil-4H-isoxazol-5-carbonil]amino]tetra-hidrofuran-2-carbonil]amino]carbamato de *terc*-butila

[0270] 0,18 g de ácido carboxílico intermediário 22 e 84 mg de 1-hidroxibenzotriazol (86 % de força) foram dissolvidos em 8 ml de diclorometano e agitado em temperatura ambiente por 30 min. 77 mg de hidrazinacarboxilato de *terc*-butila foram, então, adicionados, seguido por uma solução de 141 mg de cloridrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodi-imida e 95 mg de N-etil-N-isopropilpropano-2-amina em 4 ml de

diclorometano. A mistura de reação foi agitada em temperatura ambiente por 0,5 h, permitida a repousar da noite para o dia e agitada em temperatura ambiente por mais 6 h. A mistura de reação foi, então, lavada com ácido clorídrico aquoso 0,5 M, seca e concentrada sob pressão reduzida. O produto bruto foi purificado por meio de cromatografia em gel de sílica. Isso rendeu 112 mg de produto (47 % de rendimento).

Exemplos I-20 a I-30 da Tabela 1

[0271] A preparação foi realizada de modo análogo aos exemplos de preparação dados acima.

[0272] Dados analíticos dos Exemplos I-01 - I-30.

I-01	¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ= 7,717(1,5);7,519(1,0);7,260(176,6);7,193(0,5);7,181(2,9);7,178(1,9);7,175(3,2);7,172(1,8);7,164(1,7);7,161(3,3);7,155(2,8);7,143(0,5);6,996(1,0);6,908(0,5);6,904(0,6);6,902(0,9);6,889(0,7);6,886(1,0);6,883(1,2);6,880(1,7);6,877(0,7);6,875(0,8);6,864(0,5);6,861(0,6);6,859(0,9);6,483(0,5);6,466(0,7);5,299(5,5);4,073(2,4);4,060(2,0);4,049(5,0);4,039(2,9);4,032(2,4);4,026(1,2);4,022(1,3);4,016(0,9);4,014(1,0);3,991(2,7);3,988(3,6);3,967(1,6);3,964(2,1);3,768(2,8);3,758(1,9);3,725(3,3);3,715(2,2);3,201(2,9);3,192(2,0);3,158(2,6);3,149(1,8);2,719(0,6);2,709(1,1);2,699(1,2);2,691(1,3);2,682(0,9);2,414(1,0);2,399(2,0);2,388(1,0);2,383(2,1);2,379(1,6);2,368(2,0);2,360(0,8);2,347(0,8);2,335(0,6);1,720(10,9);1,709(16,0);1,545(3,5);1,259(0,6);0,790(0,6);0,785(0,8);0,781(1,2);0,778(1,9);0,774(1,7);0,772(2,7);0,768(1,6);0,764(1,6);0,760(2,0);0,757(2,0)
------	---

	;0,754(2,2);0,750(1,0);0,743(0,6);0,739(0,6);0,464(0,6);0,461(1,0);0,454(1,2);0,451(2,4);0,448(2,6);0,444(2,4);0,441(1,9);0,438(2,5);0,435(1,8);0,430(1,0);0,421(0,6);0,008(2,4);0,000(80,2);-0,008(2,1)
I-02	¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ= 7,264(29,0);7,174(1,0);7,170(1,6);7,168(1,6);7,165(1,6);7,162(0,8);7,157(0,8);7,154(1,6);7,151(1,6);7,148(1,4);7,145(1,0);6,924(0,6);6,918(0,7);6,913(0,9);6,907(0,9);6,902(0,8);6,897(0,9);6,891(0,9);6,886(1,0);6,880(0,6);6,186(0,9);6,159(1,0);6,142(1,1);6,128(0,8);6,116(1,1);6,101(0,9);6,085(0,9);6,058(1,0);5,532(1,4);5,531(1,5);5,521(1,3);5,519(1,3);5,489(1,3);5,488(1,2);5,478(1,2);5,476(1,2);5,367(1,2);5,340(2,2);5,315(1,1);5,313(1,2);5,300(16,0);4,460(0,6);4,449(0,8);4,437(1,3);4,426(1,2);4,414(0,7);4,403(0,5);4,027(0,7);4,015(0,7);4,004(1,0);3,991(1,0);3,987(0,6);3,975(0,6);3,963(0,9);3,951(0,8);3,934(1,4);3,908(0,5);3,904(0,6);3,891(1,6);3,870(1,6);3,826(2,0);3,322(1,5);3,303(1,3);3,278(1,3);3,260(1,1);2,900(3,4);2,899(3,4);2,888(3,4);2,887(3,3);2,854(3,9);2,853(4,0);2,848(1,0);2,847(1,0);2,841(4,0);2,840(3,8);2,836(1,0);2,835(0,9);2,812(1,5);2,811(1,6);2,799(1,5);2,575(0,5);2,198(0,6);1,978(3,0);0,000(12,6)
I-03	Dois diastereoisômeros estão presentes como uma mistura, os números integrais de sinais definidos são arredondados. ¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ= 8,51 - 8,39 (br, 1 H), 7,21 - 7,14 (m, 2 H), 6,88 - 6,82 (m, 1 H), 4,72 - 4,69 (m, 1 H), 4,63 -

	4,54 (m, 1 H), 4,02 - 3,93 (m, 1 H), 3,89 - 3,67 (m, 3 H), 3,58 - 3,44 (m, 3 H), 3,16 - 2,88 (m, 2 H), 2,34 - 2,20 (m, 2 H), 2,01 - 1,80 (m, 3 H), 1,72 - 1,70 (m, 3 H).
I-04	Dois diastereoisômeros estão presentes como uma mistura, os números integrais de sinais definidos são arredondados. ¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ= 7,20 - 7,13 (m, 2 H), 6,92 - 6,85 (m, 1 H), 6,77 - 6,69 (br, 1 H), 4,49 - 4,34 (m, 2 H), 4,02 - 3,93 (m, 1 H), 3,88 - 3,69 (m, 2 H), 3,20 - 3,05 (m, 1 H), 2,99 - 2,65 (m, 2 H), 2,62 - 2,48 (m, 1 H), 2,26 - 2,08 (m, 1 H), 1,71 - 1,69 (m, 3 H), 0,88 - 0,73 (m, 2 H), 0,65 - 0,47 (m, 2 H).
I-05	¹ H-RMN(499,9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 7,483(3,5);7,469(4,2);7,294(4,8);7,269(11,7);7,254(8,5);7,240(6,2);7,219(14,9);7,205(6,8);4,962(2,7);4,946(2,8);4,830(2,2);4,800(3,5);4,776(2,4);4,551(4,7);4,542(9,5);4,536(6,4);4,526(7,7);4,519(10,5);4,499(2,9);4,457(3,7);4,423(5,8);4,392(3,1);4,111(2,9);4,077(2,4);3,750(4,0);3,714(3,6);3,368(2,0);3,344(3,1);3,320(2,0);3,298(50,8);3,276(0,4);2,923(1,6);2,898(4,4);2,875(7,2);2,844(8,7);2,814(7,7);2,806(7,5);2,784(16,0);2,776(7,7);2,760(2,3);2,753(3,0);2,744(1,3);2,616(2,0);2,502(12,6);2,499(17,3);2,496(13,3);2,084(0,5);1,706(9,0);1,676(9,6);1,647(12,4);1,403(6,2);1,384(5,6);1,352(7,1);1,335(8,5);1,315(8,2);1,298(5,5);1,179(3,5);1,174(3,5);0,000(8,4)
I-06	¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ=

	7,265(29,8);7,200(1,0);7,197(0,7);7,194(1,2);7,191(0,7);7,183(0,7);7,180(1,8);7,178(1,2);7,174(1,7);7,164(0,6);7,160(1,0);7,155(0,8);6,877(0,8);6,861(0,9);6,855(1,6);6,849(0,8);6,833(0,8);6,215(0,8);6,188(1,0);6,186(1,0);6,172(1,0);6,159(1,0);6,145(1,1);6,142(1,1);6,116(1,1);5,593(1,2);5,591(1,2);5,562(1,4);5,560(1,5);5,550(1,1);5,548(1,1);5,519(1,3);5,517(1,3);5,335(1,0);5,333(1,1);5,324(1,2);5,323(1,2);5,308(1,1);5,306(1,2);5,300(16,0);5,298(2,0);5,296(1,4);4,715(1,0);4,707(0,8);4,694(0,7);4,687(1,0);4,601(0,5);4,014(0,7);4,001(0,7);3,991(1,0);3,982(0,8);3,978(1,0);3,969(0,7);3,959(1,0);3,951(0,5);3,946(0,9);3,942(1,7);3,900(1,9);3,888(1,3);3,872(0,6);3,867(0,6);3,845(1,8);3,810(0,5);3,805(0,6);3,712(0,6);3,687(0,8);3,539(1,1);3,534(0,7);3,529(0,6);3,520(1,4);3,514(1,1);3,503(0,8);3,494(0,9);3,480(0,8);3,476(0,7);3,467(0,6);3,462(0,6);3,455(0,6);3,298(1,4);3,294(1,6);3,267(0,6);3,256(1,3);3,251(1,5);2,956(1,1);2,321(0,6);2,313(0,7);2,303(1,5);2,291(1,0);2,284(0,6);2,280(0,6);2,250(0,6);2,050(1,5);2,014(0,7);1,991(0,6);1,987(0,6);1,979(0,8);1,971(0,8);1,964(1,1);1,957(0,8);1,954(0,8);1,950(1,1);1,933(0,7);1,898(0,8);1,882(1,2);1,866(1,2);1,847(0,8);1,778(0,6);1,769(0,7);1,761(1,4);1,753(0,7);1,744(0,5);0,000(12,3)
I-07	¹H-RMN(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,328(1,3);8,314(1,6);8,310(1,6);8,296(1,2);7,910(0,6);7,899(0,8);7,888(0,9);7,864(0,6);7,855(0,8);7,844(0,8);7,419(1,9);7,414(3,9);7,410(2,2);7,405(4,3);7,400(5,6);7,396(6,0);7,388(4,2);7,384(2,0);7,

	380(4,0);7,377(3,5);7,370(0,9);5,756(16,0);4,467(0,6);4,453(1,4);4,439(1,8);4,435(1,6);4,426(0,9);4,422(1,3);4,418(0,9);4,023(1,1);4,016(1,2);4,002(2,5);3,996(2,6);3,981(1,3);3,975(1,4);3,910(0,7);3,902(0,7);3,875(0,5);3,871(0,5);3,856(1,7);3,850(0,8);3,843(0,7);3,840(1,5);3,835(2,0);3,824(1,4);3,818(1,5);3,806(1,6);3,802(1,6);3,793(0,6);3,784(3,6);3,775(2,7);3,747(0,8);3,740(3,1);3,731(3,2);3,703(0,8);3,669(1,6);3,661(0,7);3,653(1,6);3,648(1,5);3,644(1,7);3,632(1,6);3,628(1,8);3,623(1,6);3,617(0,9);3,607(1,8);3,588(1,5);3,575(1,5);3,566(1,3);3,558(0,6);3,553(1,3);3,507(1,4);3,494(1,4);3,486(1,3);3,472(1,2);3,420(0,7);3,404(0,8);3,389(3,1);3,380(2,9);3,359(0,8);3,345(2,8);3,336(3,0);3,320(19,5);3,006(0,6);2,989(0,8);2,985(0,8);2,976(0,8);2,972(0,9);2,954(0,9);2,941(0,7);2,938(0,8);2,933(0,8);2,925(0,8);2,920(0,8);2,917(0,7);2,904(0,6);2,602(0,6);2,594(2,7);2,586(10,1);2,583(3,8);2,574(9,8);2,538(10,5);2,526(11,0);2,520(2,0);2,512(23,8);2,507(53,0);2,502(74,2);2,498(51,2);2,493(22,4);2,452(0,6);2,394(2,3);2,383(2,4);2,366(4,0);2,150(1,1);1,553(15,0);1,541(15,0);1,514(3,7);1,235(1,0);0,000(6,6)
I-08	^1H-RMN(400,0 MHz, d_6-DMSO): δ= 8,293(1,4);8,025(1,0);7,958(1,2);7,839(1,0);7,412(3,2);7,403(4,8);7,397(5,0);7,387(3,7);7,378(3,0);4,534(1,3);4,521(3,1);4,508(1,5);4,440(1,3);4,426(1,9);4,408(1,1);3,999(1,0);3,993(1,1);3,979(2,1);3,972(2,3);3,958(1,1);3,951(1,2);3,894(0,9);3,857(1,6);3,840(1,6);3,835(1,9);3,819(2,3);3,798(1,4);3,7

	82(2,5);3,756(2,4);3,738(2,5);3,712(3,0);3,700(0,9);3,670(1,4);3,654(1,5);3,643(1,6);3,632(1,8);3,626(1,6);3,622(1,7);3,605(1,5);3,599(2,0);3,583(3,3);3,570(3,3);3,566(2,0);3,560(1,6);3,553(2,3);3,538(1,2);3,509(1,1);3,494(1,3);3,487(1,2);3,473(1,2);3,436(1,1);3,430(1,3);3,394(3,2);3,378(2,7);3,367(1,5);3,349(2,4);3,333(4,5);3,316(477,3);3,266(2,6);2,909(0,8);2,892(0,9);2,847(0,9);2,675(3,0);2,670(4,3);2,665(3,0);2,615(2,0);2,606(1,5);2,592(1,6);2,583(1,1);2,574(1,8);2,564(1,7);2,556(2,2);2,546(2,4);2,536(1,5);2,523(10,9);2,519(15,3);2,510(219,7);2,505(486,3);2,501(679,4);2,496(468,6);2,492(204,7);2,455(3,4);2,451(4,1);2,446(3,1);2,401(1,2);2,332(2,7);2,328(4,1);2,323(2,8);2,177(2,9);2,161(5,6);2,144(2,6);2,074(1,2);2,009(0,8);1,990(0,9);1,741(11,8);1,560(3,5);1,549(11,6);1,538(16,0);1,236(1,0);0,980(1,2);0,961(2,4);0,942(1,2);0,614(1,2);0,604(2,0);0,600(2,8);0,588(3,2);0,584(4,7);0,579(3,4);0,571(3,1);0,566(4,0);0,554(2,7);0,549(2,1);0,543(1,7);0,536(1,8);0,530(1,6);0,526(1,5);0,380(1,4);0,368(3,4);0,363(3,5);0,358(4,0);0,346(2,3);0,341(2,3);0,314(0,9);0,301(2,3);0,296(2,5);0,292(2,6);0,286(2,1);0,242(0,8);0,008(1,1);0,000(51,9);-0,008(1,6)
I-09	^1H-RMN(400,0 MHz, CDCl_3): δ= 7,520(1,8);7,280(0,5);7,278(0,6);7,277(0,6);7,276(0,8);7,275(0,8);7,274(0,9);7,274(1,1);7,273(1,2);7,272(1,2);7,271(1,4);7,271(1,4);7,270(1,5);7,269(2,0);7,268(2,4);7,267(2,8);7,266(3,3);7,266(4,0);7,265(5,4);7,264(7,3);7,261(310,2);7,258(4,3);7,257(

2,6);7,256(2,1);7,255(1,5);7,254(1,2);7,254(0,9);7,253(0,8);7,252(0,9);7,251(0,7);7,250(0,5);7,227(0,5);7,211(1,2);7,184(0,8);7,176(2,3);7,170(2,3);7,164(2,9);7,158(3,4);7,150(2,2);7,148(2,5);7,144(3,1);7,138(2,6);7,125(1,0);7,094(0,5);6,997(1,8);6,925(0,8);6,919(0,7);6,913(0,8);6,909(0,9);6,904(1,5);6,897(1,6);6,892(1,7);6,886(0,9);6,882(0,9);6,875(1,2);6,870(1,1);4,652(0,5);4,645(0,6);4,639(0,6);4,572(0,8);4,567(0,7);4,246(0,6);4,239(0,8);4,227(0,7);4,218(1,6);4,205(1,0);4,197(1,0);4,184(1,5);4,163(0,9);4,083(0,6);4,077(0,5);4,062(1,5);4,054(0,7);4,040(1,1);4,027(1,0);4,021(0,5);4,014(1,5);4,005(1,7);3,991(1,8);3,981(1,3);3,968(1,2);3,947(1,1);3,932(1,2);3,926(1,0);3,915(1,2);3,910(1,2);3,899(1,2);3,893(1,0);3,877(1,0);3,833(0,9);3,828(1,0);3,809(0,8);3,804(0,8);3,791(1,1);3,782(3,1);3,767(3,4);3,742(1,8);3,739(3,1);3,733(0,9);3,729(1,5);3,724(3,5);3,710(1,0);3,699(2,4);3,686(1,9);3,669(0,8);3,652(0,6);3,551(0,9);3,538(1,2);3,520(2,0);3,509(1,1);3,503(1,5);3,483(1,4);3,468(1,8);3,450(2,0);3,434(1,0);3,422(1,4);3,404(1,4);3,389(0,9);3,382(1,0);3,372(1,0);3,353(0,9);3,332(0,6);3,313(0,8);3,306(0,7);3,288(0,6);3,220(2,7);3,212(2,6);3,177(2,5);3,169(2,5);3,166(1,7);3,152(1,3);3,123(1,6);3,109(1,8);3,036(0,5);3,031(0,7);2,022(0,6);2,005(1,4);1,990(1,7);1,973(1,4);1,957(0,6);1,927(0,8);1,910(1,3);1,891(1,9);1,874(1,9);1,868(1,8);1,860(2,1);1,842(1,2);1,825(0,6);1,718(15,5);1,715(16,0);1,698(6,4);1,652(6,8);1,255(0,6);0,008(4,0);0,006(1,3);0,005(1,5);0,004(2,1);0,000(138,3);-
--

	0,005(1,2); -0,006(1,0); -0,007(0,8); -0,008(3,7); -0,050(0,6)
I-10	¹ H-RMN(400,6 MHz, CDCl ₃): δ= 9,764(1,2); 9,707(1,3); 7,404(1,4); 7,397(1,6); 7,393(1,6); 7,390(1,7); 7,384(2,1); 7,379(2,0); 7,369(3,1); 7,365(4,8); 7,360(6,5); 7,356(6,0); 7,352(4,6); 7,346(2,0); 7,340(3,2); 7,310(1,3); 7,148(0,6); 7,142(1,1); 7,136(1,1); 7,129(1,1); 7,127(1,1); 7,121(1,7); 7,115(1,2); 7,112(1,2); 7,106(1,0); 7,098(1,0); 4,532(0,7); 4,521(0,9); 4,508(1,2); 4,498(1,8); 4,488(1,7); 4,477(1,8); 4,465(1,5); 4,026(0,7); 4,013(0,8); 4,002(1,2); 3,989(1,1); 3,973(0,7); 3,960(0,7); 3,949(1,3); 3,943(1,4); 3,936(2,0); 3,920(0,8); 3,912(0,7); 3,890(1,2); 3,885(1,1); 3,866(0,8); 3,861(0,8); 3,840(3,0); 3,834(12,0); 3,808(1,2); 3,803(1,5); 3,797(2,3); 3,790(2,3); 3,781(1,2); 3,778(1,5); 3,774(0,9); 3,758(0,7); 3,743(15,7); 3,335(0,8); 3,316(0,8); 3,274(0,9); 3,271(0,9); 3,240(2,5); 3,227(2,5); 3,197(2,2); 3,184(2,2); 2,627(0,5); 2,622(0,7); 2,610(0,7); 2,605(0,8); 2,594(0,8); 2,588(0,9); 2,570(0,9); 2,327(0,6); 2,317(0,7); 2,284(0,5); 2,239(0,6); 1,713(1,1); 1,707(2,2); 1,702(1,9); 1,693(15,1); 1,689(16,0); 1,287(0,6); 1,259(2,8); 0,000(0,9)
I-11	¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ= 8,80 (br d, J=4,13 Hz, 1 H), 7,20 - 7,13 (m, 2 H), 7,00 - 6,93 (m, 1 H), 6,92 - 6,85 (m, 1 H), 6,19 - 6,06 (m, 1 H), 5,51 (dd, J=17,17, 1,91 Hz, 1 H), 5,34 (dd, J=10,65, 8,42 Hz, 1 H), 4,54 - 4,41 (m, 2 H), 4,18 (sept, J=6,04 Hz, 1 H), 4,05 - 3,96 (m, 1 H), 3,93 - 3,77 (m, 2 H), 3,34 - 3,26 (m, 1 H), 2,71 - 2,58 (m, 1 H), 2,22 - 2,13 (m, 1

	H), 1,32 - 1,22 (m, 6 H)
I-12	¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 8,93 (br d, J=7,31 Hz, 1 H), 7,20 - 7,13 (m, 2 H), 7,00 - 6,93 (m, 1 H), 6,93 - 6,85 (m, 1 H), 6,20 - 6,06 (m, 1 H), 5,51 (dd, J=17,32, 3,66 Hz, 1 H), 5,34 (dd, J=10,33, 8,42 Hz, 1 H), 4,54 - 4,41 (m, 2 H), 4,08 - 3,95 (m, 3 H), 3,93 - 3,79 (m, 2 H), 3,34 - 3,27 (m, 1 H), 2,69 - 2,56 (m, 1 H), 2,25 - 2,17 (m, 1 H), 1,34 - 1,24 (m, 3 H)
I-13	¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 9,01 (br d, J=10,49 Hz, 1 H), 7,20 - 7,12 (m, 2 H), 7,02 - 6,94 (m, 1 H), 6,93 - 6,85 (m, 1 H), 6,19 - 6,07 (m, 1 H), 5,51 (dd, J=17,33, 4,29 Hz, 1 H), 5,35 (dd, J=10,65, 8,11 Hz, 1 H), 4,55 - 4,41 (m, 2 H), 4,03 - 3,95 (m, 1 H), 3,94 - 3,79 (m, 5 H), 3,34 - 3,26 (m, 1 H), 2,68 - 2,55 (m, 1 H), 2,27 - 2,19 (m, 1 H).
I-14	¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8,339(1,3);8,319(1,5);8,313(1,7);8,293(1,5);7,445(0,8);7,428(5,5);7,422(3,9);7,416(3,3);7,410(5,0);7,406(5,3);7,392(2,0);7,386(3,2);7,381(2,1);7,369(0,7);7,364(1,3);7,358(0,9);6,158(2,0);6,152(2,6);6,132(2,3);6,126(2,9);6,115(2,3);6,109(3,1);6,088(2,3);6,082(3,0);5,753(3,3);5,411(3,4);5,408(3,6);5,404(2,9);5,402(3,0);5,368(3,0);5,365(3,2);5,361(2,5);5,358(2,7);5,316(0,7);5,304(2,7);5,301(2,8);5,298(3,4);5,296(3,2);5,289(0,7);5,277(2,6);5,275(2,6);5,271(3,2);5,269(3,0);4,346(1,2);4,326(1,1);4,313(1,0);4,306(1,0);4,292(0,8);4,171(1,7);4,158(2,5);4,149(2,3);4,146(2,0);4,136(2,1);4,125(1,4);3,893(

	15,9);3,881(16,0);3,864(9,4);3,836(7,4);3,820(5,8);3,814(4,7);3,800(3,8);3,793(2,9);3,778(2,3);3,666(0,6);3,646(0,5);3,633(2,0);3,627(1,8);3,622(1,8);3,614(1,9);3,606(1,4);3,601(1,5);3,594(1,2);3,574(1,0);3,558(5,2);3,529(0,7);3,514(4,0);2,674(1,9);2,670(2,6);2,665(1,8);2,661(0,9);2,523(11,0);2,519(15,3);2,510(144,2);2,505(295,0);2,501(402,4);2,496(275,2);2,492(123,6);2,387(1,0);2,366(0,9);2,354(0,9);2,347(0,9);2,337(1,8);2,332(2,7);2,328(3,2);2,323(2,0);2,314(0,8);2,308(0,9);2,288(0,5);1,827(0,6);1,813(1,5);1,800(1,8);1,780(1,4);1,767(1,5);1,755(0,6);1,236(1,0);0,008(3,1);0,000(95,5);-0,008(2,9)
I-15	¹H-RMN(400,0 MHz, CDCl₃): δ= 7,263(36,9);7,174(0,5);7,170(1,1);7,162(1,5);7,156(1,4);7,153(1,3);7,150(1,3);7,144(1,3);7,142(1,3);7,137(1,0);6,921(0,7);6,915(0,8);6,912(0,7);6,906(0,8);6,900(0,8);6,894(0,8);6,890(0,7);6,884(0,9);6,878(0,6);6,182(0,8);6,155(0,9);6,138(1,0);6,128(0,7);6,112(1,0);6,102(0,7);6,085(0,8);6,058(0,8);5,529(1,2);5,528(1,3);5,517(1,5);5,486(1,1);5,485(1,1);5,474(1,2);5,370(1,3);5,344(1,8);5,319(1,1);4,456(0,7);4,443(1,1);4,432(1,0);4,429(1,1);4,419(1,0);4,405(0,7);4,148(0,6);4,131(1,9);4,113(1,9);4,095(0,6);4,020(0,7);4,007(0,7);3,996(0,9);3,983(1,1);3,972(0,6);3,961(0,8);3,948(0,8);3,937(1,3);3,894(1,6);3,882(1,9);3,839(1,6);3,834(0,6);3,327(1,4);3,314(1,3);3,284(1,2);3,271(1,1);2,668(0,5);2,654(15,4);2,645(1,2);2,634(16,0);2,621(0,5);2,610(0,7);2,548(1,0);2,532(0,5);2,044(8,4);1,603(1,0);1,277

	(2,4);1,259(5,6);1,241(2,3);0,008(0,5);0,000(13,7)
I-16	¹ H-RMN(400,0 MHz, CDC13): δ= 8,922(0,9);7,518(2,7);7,295(0,5);7,260(481,5);7,208(1,0);7,181(1,5);7,176(1,8);7,162(2,2);7,144(1,7);7,138(1,4);6,996(2,6);6,919(0,9);6,914(0,7);6,903(0,8);6,897(1,6);6,892(1,5);6,876(0,8);6,870(0,7);6,800(1,0);6,170(1,2);6,143(2,4);6,127(1,3);6,116(1,3);6,100(2,9);6,073(1,6);5,540(2,0);5,527(2,2);5,497(1,7);5,483(2,0);5,379(3,7);5,352(3,5);4,541(1,0);4,529(1,2);4,518(1,6);4,508(1,2);4,496(0,9);4,434(0,7);4,092(0,9);4,079(0,9);4,067(1,9);4,054(1,7);4,042(1,4);4,029(1,2);3,978(0,9);3,969(0,8);3,954(0,6);3,931(0,8);3,925(0,9);3,916(2,2);3,899(2,5);3,873(2,4);3,856(2,3);3,492(1,7);3,376(16,0);3,350(14,7);3,331(2,2);3,328(2,2);3,288(2,0);3,284(1,9);2,699(0,6);2,682(0,7);2,661(0,7);2,641(0,8);2,621(0,6);2,314(0,7);2,261(0,6);2,225(0,5);1,548(13,3);1,256(1,3);1,242(0,6);0,008(5,3);0,000(176,6);-0,008(5,2);-0,150(0,6)
I-17	¹ H-RMN(400,6 MHz, CDC13): δ= 8,303(0,5);8,282(0,9);8,261(0,5);7,271(4,1);7,205(1,4);7,199(1,7);7,188(1,2);7,185(1,9);7,179(2,8);7,174(2,0);7,162(1,2);7,160(1,8);7,154(1,4);6,888(0,7);6,883(1,2);6,877(0,6);6,867(1,4);6,861(2,3);6,855(1,2);6,845(0,7);6,839(1,2);6,833(0,6);6,213(1,2);6,186(1,4);6,180(1,2);6,170(1,4);6,153(1,3);6,143(1,5);6,137(1,4);6,110(1,4);5,594(1,9);5,593(2,0);5,551(3,6);5,510(1,6);5,508(1,6);5,342(2,0);5,341(2,0);5,323(1,8);5,322(1,8);5,316(1,8);5,314(1,8);5,297(1,6);5,296(1,6);4,850(1,7);4,843(1,6);4,829

	(2,0);4,822(1,7);4,586(0,7);4,581(0,7);4,573(0,8);4,568(1,1);4,562(0,9);4,555(0,8);4,549(0,7);4,010(1,0);3,998(1,1);3,988(2,2);3,975(2,2);3,965(1,4);3,952(1,4);3,941(2,1);3,898(2,4);3,883(2,2);3,845(1,1);3,840(3,4);3,822(0,7);3,818(0,7);3,793(1,0);3,788(0,9);3,770(0,8);3,765(0,7);3,304(4,4);3,261(3,8);3,137(14,7);3,133(16,0);3,027(0,5);3,002(14,1);2,992(13,2);2,357(0,8);2,352(1,3);2,331(0,8);2,322(0,8);2,314(1,8);2,311(1,7);2,308(1,5);2,293(1,1);2,291(1,2);2,288(1,0);2,270(0,8);2,045(2,1);1,853(1,0);1,334(0,9);1,286(1,5);1,277(1,0);1,256(4,5);1,242(0,9);0,880(0,8);0,000(3,1)
I-18	¹H-RMN(400,0 MHz, CDCl₃): δ= 7,519(2,5);7,315(0,8);7,260(401,6);7,258(381,2);7,170(16,6);7,155(17,2);6,996(2,3);6,883(6,9);6,863(9,3);6,845(7,2);6,719(4,5);6,693(5,1);6,180(3,8);6,153(4,1);6,135(7,3);6,108(7,9);6,089(4,4);6,064(4,4);5,532(12,0);5,489(10,4);5,372(8,6);5,346(13,4);5,322(8,8);4,448(3,4);4,422(7,0);4,405(8,8);4,399(9,3);4,371(4,7);4,002(3,8);3,990(3,8);3,978(5,9);3,966(9,0);3,954(4,3);3,942(5,4);3,927(9,7);3,879(16,0);3,859(4,3);3,835(9,4);3,812(5,4);3,790(4,0);3,322(9,3);3,307(8,8);3,278(7,9);3,264(7,7);2,786(2,8);2,776(4,0);2,768(4,6);2,760(4,5);2,752(4,6);2,744(4,8);2,735(4,7);2,727(3,1);2,632(1,9);2,615(4,1);2,597(5,1);2,591(5,0);2,581(5,3);2,574(5,4);2,557(5,0);2,538(2,4);2,196(3,5);2,161(6,4);2,125(3,3);1,548(100,8);1,333(1,1);1,283(1,5);1,256(4,6);0,879(1,6);0,843(3,0);0,827(9,9);0,808(13,3);0,787(8,2);0,617(11,2);0,601(4,7);0,591(6,6);0,581(5,7);

	0,563(5,8);0,000(138,7);-0,002(131,1);-0,152(0,8)
I-19	¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ= 8,214(1,2);8,106(1,4);7,518(2,9);7,293(1,2);7,260(529,3);7,227(1,7);7,221(2,0);7,208(2,6);7,188(2,3);7,182(2,6);7,168(2,6);7,163(2,2);6,996(3,2);6,916(1,7);6,900(1,8);6,895(3,0);6,888(1,6);6,873(1,5);6,171(1,7);6,158(1,5);6,145(2,0);6,128(2,2);6,115(1,8);6,101(1,9);6,088(1,8);5,538(3,0);5,529(3,3);5,494(2,6);5,487(2,8);5,359(4,2);5,332(3,8);4,580(1,4);4,437(1,5);4,049(0,9);4,037(0,9);4,025(1,9);4,013(2,0);3,997(2,1);3,984(2,1);3,968(2,5);3,928(3,1);3,924(3,3);3,885(3,0);3,324(2,9);3,295(2,8);3,281(2,6);3,252(2,6);2,553(0,7);2,447(1,1);2,424(0,9);2,410(0,8);2,364(1,1);2,044(1,5);1,541(30,8);1,507(52,0);1,500(32,6);1,464(1,0);1,266(9,4);0,899(4,9);0,882(16,0);0,864(6,2);0,146(1,0);0,008(6,7);0,000(193,0);-0,008(6,3)
I-20	¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ= 7,5193 (0,6); 7,2604 (100,9); 7,1884 (0,7); 7,1762 (1,8); 7,1698 (2,6); 7,1635 (2,2); 7,1601 (2,0); 7,1565 (2,2); 7,1503 (2,4); 7,1438 (1,6); 7,0179 (1,0); 6,9965 (1,4); 6,9101 (0,9); 6,9045 (0,9); 6,8940 (0,8); 6,8884 (1,9); 6,8829 (1,8); 6,8773 (0,7); 6,8667 (0,9); 6,8611 (0,9); 6,1799 (1,2); 6,1531 (1,3); 6,1367 (1,5); 6,1321 (1,2); 6,1100 (1,5); 6,1053 (1,4); 6,0889 (1,4); 6,0621 (1,5); 5,5268 (2,0); 5,5255 (2,0); 5,5113 (2,3); 5,4837 (1,8); 5,4824 (1,7); 5,4680 (1,9); 5,3594 (2,1); 5,3440 (1,9); 5,3326 (2,0); 5,3173 (1,8); 4,4620 (0,9); 4,4432 (1,6); 4,4327 (1,3); 4,4199

	(1,7); 4,4091 (1,8); 4,3969 (1,0); 4,3858 (0,8); 4,0356 (0,9); 4,0228 (0,9); 4,0117 (1,4); 4,0034 (1,1); 3,9990 (1,3); 3,9909 (0,9); 3,9794 (1,4); 3,9669 (1,2); 3,9270 (2,1); 3,9098 (0,9); 3,9031 (0,9); 3,8840 (3,2); 3,8778 (3,5); 3,8522 (0,6); 3,8478 (0,6); 3,8348 (2,5); 3,7243 (16,0); 3,7111 (15,6); 3,6112 (1,2); 3,6027 (0,5); 3,5953 (1,3); 3,5871 (1,4); 3,5716 (1,8); 3,5609 (1,1); 3,5562 (1,3); 3,5463 (1,0); 3,5385 (0,8); 3,3163 (2,2); 3,3043 (2,2); 3,2733 (1,9); 3,2613 (1,9); 2,6165 (2,4); 2,6103 (1,4); 2,6011 (4,7); 2,5938 (2,6); 2,5860 (2,3); 2,5787 (1,4); 2,5639 (0,7); 2,5592 (0,9); 2,5536 (0,7); 2,5418 (0,8); 2,5363 (0,7); 2,2238 (0,6); 2,1888 (0,5); 2,1623 (0,6); 2,1280 (0,5); 1,5572 (6,4); 1,2563 (1,1); 0,0079 (1,2); -0,0002 (33,7); -0,0085 (1,1)
I-21	¹H-RMN(400,0 MHz, CDCl₃): δ= 7,2608 (68,6); 7,1807 (0,5); 7,1751 (0,8); 7,1685 (2,1); 7,1626 (3,6); 7,1571 (3,1); 7,1529 (2,8); 7,1484 (3,0); 7,1428 (4,0); 7,1371 (2,4); 7,1245 (0,8); 7,0700 (0,6); 7,0533 (0,6); 7,0156 (0,6); 6,9967 (0,9); 6,9102 (0,9); 6,9049 (0,9); 6,8938 (0,8); 6,8885 (1,8); 6,8832 (1,7); 6,8777 (0,7); 6,8668 (0,9); 6,8616 (0,9); 6,1800 (1,2); 6,1532 (1,3); 6,1368 (1,5); 6,1325 (1,3); 6,1100 (1,6); 6,1057 (1,4); 6,0893 (1,4); 6,0625 (1,5); 5,5114 (2,2); 5,5018 (2,4); 5,4690 (1,9); 5,4588 (2,1); 5,3527 (2,3); 5,3259 (4,2); 5,2990 (1,9); 4,5138 (0,9); 4,5037 (1,0); 4,4891 (1,5); 4,4783 (1,9); 4,4710 (0,7); 4,4646 (1,7); 4,4607 (1,2);

	4,4541 (2,0); 4,4479 (1,2); 4,4420 (1,0); 4,4367 (0,8); 4,4307 (0,6); 4,1635 (0,8); 4,1487 (0,8); 4,1380 (1,8); 4,1242 (1,8); 4,1176 (1,6); 4,1092 (1,7); 4,1027 (1,6); 4,0953 (1,7); 4,0798 (1,0); 4,0669 (1,0); 4,0557 (1,5); 4,0497 (0,6); 4,0428 (1,4); 4,0174 (1,8); 4,0044 (1,6); 3,9944 (1,6); 3,9823 (1,6); 3,9700 (1,6); 3,9580 (0,8); 3,9502 (0,7); 3,9409 (2,5); 3,9288 (1,0); 3,9250 (1,0); 3,8979 (2,9); 3,8705 (2,2); 3,8275 (2,6); 3,8001 (16,0); 3,7868 (15,7); 3,3070 (2,4); 3,2866 (2,3); 3,2639 (2,0); 3,2436 (2,0); 2,6322 (0,5); 2,6156 (0,5); 2,6087 (0,5); 2,5978 (0,7); 2,5917 (0,6); 2,5808 (0,6); 2,5739 (0,7); 2,5569 (0,7); 2,5539 (0,6); 2,5472 (0,5); 2,5360 (0,7); 2,5305 (0,6); 2,5192 (0,6); 2,5127 (0,6); 2,4959 (0,6); 2,2739 (1,1); 2,2666 (1,2); 2,2392 (0,9); 2,2321 (0,9); 1,5678 (1,1); 1,2583 (0,9); 0,0079 (0,9); -0,0002 (22,3); -0,0085 (0,6)
I-22	¹H-RMN(400,0 MHz, CDC13): δ= 7,5193 (0,6); 7,2605 (104,8); 7,2594 (101,9); 7,2228 (2,2); 7,2086 (1,5); 7,1842 (2,0); 7,1701 (4,3); 7,1659 (4,7); 7,1520 (7,7); 7,1384 (4,6); 6,9958 (0,6); 6,9514 (1,3); 6,9334 (1,4); 6,8996 (1,4); 6,8922 (1,8); 6,8861 (2,4); 6,8822 (2,4); 6,8777 (2,4); 6,8717 (1,8); 6,8653 (1,4); 6,1851 (1,6); 6,1589 (1,7); 6,1424 (1,8); 6,1300 (1,6); 6,1156 (2,0); 6,1034 (1,8); 6,0871 (1,9); 6,0601 (2,0); 5,5101 (4,2); 5,5046 (4,2); 5,4669 (3,6); 5,4615 (3,8); 5,3541 (3,6); 5,3266 (6,0); 5,2986 (3,5); 4,4793 (2,3); 4,4734 (2,1); 4,4671 (2,0);

	4,4120 (1,8); 4,4009 (2,5); 4,3947 (2,5); 4,3886 (3,0); 4,3776 (3,1); 4,3711 (3,7); 4,3527 (2,3); 4,3353 (1,9); 4,3187 (0,9); 4,2141 (0,9); 4,2043 (1,2); 4,1967 (2,6); 4,1858 (4,2); 4,1790 (3,2); 4,1680 (7,4); 4,1502 (6,0); 4,1324 (2,0); 4,0309 (1,2); 4,0173 (1,3); 4,0072 (3,8); 3,9945 (3,7); 3,9842 (2,3); 3,9713 (2,1); 3,9575 (2,4); 3,9521 (2,4); 3,9337 (1,4); 3,9209 (3,4); 3,8839 (3,5); 3,8778 (4,1); 3,8415 (5,4); 3,8249 (1,5); 3,8186 (1,5); 3,3108 (5,7); 3,2676 (4,9); 2,6780 (1,2); 2,6649 (1,3); 2,6401 (2,4); 2,6273 (2,3); 2,6194 (1,2); 2,6139 (1,3); 2,6029 (1,3); 2,5955 (1,3); 2,5845 (2,0); 2,5736 (1,5); 2,5553 (7,3); 2,5416 (6,4); 2,5297 (3,3); 2,5150 (2,5); 2,4914 (1,5); 2,4772 (1,4); 2,1670 (2,1); 2,1415 (1,9); 2,1330 (2,0); 1,9583 (0,9); 1,5574 (5,4); 1,3281 (9,5); 1,3104 (14,3); 1,2918 (12,0); 1,2850 (8,0); 1,2729 (7,6); 1,2671 (12,9); 1,2493 (16,0); 1,2326 (10,6); -0,0002 (38,6); -0,0015 (37,8)
I-23	¹H-RMN(400,0 MHz, CDCl₃): δ = 8,9621 (1,0); 7,5207 (2,6); 7,2955 (0,6); 7,2862 (0,8); 7,2619 (459,9); 7,1725 (1,8); 7,1668 (2,2); 7,1527 (2,6); 7,1471 (2,1); 7,1352 (0,7); 6,9978 (2,5); 6,9156 (0,8); 6,8995 (0,8); 6,8939 (1,5); 6,8721 (1,1); 6,8525 (0,7); 4,5515 (1,0); 4,5405 (1,0); 4,5285 (1,1); 4,5168 (1,1); 4,4210 (0,8); 4,4138 (0,8); 4,0623 (1,0); 4,0489 (0,9); 4,0378 (1,3); 4,0249 (1,3); 3,9220 (0,9); 3,9143 (0,9); 3,8967 (0,7); 3,8904 (0,7); 3,7760 (2,6); 3,7591 (0,5); 3,7327 (3,0); 3,7157 (0,7); 3,3935

	(13,3); 3,3551 (3,1); 3,2023 (3,1); 3,1589 (2,7); 2,6827 (0,6); 2,6663 (0,6); 2,6590 (0,6); 2,6481 (0,7); 2,6429 (0,7); 2,6315 (0,6); 2,6247 (0,7); 2,6082 (0,6); 2,3659 (0,8); 2,3307 (0,6); 1,7042 (4,1); 1,6963 (16,0); 1,5537 (39,0); 1,3330 (1,6); 1,2844 (2,4); 1,2541 (6,3); 0,8799 (0,9); 0,1458 (0,6); 0,0080 (5,5); -0,0002 (199,1); -0,0085 (6,8); -0,1498 (0,6)
I-24	¹ H-RMN(400,6 MHz, CDCl ₃): δ = 9,5455 (1,6); 9,4925 (1,5); 7,2954 (2,3); 7,2765 (0,9); 7,2510 (0,7); 7,1743 (0,5); 7,1618 (2,9); 7,1564 (3,8); 7,1420 (3,8); 7,1367 (3,0); 7,1302 (0,6); 7,1243 (0,6); 6,9029 (0,9); 6,8969 (0,9); 6,8872 (0,8); 6,8812 (1,8); 6,8753 (1,8); 6,8693 (0,8); 6,8658 (0,6); 6,8595 (1,0); 6,8536 (0,9); 4,5375 (0,6); 4,5267 (0,8); 4,5138 (0,9); 4,5039 (1,4); 4,4931 (1,3); 4,4819 (1,5); 4,4705 (1,5); 4,0333 (0,7); 4,0204 (0,8); 4,0097 (1,1); 3,9968 (1,0); 3,9845 (0,7); 3,9717 (0,7); 3,9606 (1,1); 3,9479 (1,0); 3,9325 (1,0); 3,9258 (1,0); 3,9090 (0,6); 3,9022 (0,6); 3,8828 (1,0); 3,8776 (1,0); 3,8589 (0,8); 3,8523 (0,9); 3,8420 (11,4); 3,8184 (1,8); 3,7751 (2,1); 3,7668 (2,8); 3,7608 (16,0); 3,7237 (2,2); 3,2105 (2,2); 3,1989 (2,6); 3,1671 (1,9); 3,1556 (2,3); 2,6245 (0,5); 2,6141 (0,6); 2,6080 (0,6); 2,5978 (0,8); 2,5900 (0,7); 2,5732 (0,6); 2,3252 (0,6); 2,2563 (0,6); 2,0502 (0,9); 1,6956 (15,4); 1,6893 (15,1); 1,2612 (1,4); 1,2572 (1,9); -0,0002 (0,8)
I-25	¹ H-RMN(400,6 MHz, CDCl ₃):

	$\delta = 7,2724 (4,6); 7,2001 (1,3); 7,1944 (1,6);$ $7,1912 (0,9); 7,1838 (1,1); 7,1800 (1,7); 7,1742$ $(1,6); 7,1720 (1,7); 7,1662 (1,8); 7,1629 (1,2);$ $7,1550 (1,0); 7,1518 (1,7); 7,1462 (1,4); 6,8826$ $(0,7); 6,8768 (1,2); 6,8710 (0,6); 6,8609 (1,3);$ $6,8551 (2,3); 6,8492 (1,2); 6,8391 (0,7); 6,8333$ $(1,2); 6,8275 (0,6); 4,8488 (1,8); 4,8418 (1,6);$ $4,8284 (1,8); 4,8211 (1,8); 4,5763 (0,5); 4,5692$ $(0,5); 4,5628 (0,7); 4,5566 (0,7); 4,5500 (0,6);$ $4,5439 (0,7); 4,1485 (0,6); 4,1307 (1,8); 4,1128$ $(1,8); 4,0950 (0,6); 4,0199 (1,0); 4,0074 (1,1);$ $3,9970 (1,4); 3,9845 (1,3); 3,9751 (1,1); 3,9623$ $(1,1); 3,9520 (1,4); 3,9393 (1,3); 3,8636 (0,9);$ $3,8584 (0,8); 3,8407 (0,7); 3,8355 (0,6); 3,8049$ $(2,2); 3,7621 (3,1); 3,7472 (2,4); 3,7427 (0,8);$ $3,7368 (0,7); 3,7044 (2,6); 3,1654 (2,6); 3,1615$ $(2,7); 3,1415 (14,8); 3,1346 (16,0); 3,1225 (2,4);$ $3,1187 (2,4); 2,9966 (15,0); 2,9905 (14,2); 2,3855$ $(0,6); 2,3809 (0,9); 2,3765 (0,6); 2,3427 (0,8);$ $2,3247 (0,8); 2,3220 (0,8); 2,3091 (1,1); 2,3018$ $(2,0); 2,2964 (0,7); 2,2912 (0,6); 2,2878 (0,6);$ $2,2849 (1,0); 2,2822 (1,0); 2,2649 (0,8); 2,1269$ $(0,7); 2,1252 (0,7); 2,0455 (8,6); 1,7186 (13,2);$ $1,6887 (12,7); 1,4304 (0,6); 1,4163 (0,6); 1,3345$ $(0,5); 1,2856 (0,8); 1,2776 (2,7); 1,2598 (6,6);$ $1,2420 (2,5); 0,8802 (0,6); -0,0002 (3,0)$
I-26	$^1\text{H-RMN}(400,6 \text{ MHz, CDCl}_3):$ $\delta = 7,3193 (0,9); 7,1666 (1,1); 7,1605 (1,9);$ $7,1572 (1,5); 7,1547 (1,6); 7,1511 (1,3); 7,1466$ $(1,4); 7,1441 (1,4); 7,1407 (2,0); 7,1349 (1,2);$

	7,0893 (0,6); 6,9034 (0,6); 6,8957 (0,5); 6,8896 (0,8); 6,8818 (1,0); 6,8757 (0,6); 6,8600 (0,5); 4,4759 (0,9); 4,4644 (1,0); 4,4523 (0,9); 4,4434 (1,0); 4,4413 (1,0); 4,4307 (0,8); 4,4206 (0,7); 4,4075 (0,6); 4,1305 (1,3); 4,1127 (1,3); 4,0416 (0,6); 4,0285 (0,7); 4,0180 (1,0); 4,0049 (0,8); 3,9932 (0,6); 3,9804 (0,6); 3,9693 (0,8); 3,9566 (0,8); 3,9046 (0,5); 3,8976 (0,5); 3,8144 (1,5); 3,7711 (1,4); 3,7617 (1,4); 3,7184 (1,6); 3,2169 (1,5); 3,2000 (1,3); 3,1735 (1,5); 3,1567 (1,1); 2,6648 (14,5); 2,6486 (0,6); 2,6363 (16,0); 2,6143 (0,6); 2,6108 (0,5); 2,6081 (0,6); 2,5741 (1,7); 2,5497 (0,6); 2,1183 (0,5); 2,0718 (0,6); 2,0470 (6,1); 1,6956 (13,2); 1,2782 (1,8); 1,2604 (4,0); 1,2425 (1,7); -0,0002 (0,5)
I-27	¹H-RMN(400,6 MHz, CDCl₃): δ = 8,8097 (1,6); 8,8075 (1,6); 8,7461 (1,5); 8,7438 (1,5); 8,0732 (0,8); 8,0589 (0,9); 7,9541 (1,8); 7,9503 (1,9); 7,9374 (1,6); 7,9336 (1,6); 7,2999 (1,3); 7,1780 (0,9); 7,1718 (0,9); 7,1604 (1,0); 7,1145 (1,4); 7,1089 (1,8); 7,1059 (1,1); 7,0979 (1,0); 7,0947 (1,8); 7,0891 (1,5); 6,9942 (1,2); 6,9886 (1,6); 6,9855 (1,0); 6,9777 (0,9); 6,9745 (1,6); 6,9689 (1,3); 6,8962 (0,6); 6,8803 (0,7); 6,8745 (1,2); 6,8687 (0,6); 6,8588 (0,5); 6,8531 (0,9); 6,8387 (0,7); 6,8329 (1,1); 6,8271 (0,5); 6,8112 (0,6); 4,8504 (0,7); 4,8364 (0,8); 4,7851 (0,7); 4,7715 (0,7); 4,7592 (0,7); 4,7478 (0,7); 4,6661 (0,7); 4,6553 (0,8); 4,6033 (0,8); 4,5945 (0,9); 4,5794 (0,8); 4,5709 (0,8); 4,5595

	(0,8); 4,5498 (0,9); 4,5359 (0,9); 4,5262 (0,9); 4,5050 (0,6); 4,4993 (0,5); 4,4942 (0,6); 4,4877 (0,6); 4,4788 (0,6); 4,4734 (0,6); 4,4684 (0,5); 4,4621 (0,5); 4,1468 (1,2); 4,1290 (3,6); 4,1112 (3,6); 4,1028 (2,0); 4,0917 (3,2); 4,0848 (1,5); 4,0567 (1,7); 4,0454 (1,8); 4,0364 (1,2); 3,7225 (2,0); 3,7118 (2,3); 3,6793 (2,3); 3,6686 (2,6); 3,1364 (2,4); 3,0967 (2,3); 3,0932 (2,4); 3,0535 (1,9); 2,6157 (0,6); 2,5998 (0,9); 2,5950 (0,6); 2,5921 (0,6); 2,5840 (0,7); 2,5812 (0,8); 2,5760 (0,9); 2,5644 (0,7); 2,5605 (0,7); 2,5577 (0,7); 2,5409 (0,5); 2,4130 (0,7); 2,3006 (0,6); 2,2661 (0,5); 2,1363 (0,9); 2,1075 (0,6); 2,0440 (16,0); 1,6123 (11,4); 1,5944 (12,6); 1,2769 (4,5); 1,2591 (9,7); 1,2412 (4,3); -0,0002 (0,7)
I-28	¹H-RMN(400,0 MHz, CDCl₃): δ= 7,5186 (1,7); 7,3091 (1,1); 7,2917 (0,6); 7,2870 (0,5); 7,2719 (1,4); 7,2597 (290,5); 7,2108 (0,8); 7,1834 (0,6); 7,1774 (0,7); 7,1708 (1,8); 7,1652 (3,4); 7,1598 (3,0); 7,1553 (2,0); 7,1508 (2,6); 7,1454 (3,3); 7,1398 (1,8); 7,1331 (0,7); 7,1273 (0,5); 6,9957 (1,8); 6,9048 (1,1); 6,8859 (2,2); 6,8830 (2,1); 6,8772 (1,4); 6,8701 (1,3); 6,8640 (1,6); 6,8614 (1,5); 4,5156 (1,1); 4,5020 (1,6); 4,4927 (1,3); 4,4862 (1,3); 4,4788 (1,8); 4,4635 (1,2); 4,4239 (1,0); 4,4149 (1,0); 4,1207 (1,0); 4,1064 (1,0); 4,0966 (1,4); 4,0825 (1,2); 4,0733 (1,1); 4,0596 (1,0); 4,0492 (1,4); 4,0354 (1,2); 3,9396 (0,9); 3,9295 (0,9); 3,9153 (0,8); 3,9057 (0,8); 3,8876 (0,9); 3,8807 (0,9); 3,8646

	(0,8); 3,8554 (0,8); 3,7763 (2,4); 3,7593 (2,3); 3,7331 (2,8); 3,7161 (2,7); 3,5188 (0,6); 3,5007 (1,3); 3,4897 (1,2); 3,4825 (1,8); 3,4793 (2,0); 3,4720 (1,6); 3,4653 (2,7); 3,4616 (2,4); 3,4506 (1,3); 3,4472 (1,3); 3,4431 (1,8); 3,4260 (1,0); 3,1963 (2,8); 3,1936 (3,0); 3,1531 (2,5); 3,1504 (2,7); 2,7050 (0,5); 2,6998 (0,6); 2,6868 (0,6); 2,6828 (1,0); 2,6767 (0,6); 2,6708 (0,7); 2,6649 (1,2); 2,6597 (0,7); 2,6482 (1,2); 2,6424 (0,7); 2,6301 (0,6); 2,6253 (0,7); 2,3054 (0,8); 2,2925 (0,7); 2,2837 (1,0); 2,2709 (0,7); 2,2604 (0,9); 2,2466 (1,5); 2,1944 (2,8); 2,1809 (0,7); 2,1470 (0,6); 2,1326 (0,6); 1,9610 (0,6); 1,9506 (0,8); 1,9401 (1,1); 1,9321 (1,6); 1,9207 (1,4); 1,9135 (1,9); 1,8926 (1,4); 1,8741 (0,9); 1,7018 (14,9); 1,6984 (16,0); 1,5592 (1,1); 1,5035 (0,9); 1,3329 (0,6); 1,2843 (1,0); 1,2562 (3,6); 1,2133 (0,7); 1,1942 (0,5); 1,1206 (4,0); 1,1144 (4,0); 1,1020 (8,3); 1,0958 (8,0); 1,0833 (3,8); 1,0771 (3,7); 0,9470 (0,6); 0,9284 (1,2); 0,9101 (0,6); 0,8802 (0,9); 0,0079 (3,7); -0,0002 (132,2); -0,0085 (4,6)
I-29	¹H-RMN(400,0 MHz, CDCl₃): δ = 7,5188 (1,6); 7,3096 (0,8); 7,2599 (281,0); 7,2101 (0,8); 7,1813 (2,0); 7,1731 (3,2); 7,1672 (3,1); 7,1619 (3,1); 7,1562 (3,3); 7,1480 (2,1); 6,9959 (2,0); 6,9141 (1,1); 6,9086 (1,2); 6,8981 (1,1); 6,8926 (2,2); 6,8871 (2,1); 6,8817 (1,0); 6,8767 (0,8); 6,8708 (1,4); 6,8655 (1,4); 6,8596 (1,1); 6,8305 (1,3); 6,1736 (1,3); 6,1472 (2,0);

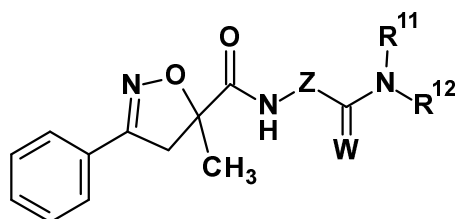
6,1305 (1,6); 6,1218 (1,4); 6,1041 (2,2); 6,0786 (1,5); 5,5442 (2,3); 5,5356 (2,9); 5,5011 (2,1); 5,4925 (2,5); 5,3800 (2,5); 5,3728 (2,3); 5,3534 (2,4); 5,3460 (2,2); 4,5082 (1,1); 4,5019 (1,1); 4,4943 (1,5); 4,4860 (1,9); 4,4792 (1,5); 4,4713 (1,6); 4,4651 (1,8); 4,4517 (1,0); 4,4394 (0,9); 4,1486 (1,1); 4,1307 (3,4); 4,1128 (3,5); 4,1025 (1,0); 4,0950 (1,4); 4,0888 (1,0); 4,0783 (2,2); 4,0644 (2,0); 4,0539 (1,4); 4,0398 (1,2); 3,9349 (1,1); 3,9253 (1,2); 3,9181 (2,6); 3,8997 (2,9); 3,8869 (1,2); 3,8750 (2,9); 3,8567 (2,5); 3,7302 (0,6); 3,7180 (0,6); 3,5469 (1,2); 3,5381 (0,9); 3,5350 (1,3); 3,5237 (1,0); 3,4990 (1,2); 3,4930 (1,0); 3,4825 (2,4); 3,4761 (1,9); 3,4659 (1,9); 3,4586 (1,9); 3,4538 (2,0); 3,4417 (1,4); 3,4372 (1,9); 3,4205 (1,0); 3,4019 (0,5); 3,3281 (4,2); 3,2850 (3,8); 2,7233 (0,5); 2,7124 (0,5); 2,7060 (0,6); 2,7005 (0,6); 2,6890 (1,2); 2,6832 (0,7); 2,6775 (0,8); 2,6713 (1,2); 2,6659 (0,8); 2,6599 (0,8); 2,6481 (0,6); 2,6373 (0,6); 2,2910 (0,7); 2,2840 (1,3); 2,2606 (1,1); 2,2466 (3,0); 2,2271 (1,2); 2,2184 (0,8); 2,2036 (1,3); 2,1944 (5,5); 2,1741 (0,5); 2,1671 (0,7); 2,1305 (0,9); 2,1011 (0,7); 2,0438 (16,0); 1,9565 (0,8); 1,9502 (0,8); 1,9385 (1,6); 1,9315 (1,6); 1,9147 (2,0); 1,8986 (1,7); 1,8926 (1,6); 1,8805 (1,0); 1,8748 (1,0); 1,8567 (0,5); 1,6134 (0,9); 1,5964 (1,2); 1,5798 (1,3); 1,5602 (1,2); 1,5436 (0,9); 1,5039 (0,8); 1,4094 (0,6); 1,3908 (0,8); 1,3709 (0,8); 1,3531 (0,6); 1,3331 (1,0); 1,2844 (1,6); 1,2766 (5,4);
--

	1,2587 (13,8); 1,2409 (5,0); 1,2324 (1,0); 1,2133 (1,4); 1,1943 (1,1); 1,1231 (3,8); 1,1172 (3,8); 1,1045 (7,7); 1,0986 (7,3); 1,0858 (3,8); 1,0800 (3,6); 0,9468 (1,6); 0,9284 (3,1); 0,9100 (1,4); 0,8968 (0,6); 0,8801 (1,5); 0,8625 (0,7); 0,0080 (3,4); -0,0002 (116,8); -0,0085 (3,9)
I-30	¹ H-RMN(400,0 MHz, CDCl ₃): δ = 7,5185 (2,5); 7,3218 (0,5); 7,3181 (0,6); 7,3094 (0,9); 7,3021 (0,5); 7,2957 (0,6); 7,2941 (0,5); 7,2902 (0,7); 7,2886 (0,7); 7,2862 (0,8); 7,2854 (0,8); 7,2822 (1,0); 7,2790 (1,1); 7,2782 (1,1); 7,2759 (1,4); 7,2750 (1,5); 7,2743 (1,6); 7,2734 (1,7); 7,2727 (1,8); 7,2711 (2,2); 7,2703 (2,3); 7,2694 (2,4); 7,2678 (3,3); 7,2670 (3,6); 7,2596 (455,4); 7,2279 (0,7); 7,2103 (0,6); 7,1464 (2,3); 6,9956 (2,7); 6,8685 (1,6); 4,5296 (0,8); 4,1304 (0,8); 4,1125 (0,8); 3,9728 (0,7); 3,7768 (0,5); 3,7375 (0,6); 3,1965 (1,0); 3,1528 (0,8); 2,0436 (2,6); 1,6706 (6,3); 1,6102 (16,0); 1,2842 (0,9); 1,2763 (1,1); 1,2584 (3,4); 1,2406 (1,0); 0,8801 (0,6); 0,1460 (0,6); 0,0102 (1,0); 0,0079 (6,0); 0,0063 (2,0); 0,0054 (2,2); 0,0046 (2,6); -0,0002 (201,3); -0,0052 (3,5); -0,0060 (2,7); -0,0068 (2,2); -0,0085 (5,9); -0,0116 (0,6); -0,0124 (0,5); -0,1496 (0,6)

[0273] Em analogia aos exemplos da preparação citados acima no ponto adequado, e levando em consideração os detalhes gerais relacionados à preparação de isoxazolinacarboxamidas substituídas, os compostos citados

abaixo podem ser obtidos:

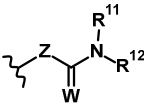
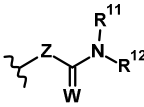
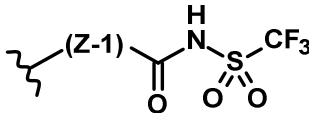
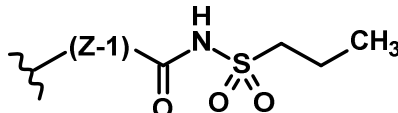
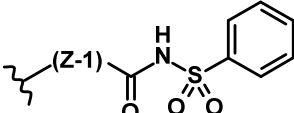
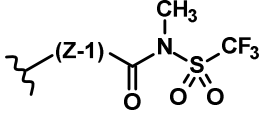
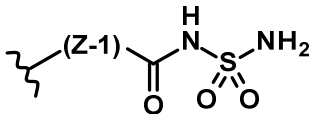
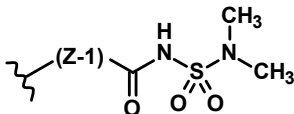
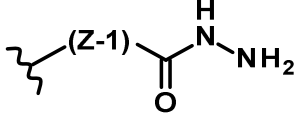
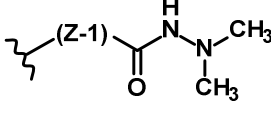
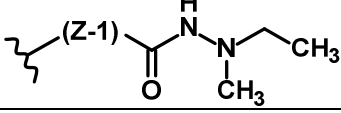
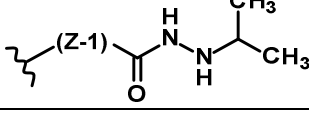
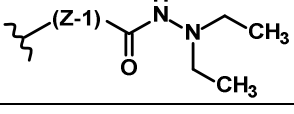
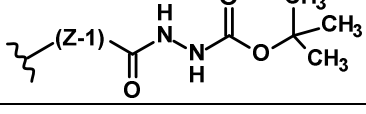
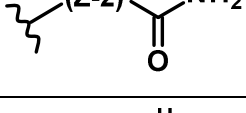
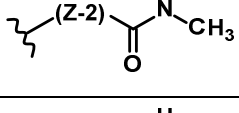
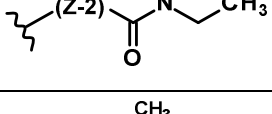
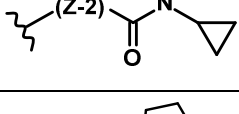
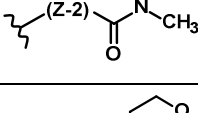
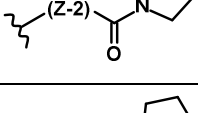
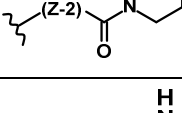
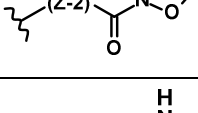
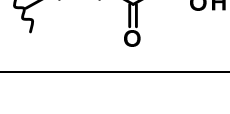
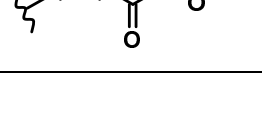
Tabela 2.1: Os compostos 2.1-1 a 2.1-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.1), em que Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² é conforme definido abaixo.

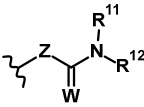
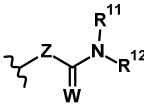
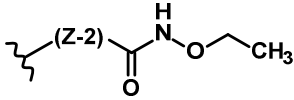
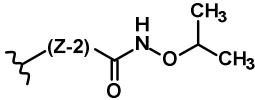
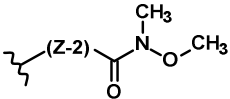
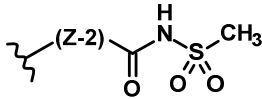
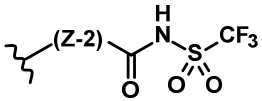
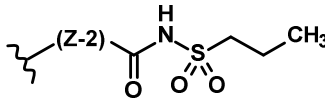
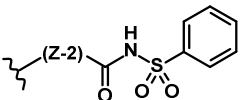
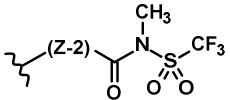
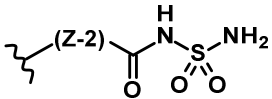
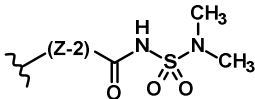
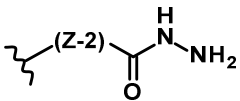
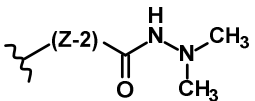
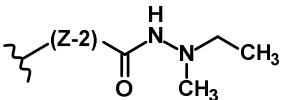
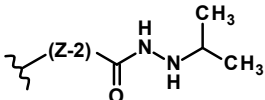
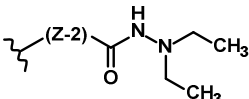
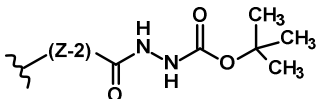
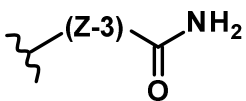
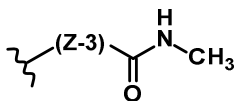
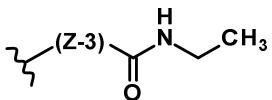
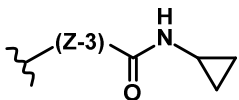
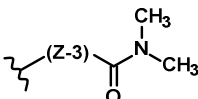
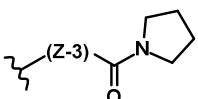


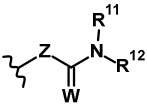
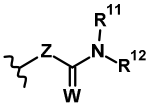
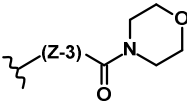
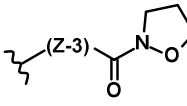
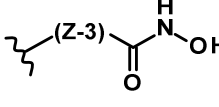
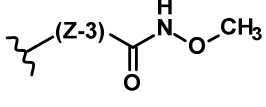
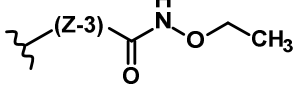
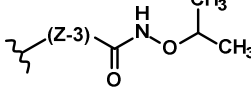
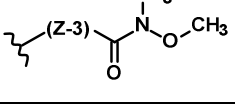
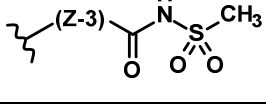
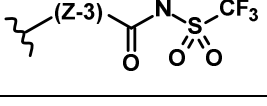
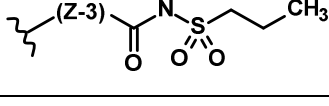
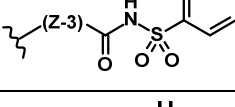
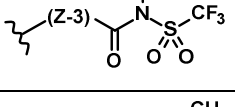
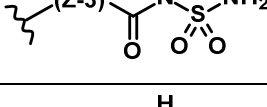
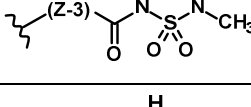
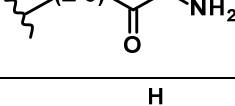
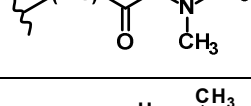
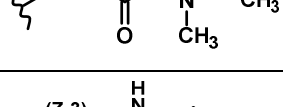
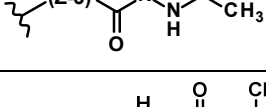
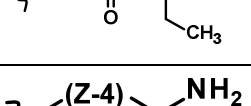
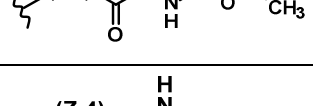
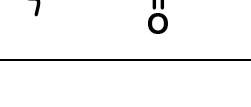
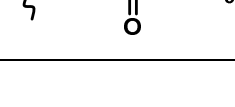
(I.1),

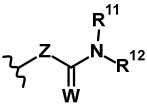
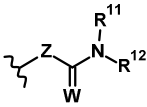
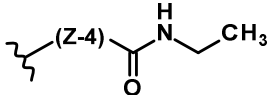
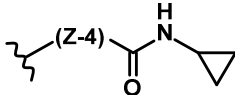
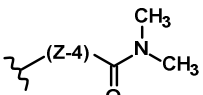
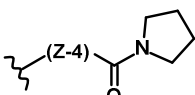
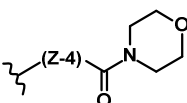
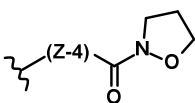
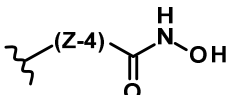
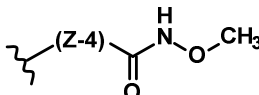
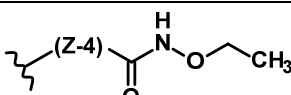
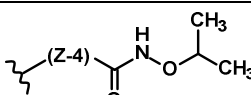
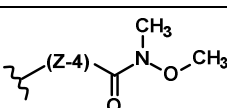
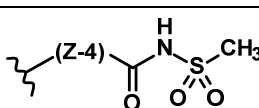
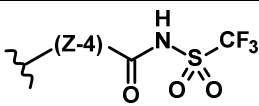
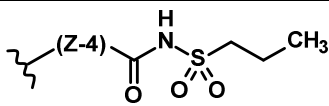
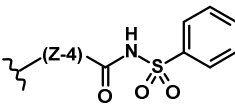
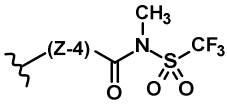
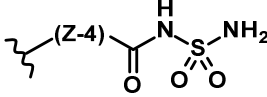
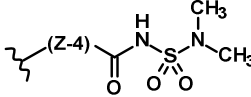
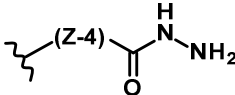
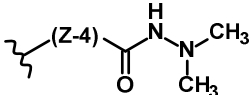
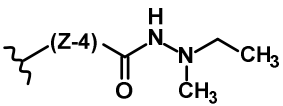
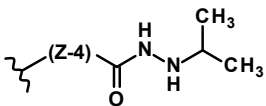
Tabela 2.1

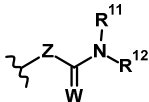
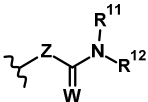
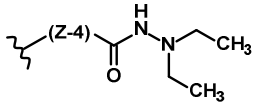
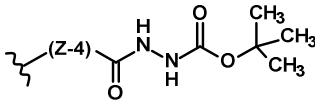
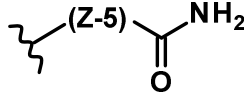
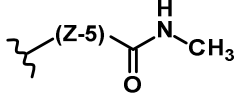
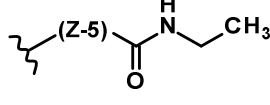
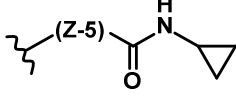
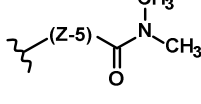
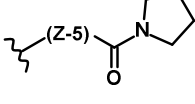
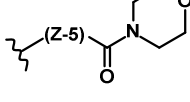
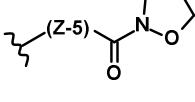
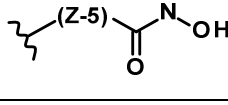
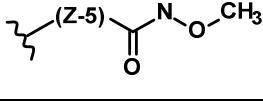
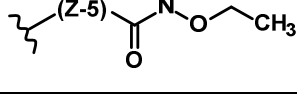
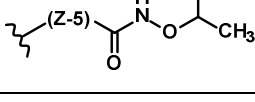
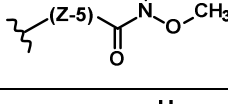
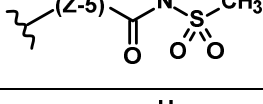
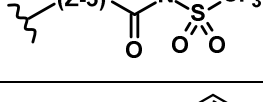
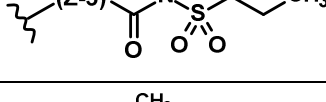
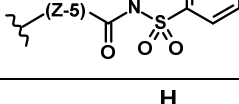
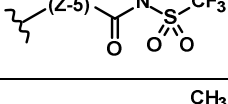
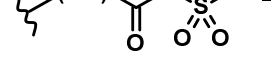
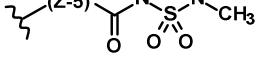
nº		nº	
2.1-1		2.1-2	
2.1-3		2.1-4	
2.1-5		2.1-6	
2.1-7		2.1-8	
2.1-9		2.1-10	
2.1-11		2.1-12	
2.1-13		2.1-14	

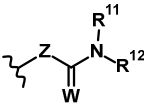
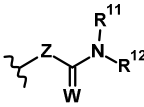
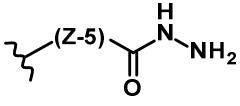
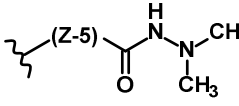
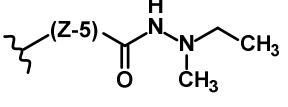
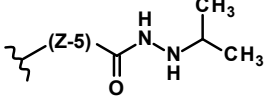
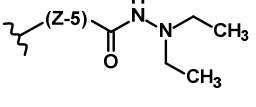
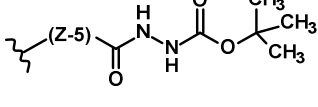
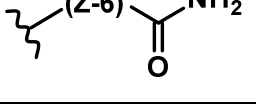
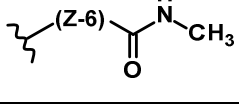
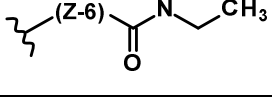
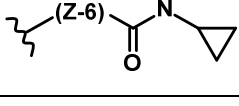
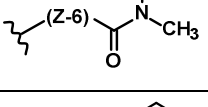
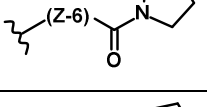
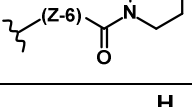
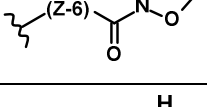
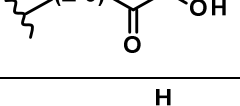
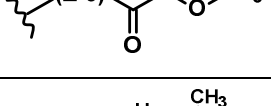
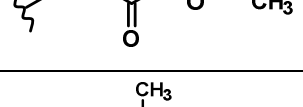
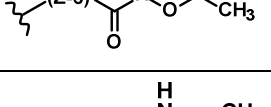
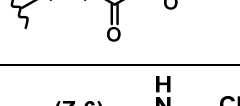
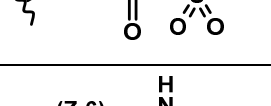
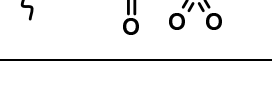
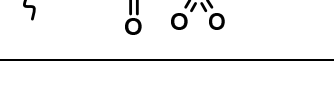
n°		n°	
2.1-15		2.1-16	
2.1-17		2.1-18	
2.1-19		2.1-20	
2.1-21		2.1-22	
2.1-23		2.1-24	
2.1-25		2.1-26	
2.1-27		2.1-28	
2.1-29		2.1-30	
2.1-31		2.1-32	
2.1-33		2.1-34	
2.1-35		2.1-36	

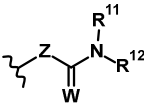
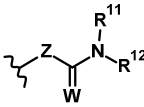
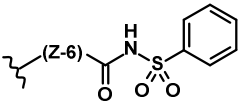
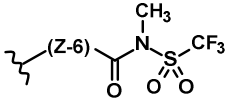
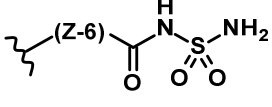
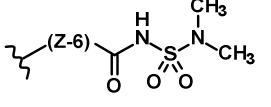
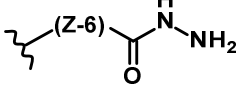
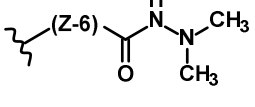
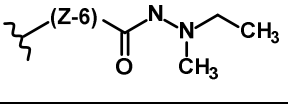
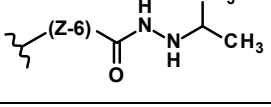
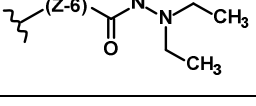
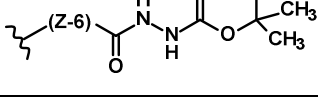
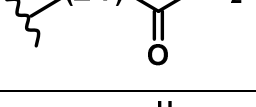
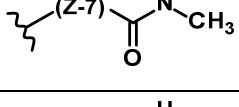
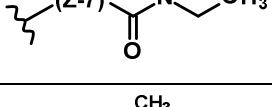
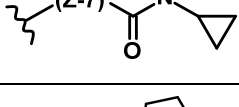
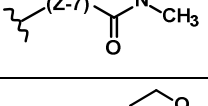
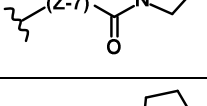
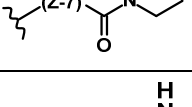
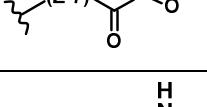
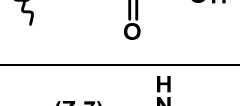
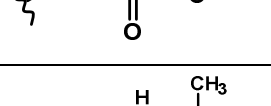
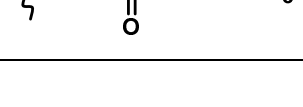
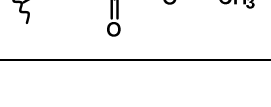
n°		n°	
2.1-37		2.1-38	
2.1-39		2.1-40	
2.1-41		2.1-42	
2.1-43		2.1-44	
2.1-45		2.1-46	
2.1-47		2.1-48	
2.1-49		2.1-50	
2.1-51		2.1-52	
2.1-53		2.1-54	
2.1-55		2.1-56	
2.1-57		2.1-58	

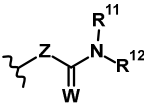
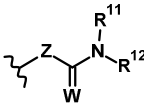
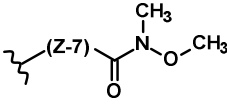
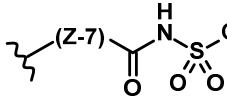
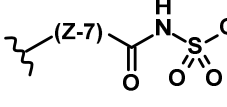
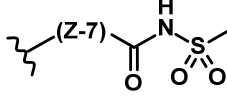
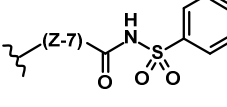
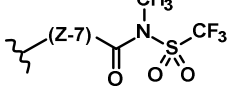
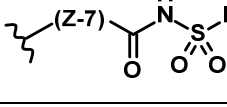
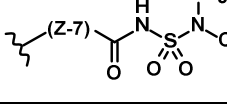
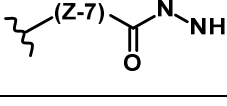
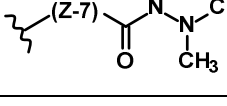
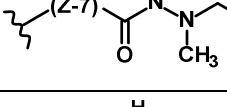
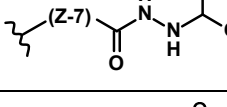
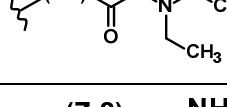
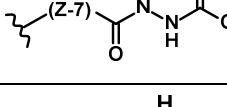
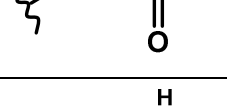
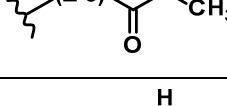
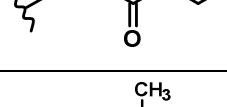
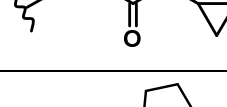
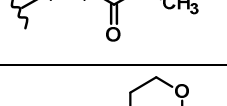
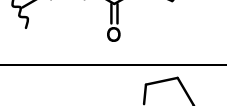
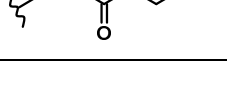
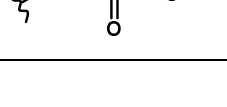
n°		n°	
2.1-59		2.1-60	
2.1-61		2.1-62	
2.1-63		2.1-64	
2.1-65		2.1-66	
2.1-67		2.1-68	
2.1-69		2.1-70	
2.1-71		2.1-72	
2.1-73		2.1-74	
2.1-75		2.1-76	
2.1-77		2.1-78	
2.1-79		2.1-80	

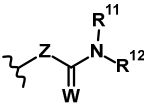
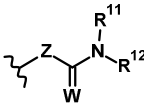
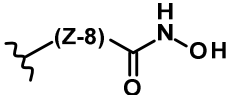
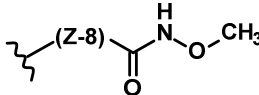
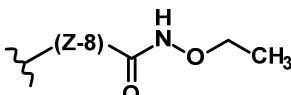
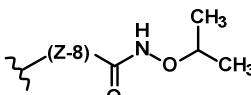
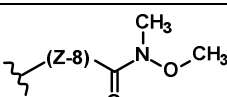
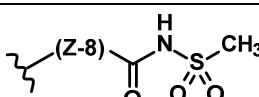
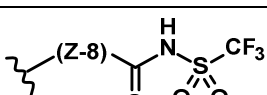
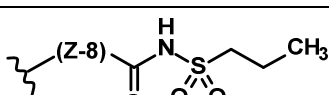
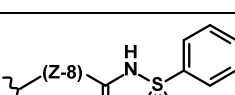
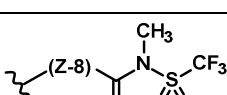
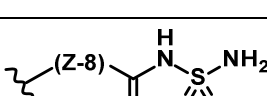
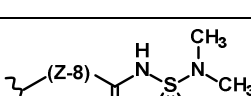
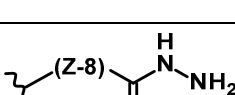
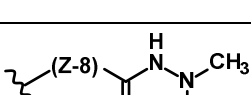
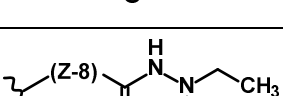
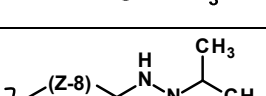
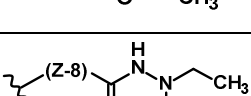
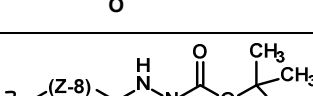
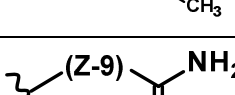
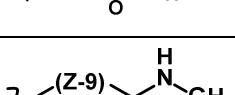
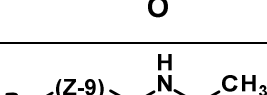
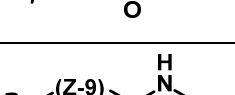
n°		n°	
2.1-81		2.1-82	
2.1-83		2.1-84	
2.1-85		2.1-86	
2.1-87		2.1-88	
2.1-89		2.1-90	
2.1-91		2.1-92	
2.1-93		2.1-94	
2.1-95		2.1-96	
2.1-97		2.1-98	
2.1-99		2.1-100	
2.1-101		2.1-102	

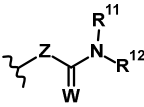
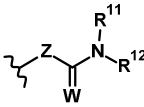
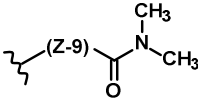
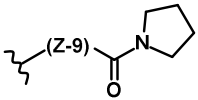
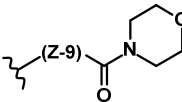
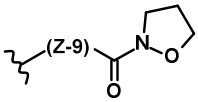
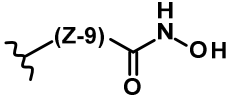
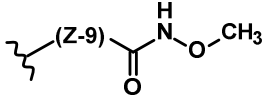
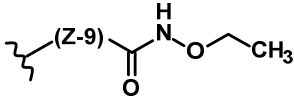
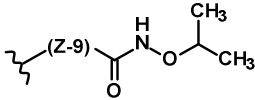
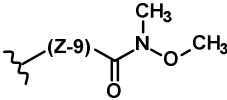
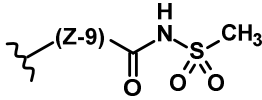
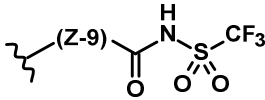
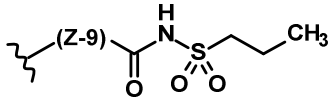
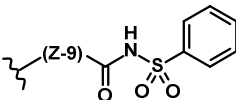
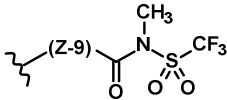
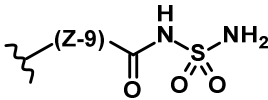
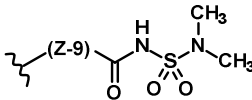
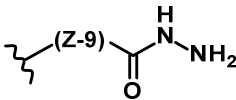
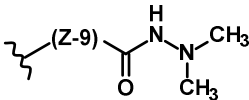
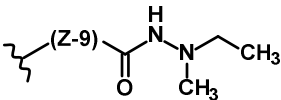
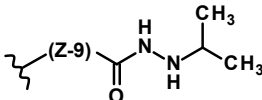
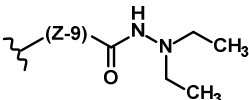
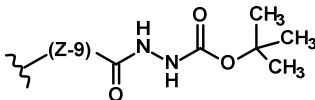
n°		n°	
2.1-103		2.1-104	
2.1-105		2.1-106	
2.1-107		2.1-108	
2.1-109		2.1-110	
2.1-111		2.1-112	
2.1-113		2.1-114	
2.1-115		2.1-116	
2.1-117		2.1-118	
2.1-119		2.1-120	
2.1-121		2.1-122	
2.1-123		2.1-124	

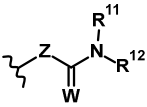
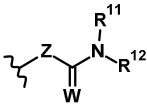
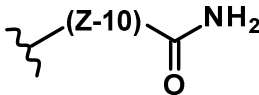
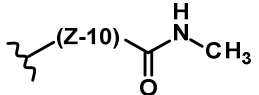
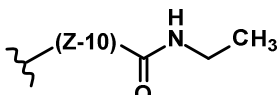
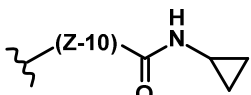
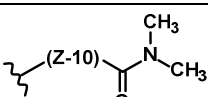
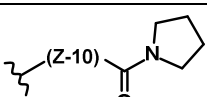
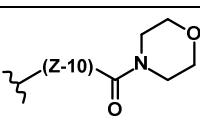
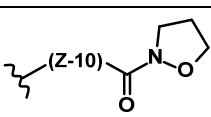
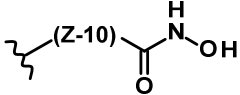
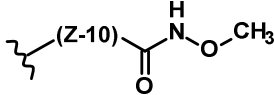
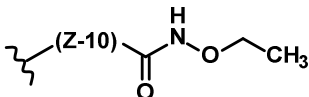
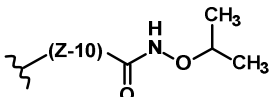
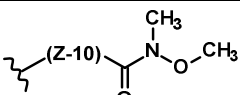
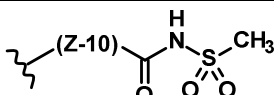
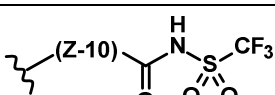
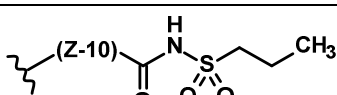
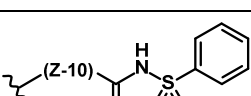
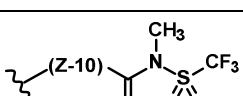
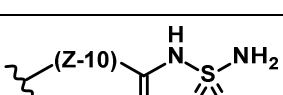
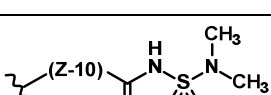
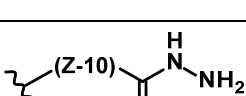
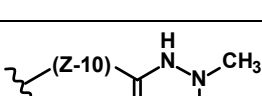
n°		n°	
2.1-125		2.1-126	
2.1-127		2.1-128	
2.1-129		2.1-130	
2.1-131		2.1-132	
2.1-133		2.1-134	
2.1-135		2.1-136	
2.1-137		2.1-138	
2.1-139		2.1-140	
2.1-141		2.1-142	
2.1-143		2.1-144	
2.1-145		2.1-146	

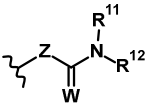
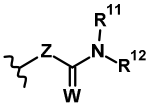
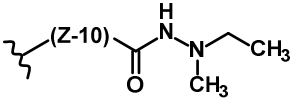
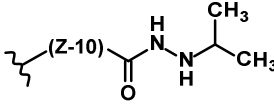
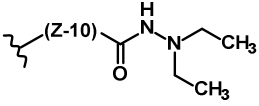
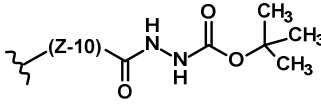
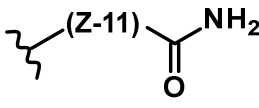
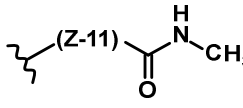
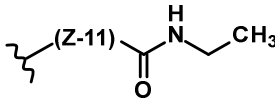
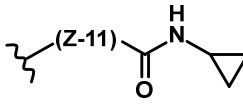
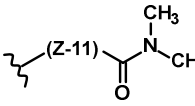
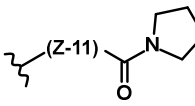
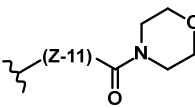
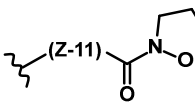
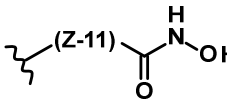
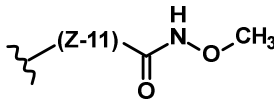
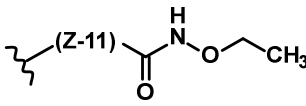
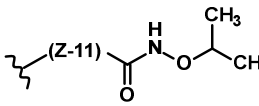
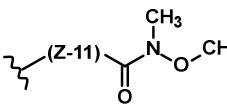
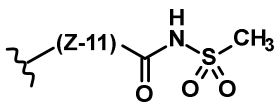
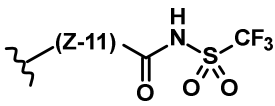
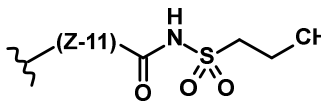
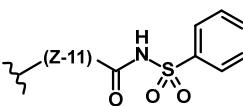
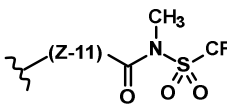
n°		n°	
2.1-147		2.1-148	
2.1-149		2.1-150	
2.1-151		2.1-152	
2.1-153		2.1-154	
2.1-155		2.1-156	
2.1-157		2.1-158	
2.1-159		2.1-160	
2.1-161		2.1-162	
2.1-163		2.1-164	
2.1-165		2.1-166	
2.1-167		2.1-168	

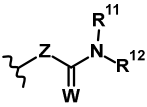
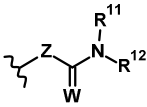
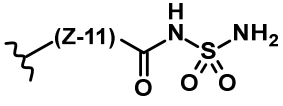
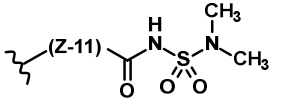
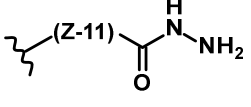
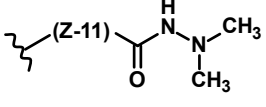
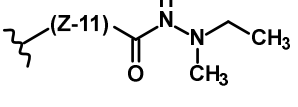
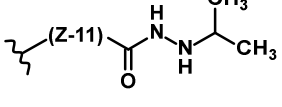
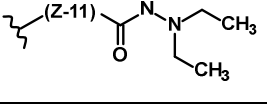
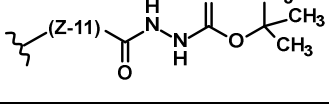
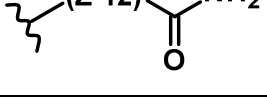
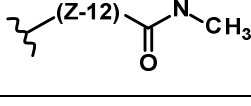
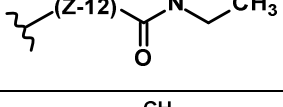
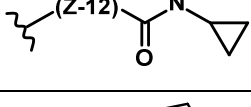
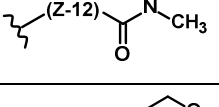
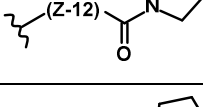
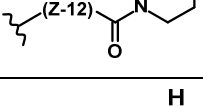
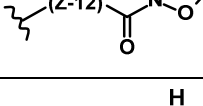
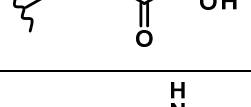
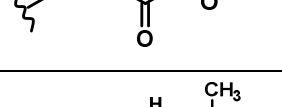
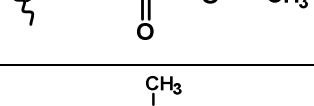
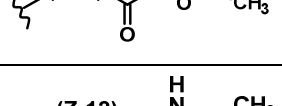
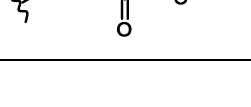
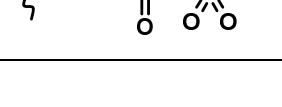
n°		n°	
2.1-169		2.1-170	
2.1-171		2.1-172	
2.1-173		2.1-174	
2.1-175		2.1-176	
2.1-177		2.1-178	
2.1-179		2.1-180	
2.1-181		2.1-182	
2.1-183		2.1-184	
2.1-185		2.1-186	
2.1-187		2.1-188	
2.1-189		2.1-190	

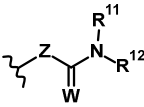
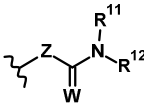
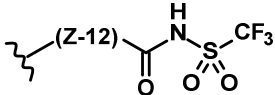
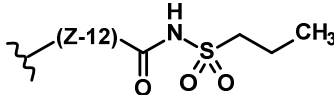
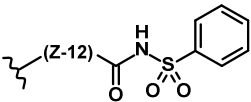
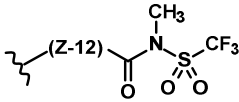
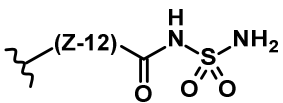
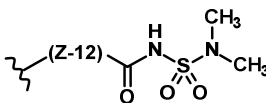
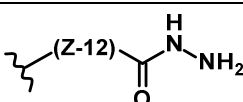
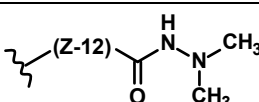
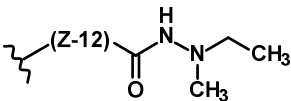
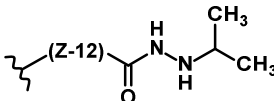
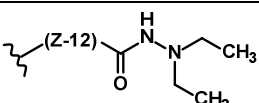
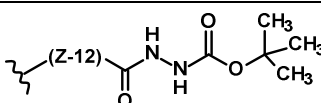
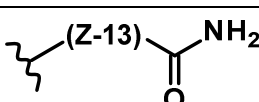
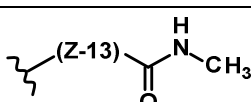
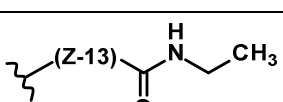
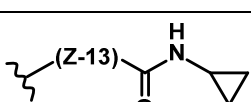
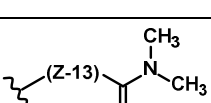
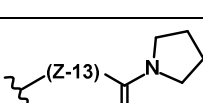
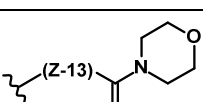
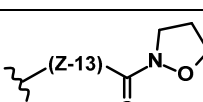
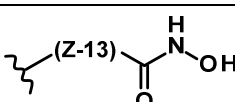
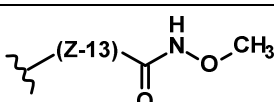
n°		n°	
2.1-191		2.1-192	
2.1-193		2.1-194	
2.1-195		2.1-196	
2.1-197		2.1-198	
2.1-199		2.1-200	
2.1-201		2.1-202	
2.1-203		2.1-204	
2.1-205		2.1-206	
2.1-207		2.1-208	
2.1-209		2.1-210	
2.1-211		2.1-212	

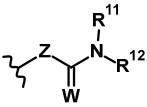
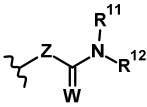
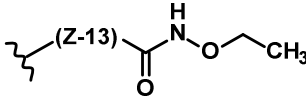
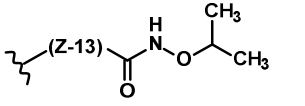
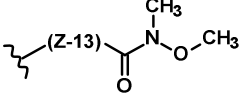
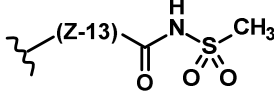
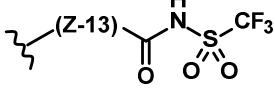
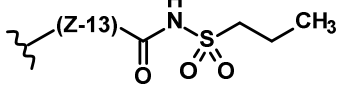
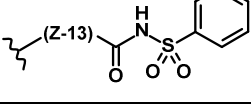
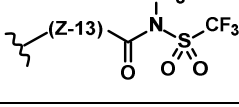
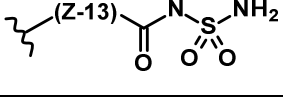
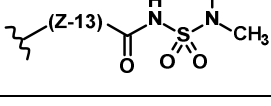
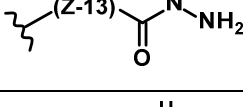
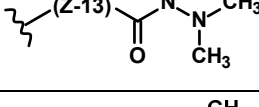
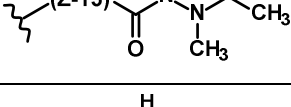
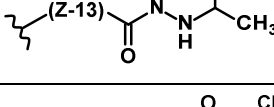
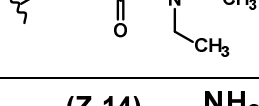
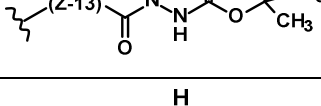
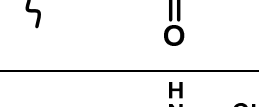
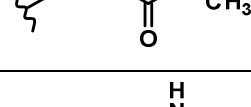
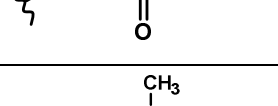
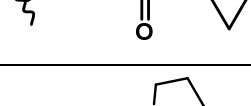
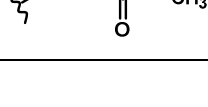
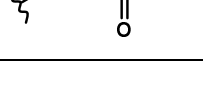
n°		n°	
2.1-213		2.1-214	
2.1-215		2.1-216	
2.1-217		2.1-218	
2.1-219		2.1-220	
2.1-221		2.1-222	
2.1-223		2.1-224	
2.1-225		2.1-226	
2.1-227		2.1-228	
2.1-229		2.1-230	
2.1-231		2.1-232	
2.1-233		2.1-234	

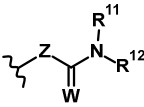
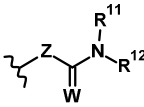
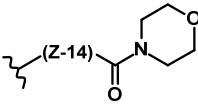
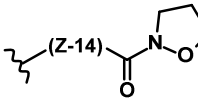
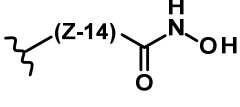
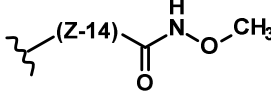
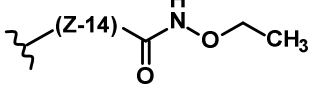
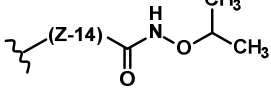
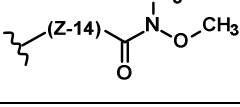
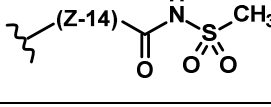
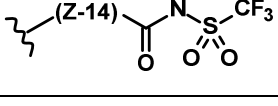
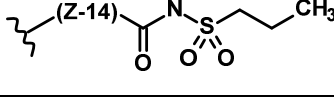
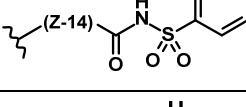
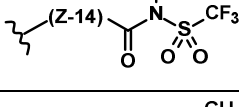
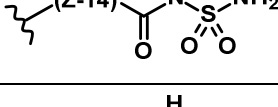
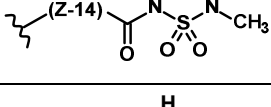
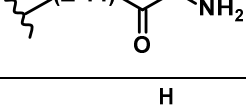
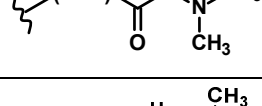
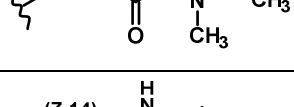
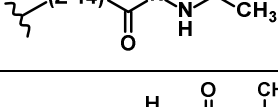
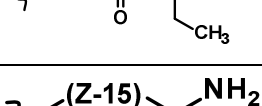
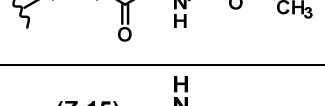
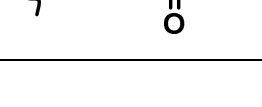
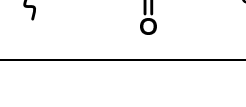
n°		n°	
2.1-235		2.1-236	
2.1-237		2.1-238	
2.1-239		2.1-240	
2.1-241		2.1-242	
2.1-243		2.1-244	
2.1-245		2.1-246	
2.1-247		2.1-248	
2.1-249		2.1-250	
2.1-251		2.1-252	
2.1-253		2.1-254	
2.1-255		2.1-256	

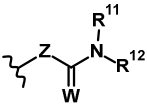
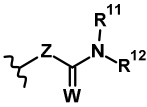
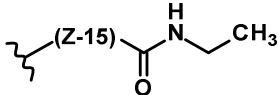
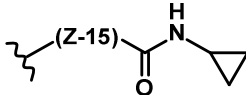
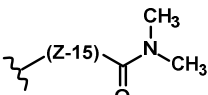
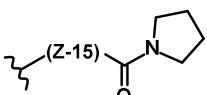
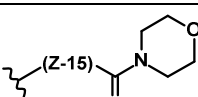
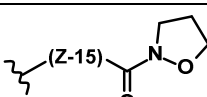
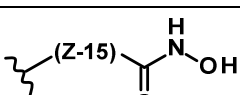
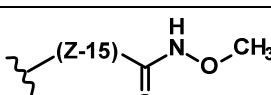
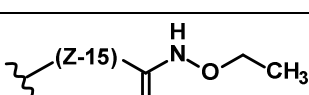
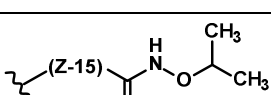
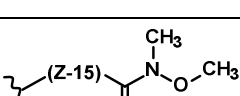
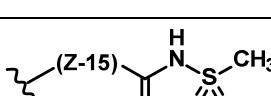
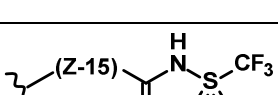
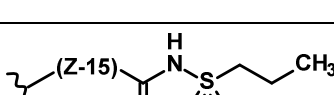
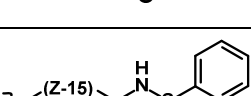
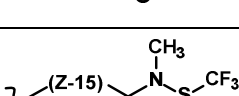
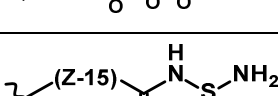
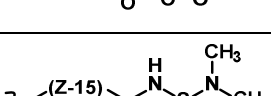
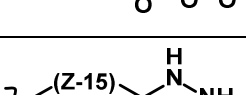
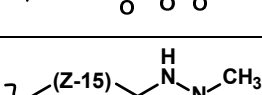
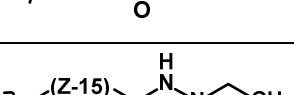
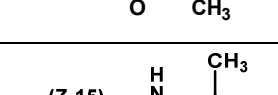
n°		n°	
2.1-257		2.1-258	
2.1-259		2.1-260	
2.1-261		2.1-262	
2.1-263		2.1-264	
2.1-265		2.1-266	
2.1-267		2.1-268	
2.1-269		2.1-270	
2.1-271		2.1-272	
2.1-273		2.1-274	
2.1-275		2.1-276	
2.1-277		2.1-278	

n°		n°	
2.1-279		2.1-280	
2.1-281		2.1-282	
2.1-283		2.1-284	
2.1-285		2.1-286	
2.1-287		2.1-288	
2.1-289		2.1-290	
2.1-291		2.1-292	
2.1-293		2.1-294	
2.1-295		2.1-296	
2.1-297		2.1-298	
2.1-299		2.1-300	

n°		n°	
2.1-301		2.1-302	
2.1-303		2.1-304	
2.1-305		2.1-306	
2.1-307		2.1-308	
2.1-309		2.1-310	
2.1-311		2.1-312	
2.1-313		2.1-314	
2.1-315		2.1-316	
2.1-317		2.1-318	
2.1-319		2.1-320	
2.1-321		2.1-322	

n°		n°	
2.1-323		2.1-324	
2.1-325		2.1-326	
2.1-327		2.1-328	
2.1-329		2.1-330	
2.1-331		2.1-332	
2.1-333		2.1-334	
2.1-335		2.1-336	
2.1-337		2.1-338	
2.1-339		2.1-340	
2.1-341		2.1-342	
2.1-343		2.1-344	

n°		n°	
2.1-345		2.1-346	
2.1-347		2.1-348	
2.1-349		2.1-350	
2.1-351		2.1-352	
2.1-353		2.1-354	
2.1-355		2.1-356	
2.1-357		2.1-358	
2.1-359		2.1-360	
2.1-361		2.1-362	
2.1-363		2.1-364	
2.1-365		2.1-366	

n°		n°	
2.1-367		2.1-368	
2.1-369		2.1-370	
2.1-371		2.1-372	
2.1-373		2.1-374	
2.1-375		2.1-376	
2.1-377		2.1-378	
2.1-379		2.1-380	
2.1-381		2.1-382	
2.1-383		2.1-384	
2.1-385		2.1-386	
2.1-387		2.1-388	

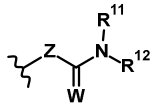
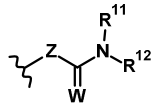
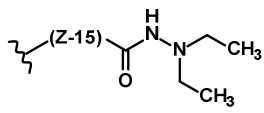
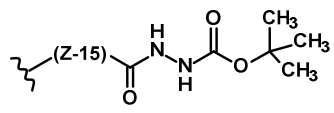
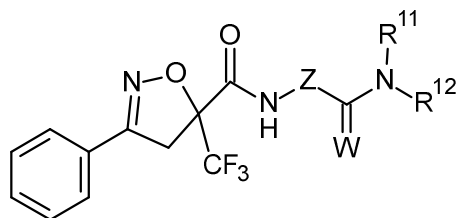
n°		n°	
2.1-389		2.1-390	

Tabela 2.2: Os compostos 2.2-1 a 2.2-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.2),

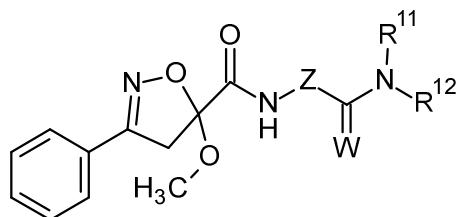
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.2),

Tabela 2.3: Os compostos 2.3-1 a 2.3-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.3),

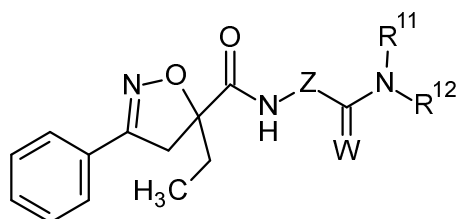
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.3),

Tabela 2.4: Os compostos 2.4-1 a 2.4-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.4),

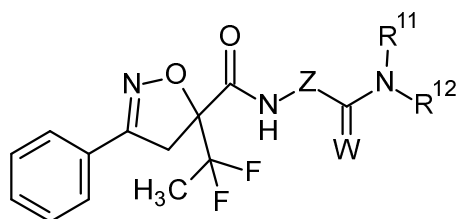
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.4),

Tabela 2.5: Os compostos 2.5-1 a 2.5-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.5),

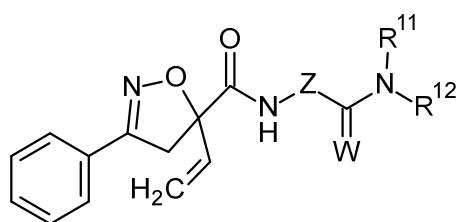
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.5),

Tabela 2.6: Os compostos 2.6-1 a 2.6-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.6),

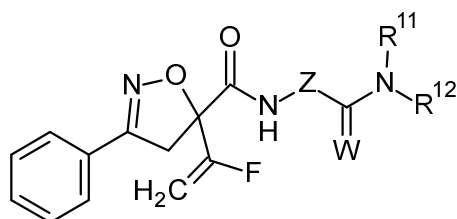
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.6),

Tabela 2.7: Os compostos 2.7-1 a 2.7-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.7),

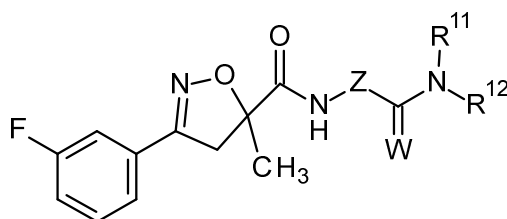
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.7),

Tabela 2.8: Os compostos 2.8-1 a 2.8-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.8),

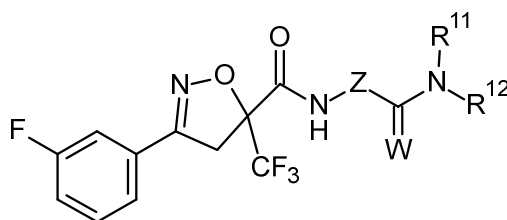
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.8),

Tabela 2.9: Os compostos 2.9-1 a 2.9-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.9),

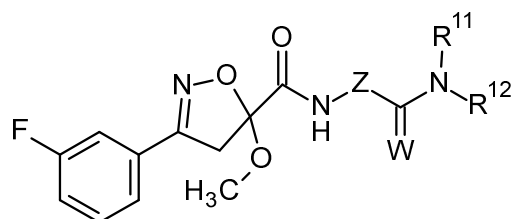
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.9),

Tabela 2.10: Os compostos 2.10-1 a 2.10-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.10),

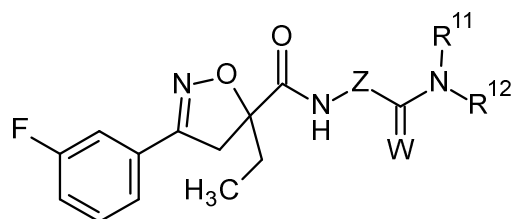
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.10),

Tabela 2.11: Os compostos 2.11-1 a 2.11-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.11),

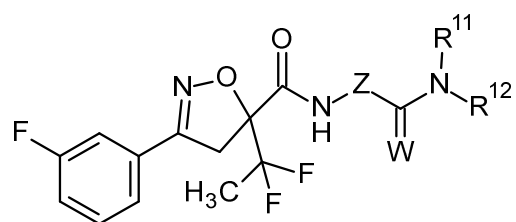
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.11),

Tabela 2.12: Os compostos 2.12-1 a 2.12-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.12),

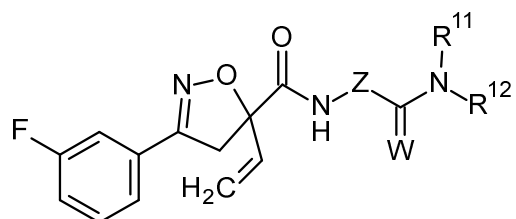
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.12),

Tabela 2.13: Os compostos 2.13-1 a 2.13-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.13),

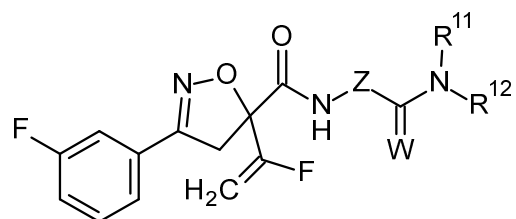
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.13),

Tabela 2.14: Os compostos 2.14-1 a 2.14-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.14),

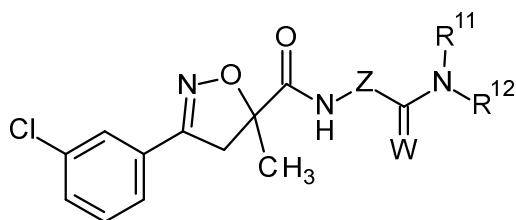
em que Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.14),

Tabela 2.15: Os compostos 2.15-1 a 2.15-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.15),

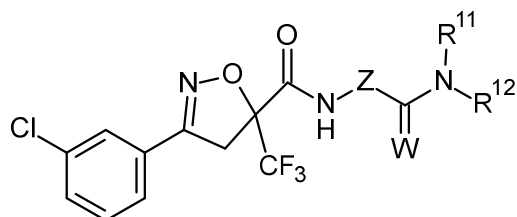
em que Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.15),

Tabela 2.16: Os compostos 2.16-1 a 2.16-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.16),

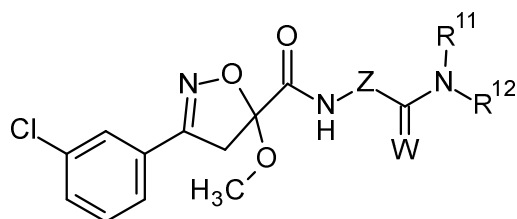
em que Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.16),

Tabela 2.17: Os compostos 2.17-1 a 2.17-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.17),

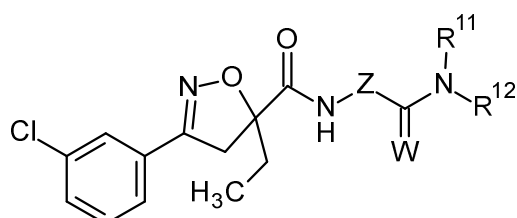
em que Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.17),

Tabela 2.18: Os compostos 2.18-1 a 2.18-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.18),

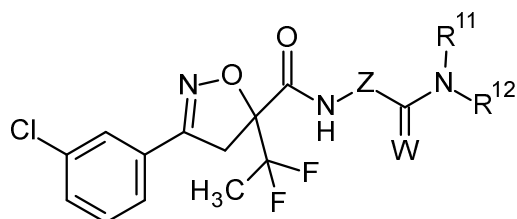
em que Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.18),

Tabela 2.19: Os compostos 2.19-1 a 2.19-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.19),

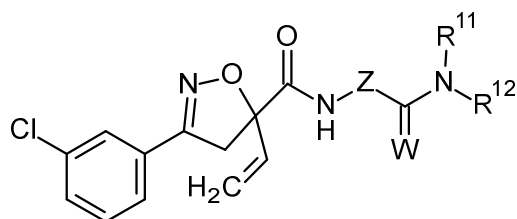
em que Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.19),

Tabela 2.20: Os compostos 2.20-1 a 2.20-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.20),

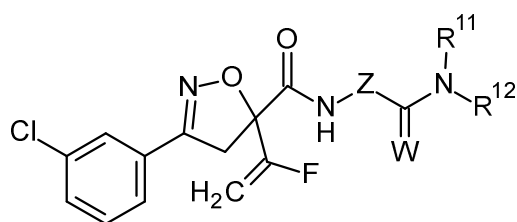
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.20),

Tabela 2.21: Os compostos 2.21-1 a 2.21-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.21),

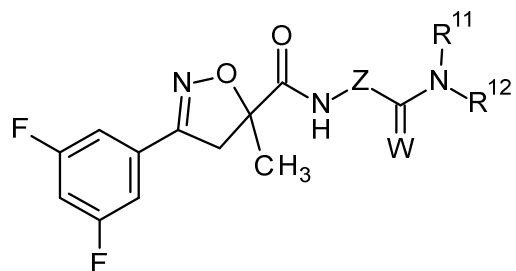
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.21),

Tabela 2.22: Os compostos 2.22-1 a 2.22-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.22),

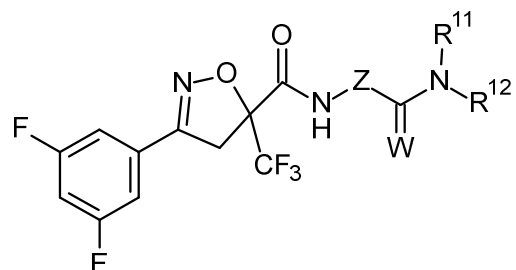
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.22),

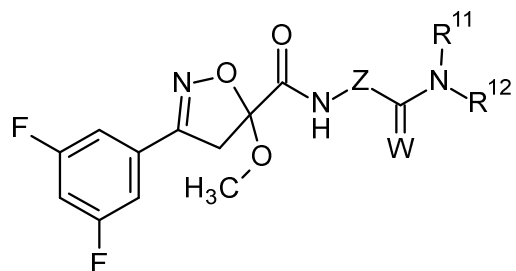
Tabela 2.23: Os compostos 2.23-1 a 2.23-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.23),

em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.23),

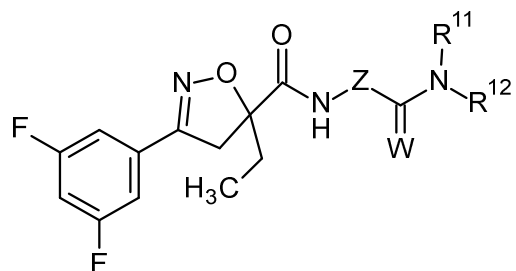
Tabela 2.24: Compostos 2.24-1 a 2.24-390 da fórmula geral (I.24) em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.24),

Tabela 2.25: Os compostos 2.25-1 a 2.25-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.25),

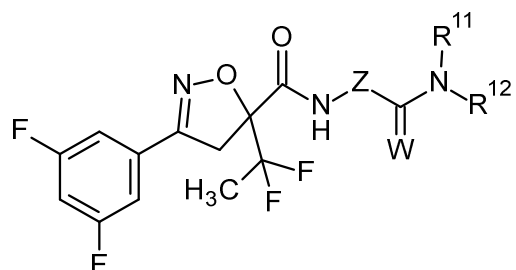
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.25),

Tabela 2.26: Os compostos 2.26-1 a 2.26-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.26),

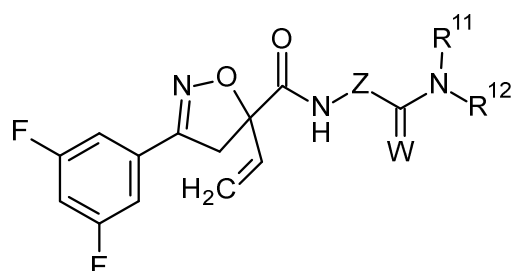
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.26),

Tabela 2.27: Os compostos 2.27-1 a 2.27-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.27),

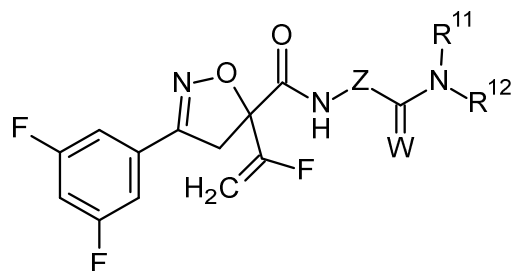
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.27),

Tabela 2.28: Os compostos 2.28-1 a 2.28-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.28),

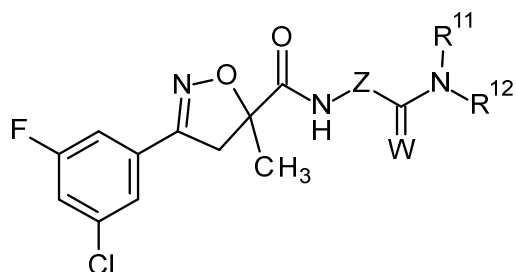
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.28),

Tabela 2.29: Os compostos 2.29-1 a 2.29-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.29),

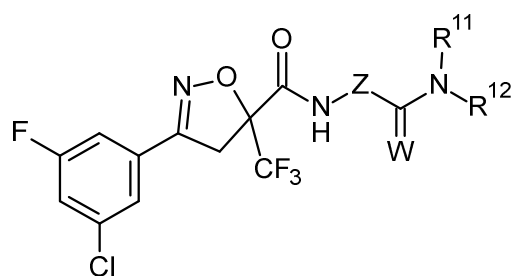
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.29),

Tabela 2.30: Os compostos 2.30-1 a 2.30-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.30),

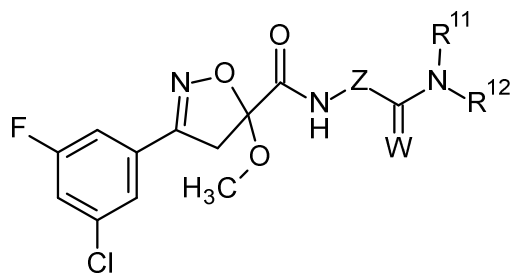
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.30),

Tabela 2.31: Os compostos 2.31-1 a 2.31-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.31),

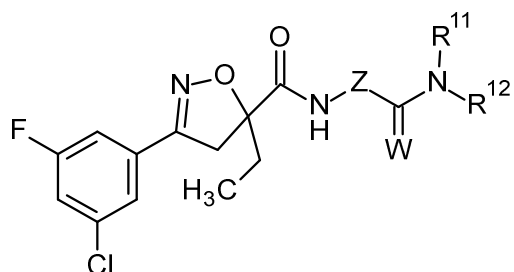
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.31),

Tabela 2.32: Os compostos 2.32-1 a 2.32-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.32),

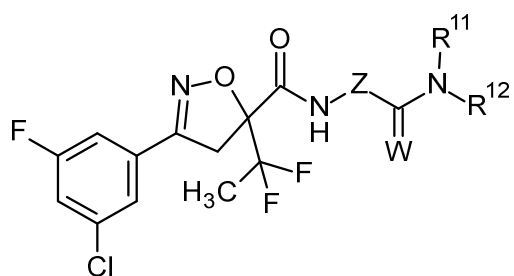
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.32),

Tabela 2.33: Os compostos 2.33-1 a 2.33-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.33),

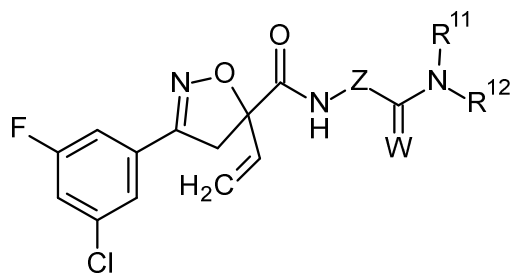
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.33),

Tabela 2.34: Os compostos 2.34-1 a 2.34-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.34),

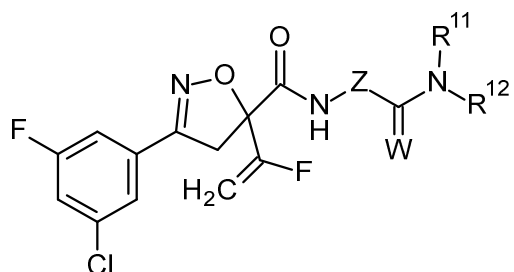
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.34),

Tabela 2.35: Os compostos 2.35-1 a 2.35-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.35),

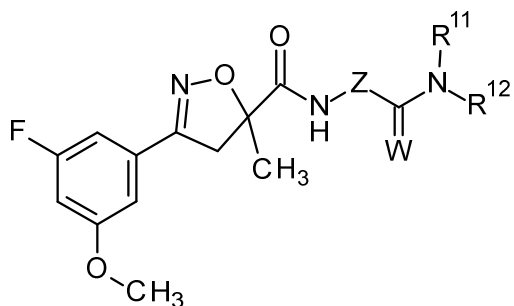
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.35),

Tabela 2.36: Os compostos 2.36-1 a 2.36-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.36),

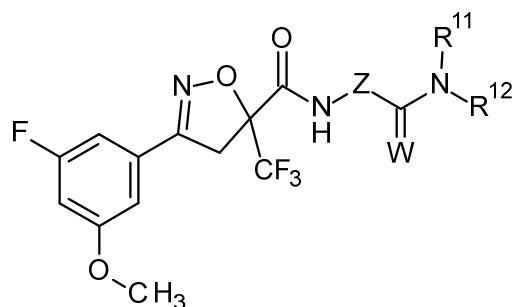
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.36),

Tabela 2.37: Os compostos 2.37-1 a 2.37-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.37),

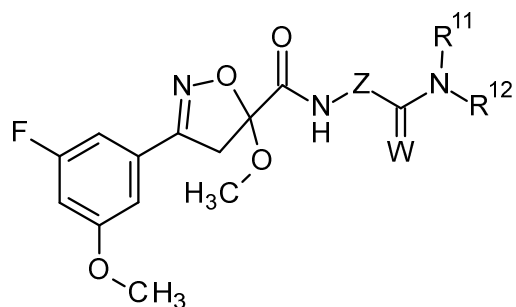
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.37),

Tabela 2.38: Os compostos 2.38-1 a 2.38-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.38),

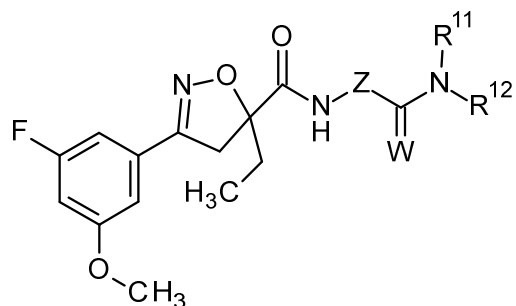
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.38),

Tabela 2.39: Os compostos 2.39-1 a 2.39-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.39),

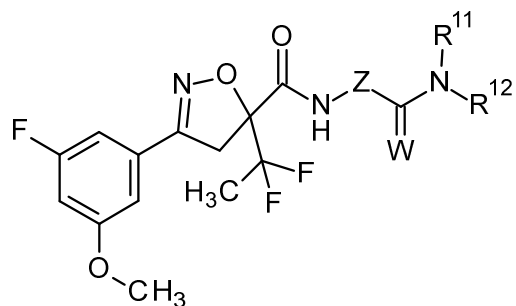
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.39),

Tabela 2.40: Os compostos 2.40-1 a 2.40-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.40),

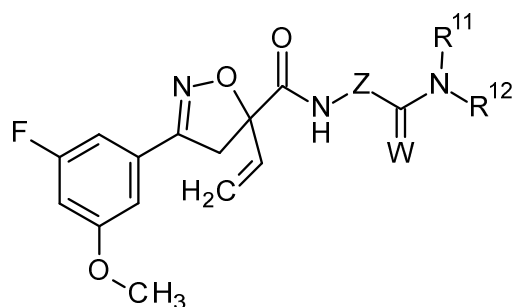
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.40),

Tabela 2.41: Os compostos 2.41-1 a 2.41-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.41),

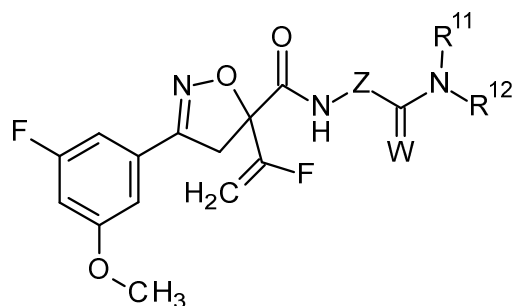
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.41),

Tabela 2.42: Os compostos 2.42-1 a 2.42-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.42),

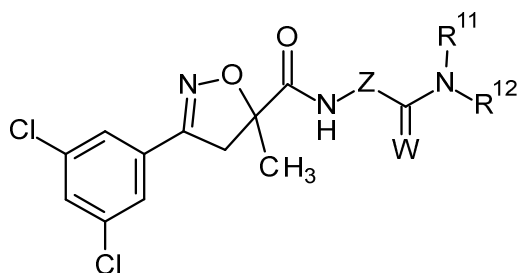
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.42),

Tabela 2.43: Os compostos 2.43-1 a 2.43-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.43),

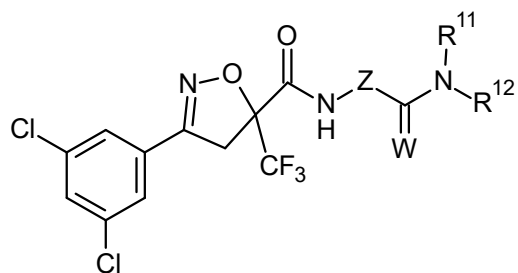
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.43),

Tabela 2.44: Os compostos 2.44-1 a 2.44-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.44),

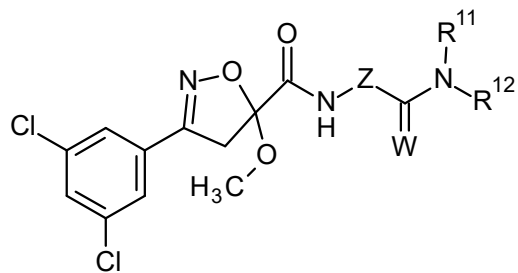
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.44),

Tabela 2.45: Os compostos 2.45-1 a 2.45-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.45),

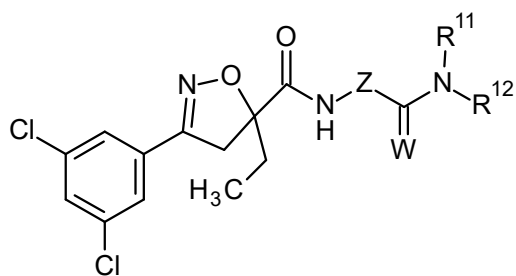
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.45),

Tabela 2.46: Os compostos 2.46-1 a 2.46-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.46),

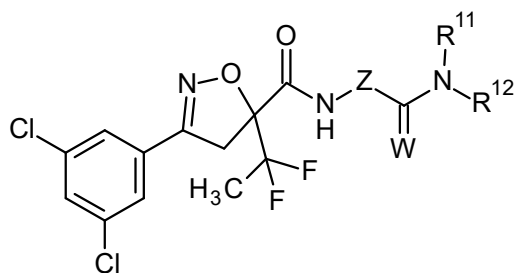
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.46),

Tabela 2.47: Os compostos 2.47 a 2.47-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.47),

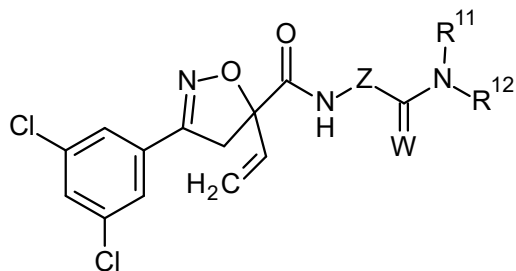
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.47),

Tabela 2.48: Os compostos 2.48-1 a 2.48-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.48),

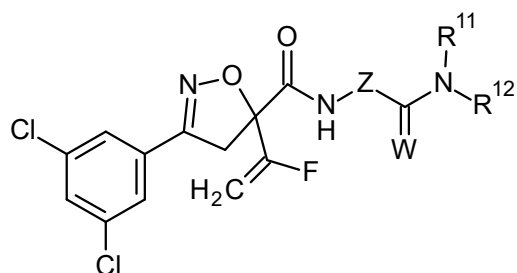
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.48),

Tabela 2.49: Os compostos 2.49-1 a 2.49-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.49),

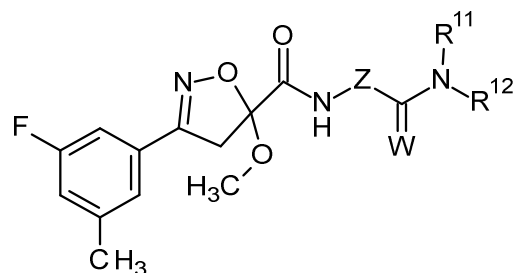
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.49),

Tabela 2.50: Os compostos 2.50-1 a 2.50-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.50),

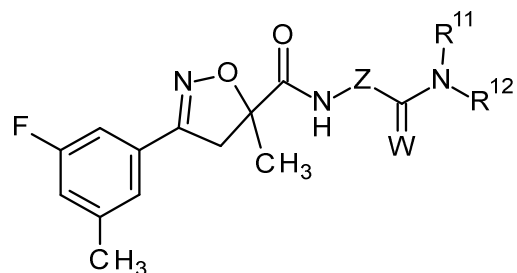
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.50),

Tabela 2.51: Os compostos 2.51-1 a 2.51-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.51),

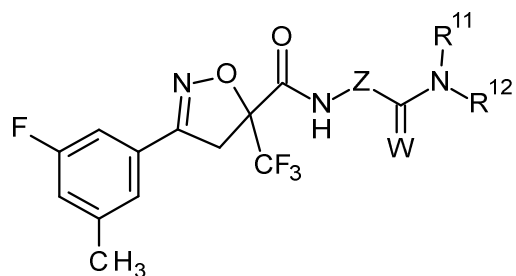
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.51),

Tabela 2.52: Os compostos 2.52-1 a 2.52-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.52),

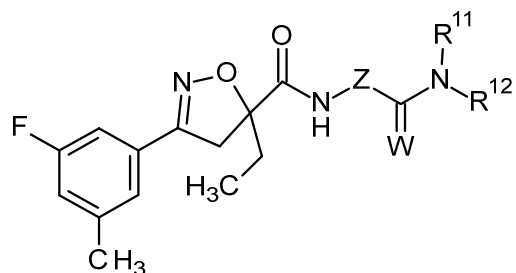
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.52),

Tabela 2.53: Os compostos 2.53-1 a 2.53-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.53),

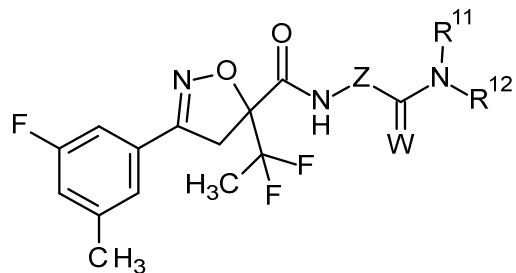
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.53),

Tabela 2.54: Os compostos 2.54-1 a 2.54-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.54),

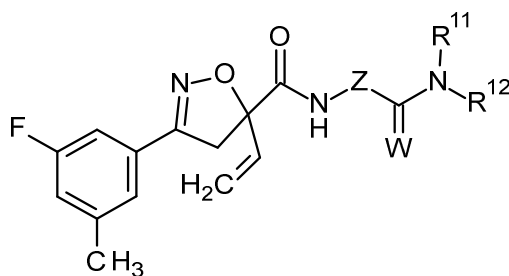
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.54),

Tabela 2.55: Os compostos 2.55-1 a 2.55-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.55),

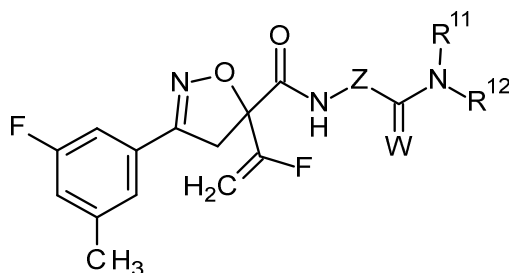
em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.55),

Tabela 2.56: Os compostos 2.56-1 a 2.56-390 de acordo com a invenção da fórmula geral (I.56),

em que $Z-(C=W)-N(R^{11})-R^{12}$ é conforme definido na Tabela 2.1.



(I.56),

B. Exemplos de formulação

1. Produtos em forma de poeira

[0274] Um produto em forma de poeira é obtido pela mistura de 10 partes em peso de um composto da fórmula (I) e 90 partes em peso de talco como uma substância inerte e que fragmenta a mistura em um moinho de martelo.

2. Pó dispersível

[0275] É obtido um pó molhável prontamente dispersível em água, pela mistura de 25 partes em peso de um composto da fórmula (I), 64 partes em peso de quartzo contendo

caulino como uma substância inerte, 10 partes em peso de lignossulfonato de potássio e 1 parte em peso de oleoilmetiltaurato de sódio como agente umectante e dispersante, e trituração da mistura em um moinho de disco fixo.

3. Concentrado de dispersão

[0276] Um concentrado de dispersão facilmente dispersível em água é obtido misturando-se 20 partes em peso de um composto da fórmula (I) e/ou seus sais com 6 partes em peso de alquilfenol poliglicol éter (®Triton X 207), 3 partes em peso de isotridecanol poliglicol éter (8 EO) e 71 partes em peso de óleo mineral parafínico (faixa de ebulição, por exemplo, cerca de 255 a mais que 277 °C) e triturando-se a mistura em um moinho de esferas de fricção até uma finura abaixo de 5 microns.

4. Concentrado emulsificável

[0277] Um concentrado emulsificante é obtido a partir de 15 partes em peso de um composto da fórmula (I), 75 partes em peso de cicloexanona como solvente e 10 partes em peso de nonilfenol etoxilado como um emulsificante.

5. Grânulos dispersíveis em água

[0278] Grânulos dispersíveis em água são obtidos pela mistura

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

10 partes em peso de lignossulfonato de cálcio,

5 partes em peso de laurilsulfato de sódio,

3 partes em peso de álcool polivinílico e

7 partes em peso de caulim,

trituração da mistura em um moinho de disco fixo, e trituração do pó em um leito fluidizado por aplicação por

aspersão de água como um líquido de granulação.

[0279] Grânulos dispersíveis em água também são obtidos por homogeneização e pré-fragmentação, em um moinho coloidal,

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

5 partes em peso de 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-dissulfonato de sódio,

2 partes em peso de oleoilmetiltaurinato de sódio,

1 parte em peso de álcool polivinílico,

17 partes em peso de carbonato de cálcio e

50 partes em peso de água,

então, triturando-se a mistura em um moinho de esferas e atomizando e secando a suspensão então obtida em uma torre de aspersão por meio de um bocal de uma fase.

C. Exemplos biológicos

Descrição de teste

1. Ação herbicida pré-emergência contra plantas prejudiciais e compatibilidade de planta de cultura

[0280] As sementes de plantas de ervas daninhas monocotiledôneas e dicotiledôneas e plantas de cultura são dispostas em potes de fibra de plástico ou madeira e cobertas com solo. Os compostos da invenção, formulados na forma de pós molháveis (WP) ou como concentrados de emulsão (EC), são então aplicados na superfície do solo de cobertura como suspensão ou emulsão aquosa com adição de 0,5 % de aditivo a uma taxa de aplicação de água de 600 l/ha (convertida). Após o tratamento, os potes são colocados em uma estufa e mantidos em boas condições de crescimento para as plantas do ensaio. Após cerca de 3 semanas, o efeito das preparações é avaliada visualmente

em comparação com controles não tratados como porcentagens. Por exemplo, 100 % de atividade = as plantas morreram, 0 % de atividade = como plantas de controle.

[0281] Nas tabelas abaixo, as abreviações a seguir são usadas:

Plantas indesejadas/ervas daninhas:

ABUTH: *Abutilon theophrasti* ALOMY: *Alopecurus myosuroides*

AMARE: *Amaranthus retroflexus* AVEFA: *Avena fatua*

CYPES: *Cyperus esculentus* ECHCG: *Echinochloa crus-gali*

HORMU: *Hordeum murinum* LOLRI: *Lolium rigidum*

PHBPU: *Pharbitis purpurea* POLCO: *Polygonum convolvulus*

SETVI: *Setaria viridis* STEME: *Stellaria media*

VERPE: *Veronica persica* VIOTR: *Viola tricolor*

Tabela C1: Atividade herbicida pré-emergência em % contra ALOMY

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	ALOMY
I-17	80	90
I-11	80	100
I-16	80	100
I-18	80	100
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	100
I-24	80	100
I-14	80	100
I-15	80	100

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	ALOMY
I - 21	80	100
I - 26	80	100
I - 25	80	100
I - 20	80	100
I - 22	80	100
I - 10	80	100
I - 02	80	90
I - 27	80	90
I - 08	80	90
I - 04	80	80

Tabela C2: Atividade herbicida pré-emergência em % contra AVEVA

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	AVEFA
I - 17	80	100
I - 11	80	100
I - 16	80	100
I - 18	80	90
I - 12	80	100
I - 13	80	100
I - 23	80	100
I - 24	80	100
I - 14	80	90
I - 15	80	90
I - 21	80	100
I - 26	80	90

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	AVEFA
I - 25	80	90
I - 20	80	100
I - 22	80	100
I - 10	80	80
I - 19	80	90
I - 02	80	100
I - 05	80	100
I - 27	80	80

Tabela C3: Atividade herbicida pré-emergência em % contra CYPES

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	CYPES
I - 16	80	100
I - 09	80	100

Tabela C4: Atividade herbicida pré-emergência em % contra ECHCG

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	ECHCG
I - 17	80	100
I - 11	80	100
I - 16	80	100
I - 18	80	90
I - 12	80	100
I - 13	80	100

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	ECHCG
I - 23	80	100
I - 24	80	90
I - 14	80	100
I - 15	80	90
I - 21	80	100
I - 26	80	90
I - 25	80	80
I - 20	80	100
I - 10	80	80
I - 19	80	80
I - 02	80	100
I - 07	80	100

Tabela C5: Atividade herbicida pré-emergência em % contra LOLRI

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	LOLRI
I - 17	80	100
I - 11	80	100
I - 16	80	100
I - 18	80	100
I - 12	80	100
I - 13	80	100
I - 23	80	100
I - 24	80	100
I - 14	80	100
I - 15	80	100

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	LORI
I - 21	80	100
I - 26	80	100
I - 25	80	100
I - 20	80	100
I - 22	80	100
I - 10	80	100
I - 19	80	100

Tabela C6: Atividade herbicida pré-emergência em % contra SETVI

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	SETVI
I - 17	80	100
I - 11	80	100
I - 16	80	100
I - 18	80	100
I - 12	80	100
I - 13	80	100
I - 23	80	100
I - 24	80	100
I - 14	80	100
I - 15	80	100
I - 21	80	100
I - 26	80	90
I - 25	80	100
I - 20	80	100
I - 22	80	100

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	SETVI
I-10	80	90
I-19	80	90
I-05	80	90

Tabela C7: Atividade herbicida pré-emergência em % contra ABUTH

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	ABUTH
I-17	80	80
I-11	80	100
I-07	80	100

Tabela C8: Atividade herbicida pré-emergência em % contra AMARE

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	AMARE
I-17	80	100
I-11	80	100
I-16	80	100
I-18	80	100
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	100
I-24	80	100
I-14	80	100
I-15	80	100

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	AMARE
I - 21	80	100
I - 26	80	100
I - 25	80	100
I - 20	80	100
I - 22	80	100
I - 10	80	90
I - 02	80	100

Tabela C9: Atividade herbicida pré-emergência em % contra PHBPU

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	PHBPU
I - 17	80	90
I - 11	80	90
I - 16	80	90
I - 18	80	90
I - 12	80	90
I - 13	80	90
I - 23	80	90
I - 24	80	90
I - 14	80	90
I - 21	80	90
I - 25	80	90
I - 20	80	80

Tabela C10: Atividade herbicida pré-emergência em % contra POLCO

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	POLCO
I - 17	80	100
I - 11	80	100
I - 16	80	100
I - 18	80	100
I - 12	80	100
I - 13	80	100
I - 23	80	100
I - 24	80	90
I - 14	80	100
I - 15	80	100
I - 21	80	100
I - 26	80	90
I - 25	80	100
I - 20	80	100
I - 22	80	100
I - 10	80	90
I - 19	80	90
I - 05	80	90
I - 04	80	90
I - 03	80	80

Tabela C11: Atividade herbicida pré-emergência em % contra STEME

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	STEME
I - 17	80	100
I - 11	80	100

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	STEME
I -16	80	100
I -18	80	100
I -12	80	100
I -13	80	100
I -23	80	100
I -24	80	90
I -14	80	90
I -15	80	100
I -21	80	90
I -26	80	100
I -25	80	100
I -20	80	100
I -22	80	90
I -10	80	90
I -19	80	90
I -02	80	100
I -05	80	80
I -27	80	90
I -03	80	80

Tabela C12: Atividade herbicida pré-emergência em % contra VIOTR

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	VIOTR
I -17	80	100
I -11	80	100
I -16	80	100

I - 18	80	100
I - 12	80	100
I - 13	80	100
I - 23	80	90
I - 24	80	90
I - 14	80	100
I - 15	80	100
I - 21	80	100
I - 26	80	80
I - 25	80	100
I - 20	80	100
I - 22	80	100
I - 19	80	80
I - 05	80	100

Tabela C13: Atividade herbicida pré-emergência em % contra VERPE

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	VERPE
I - 17	80	100
I - 11	80	90
I - 16	80	90
I - 18	80	90
I - 12	80	100
I - 13	80	90
I - 23	80	90
I - 24	80	90
I - 14	80	90
I - 15	80	100

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	VERPE
I - 21	80	90
I - 26	80	80
I - 25	80	90
I - 22	80	100
I - 02	80	90
I - 08	80	90

Tabela C14: Atividade herbicida pré-emergência em % contra HORMU

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	HORMU
I - 17	80	100
I - 11	80	90
I - 16	80	100
I - 18	80	100
I - 12	80	100
I - 13	80	100
I - 23	80	90
I - 24	80	100
I - 14	80	90
I - 15	80	90
I - 21	80	90
I - 26	80	90
I - 20	80	100
I - 22	80	100
I - 10	80	100
I - 19	80	100

[0282] Conforme mostrado pelos resultados, os compostos de acordo com a invenção como, por exemplo, os compostos nº I-02 e outros compostos das tabelas (I-05, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-28, I-29) têm, quando usados para tratamento pós-emergência, atividade muito boa (80 % a 100 % de ação herbicida) contra plantas prejudiciais como *Abutilon theophrasti*, *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Cyperus esculentus*, *Echinochloa crus-gali*, *Hordeum murinum*, *Lolium rigidum*, *Pharbitis purpurea*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Stellaria media*, *Veronica persica* e *Viola tricolor* a uma taxa de aplicação de 0,08 kg de substância ativa ou menos por hectare.

2. Ação herbicida pós-emergência contra plantas prejudiciais e compatibilidade de planta de cultura

[0283] As sementes de ervas daninhas e plantas de cultura monocotiledôneas e dicotiledôneas são dispostas em lima arenosa em potes de fibra de plástico ou madeira, cobertas com solo e cultivadas em uma estufa sob condições de crescimento controladas. 2 a 3 semanas após a semeadura, as plantas de teste são tratadas no estágio de uma folha. Os compostos da invenção, formulados na forma de pós molháveis (WP) ou como concentrados de emulsão (EC), são, então, pulverizados nas partes verdes das plantas como suspensão ou emulsão aquosa com adição de 0,5 % de aditivo a uma taxa de aplicação de água de 600 l/ha (convertida). Após as plantas de teste terem permanecido na estufa sob condições de crescimento ideais durante cerca de 3 semanas,

a atividade das preparações é classificada visualmente em comparação com controles não tratados. Por exemplo, 100 % de atividade = as plantas morreram, 0 % de atividade = como plantas de controle.

Tabela C15: Atividade herbicida pós-emergência em % contra ALOMY

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	ALOMY
I - 23	320	90
I - 19	320	90
I - 18	320	90
I - 20	320	100
I - 12	320	90
I - 21	320	90
I - 28	320	90
I - 24	320	100
I - 29	320	90
I - 22	320	100
I - 26	320	100
I - 16	320	90
I - 13	320	90
I - 14	320	90
I - 15	320	100
I - 05	320	90
I - 17	320	90
I - 27	320	90
I - 11	320	90
I - 25	320	100
I - 10	320	100

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	ALOMY
I - 04	320	90
I - 02	320	100
I - 03	320	80
I - 06	320	90
I - 08	320	90

Tabela C16: Atividade herbicida pós-emergência em % contra AVEFA

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	AVEFA
I - 23	320	100
I - 19	320	90
I - 18	320	90
I - 20	320	100
I - 12	320	100
I - 21	320	100
I - 28	320	100
I - 24	320	100
I - 29	320	90
I - 22	320	100
I - 26	320	100
I - 13	320	90
I - 14	320	80
I - 15	320	100
I - 05	320	80
I - 17	320	90
I - 27	320	100

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	AVEFA
I - 11	320	90
I - 25	320	90
I - 10	320	90
I - 04	320	100
I - 02	320	90
I - 03	320	90
I - 06	320	90
I - 08	320	80

Tabela C17: Atividade herbicida pós-emergência em % contra ECHCG

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	ECHCG
I - 23	320	90
I - 19	320	90
I - 18	320	90
I - 20	320	100
I - 12	320	90
I - 21	320	90
I - 28	320	90
I - 24	320	100
I - 29	320	90
I - 22	320	100
I - 26	320	100
I - 16	320	90
I - 13	320	90
I - 14	320	80

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	ECHCG
I - 15	320	90
I - 05	320	90
I - 17	320	80
I - 27	320	100
I - 11	320	90
I - 10	320	90
I - 04	320	80
I - 02	320	80
I - 03	320	80

Tabela C18: Atividade herbicida pós-emergência em % contra LOLRI

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	LOLRI
I - 23	320	100
I - 19	320	90
I - 18	320	90
I - 20	320	100
I - 12	320	90
I - 21	320	90
I - 28	320	100
I - 24	320	100
I - 29	320	90
I - 22	320	100
I - 26	320	100
I - 16	320	90
I - 13	320	90

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	LORI
I - 14	320	90
I - 15	320	90
I - 17	320	90
I - 27	320	90
I - 11	320	90
I - 25	320	100
I - 10	320	90

Tabela C19: Atividade herbicida pós-emergência em % contra SETVI

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	SETVI
I - 23	320	80
I - 19	320	90
I - 18	320	90
I - 20	320	90
I - 21	320	90
I - 28	320	90
I - 24	320	80
I - 29	320	90
I - 22	320	90
I - 26	320	80
I - 16	320	80
I - 13	320	90
I - 15	320	80
I - 05	320	80
I - 17	320	90

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	SETVI
I - 27	320	80
I - 11	320	90
I - 25	320	80
I - 10	320	90
I - 04	320	90
I - 02	320	90
I - 03	320	90
I - 06	320	80

Tabela C20: Atividade herbicida pós-emergência em % contra ABUTH

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	ABUTH
I - 23	320	80
I - 19	320	90
I - 18	320	90
I - 20	320	80
I - 12	320	80
I - 21	320	90
I - 28	320	80
I - 24	320	80
I - 29	320	90
I - 22	320	80
I - 26	320	80
I - 16	320	80
I - 13	320	80
I - 14	320	90

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	ABUTH
I - 15	320	80
I - 05	320	80
I - 11	320	80
I - 25	320	80
I - 02	320	80

Tabela C21: Atividade herbicida pós-emergência em % contra AMARE

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	AMARE
I - 23	320	80
I - 19	320	90
I - 18	320	90
I - 20	320	90
I - 12	320	80
I - 21	320	90
I - 28	320	80
I - 24	320	80
I - 29	320	90
I - 22	320	90
I - 26	320	80
I - 16	320	90
I - 13	320	80
I - 14	320	80
I - 05	320	80
I - 17	320	90
I - 25	320	80

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	AMARE
I-10	320	80
I-03	320	80
I-06	320	80

Tabela C22: Atividade herbicida pós-emergência em % contra PHBPU

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	PHBPU
I-23	320	80
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	90
I-12	320	80
I-21	320	90
I-28	320	90
I-24	320	90
I-29	320	90
I-22	320	90
I-26	320	90
I-16	320	80
I-13	320	80
I-14	320	80
I-15	320	80
I-05	320	80
I-17	320	80
I-27	320	90
I-11	320	80

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	PHBPU
I - 25	320	90
I - 10	320	90
I - 04	320	80
I - 02	320	90
I - 03	320	80
I - 06	320	80
I - 08	320	80
I - 07	320	80
I - 09	320	80

Tabela C23: Atividade herbicida pós-emergência em % contra POLCO

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	POLCO
I - 23	320	90
I - 19	320	90
I - 18	320	90
I - 20	320	80
I - 12	320	80
I - 21	320	90
I - 28	320	80
I - 24	320	80
I - 29	320	90
I - 22	320	80
I - 26	320	80
I - 13	320	80
I - 14	320	80

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	POLCO
I - 15	320	90
I - 05	320	80
I - 17	320	80
I - 27	320	80
I - 11	320	80
I - 25	320	80
I - 04	320	80
I - 03	320	80
I - 06	320	80
I - 08	320	80
I - 07	320	80

Tabela C24: Atividade herbicida pós-emergência em % contra STEME

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	STEME
I - 23	320	90
I - 19	320	90
I - 18	320	90
I - 20	320	80
I - 12	320	90
I - 21	320	90
I - 28	320	90
I - 24	320	100
I - 29	320	90
I - 22	320	80
I - 26	320	100

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	STEME
I - 16	320	90
I - 13	320	90
I - 14	320	90
I - 15	320	90
I - 05	320	80
I - 17	320	90
I - 27	320	90
I - 11	320	90
I - 25	320	90
I - 10	320	80
I - 04	320	80
I - 02	320	90
I - 03	320	90
I - 06	320	80

Tabela C25: Atividade herbicida pós-emergência em % contra VIOTR

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	VIOTR
I - 23	320	80
I - 19	320	90
I - 18	320	80
I - 20	320	80
I - 12	320	80
I - 21	320	90
I - 28	320	90
I - 24	320	90

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	VIOTR
I - 29	320	90
I - 22	320	80
I - 26	320	90
I - 16	320	80
I - 13	320	80
I - 14	320	100
I - 15	320	80
I - 05	320	80
I - 17	320	80
I - 27	320	80
I - 11	320	80
I - 04	320	80
I - 02	320	80
I - 03	320	80

Tabela C26: Atividade herbicida pós-emergência em % contra VERPE

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	VERPE
I - 23	320	80
I - 19	320	80
I - 18	320	80
I - 20	320	80
I - 12	320	80
I - 21	320	80
I - 28	320	90
I - 24	320	80

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	VERPE
I - 29	320	90
I - 22	320	80
I - 26	320	80
I - 16	320	80
I - 13	320	80
I - 14	320	90
I - 15	320	80
I - 05	320	80
I - 17	320	80
I - 27	320	80
I - 11	320	80
I - 25	320	80
I - 10	320	80
I - 04	320	80
I - 02	320	80
I - 03	320	90
I - 06	320	80
I - 08	320	80

Tabela C27: Atividade herbicida pós-emergência em % contra HORMU

Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	HORMU
I - 23	320	100
I - 19	320	90
I - 18	320	90
I - 20	320	100

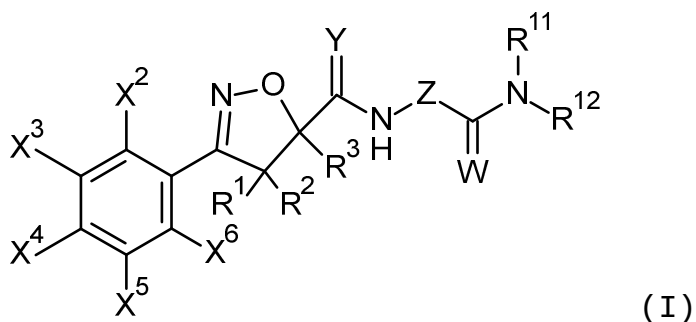
Número do Exemplo	Dosagem [g/ha]	HORMU
I-12	320	90
I-21	320	100
I-28	320	90
I-24	320	100
I-29	320	90
I-22	320	100
I-26	320	100
I-16	320	80
I-13	320	90
I-14	320	80
I-15	320	90
I-17	320	80
I-27	320	100
I-25	320	90
I-10	320	90

[0284] Conforme mostrado pelos resultados, os compostos de acordo com a invenção como, por exemplo, os compostos nº I-02 e outros compostos das tabelas (I-04, I-10, I-15, I-18, I-19, I-20, I-21, I-21, I-22, I-23, I-24, I-26, I-27, I-28, I-29) têm, quando usados para tratamento pós-emergência, atividade muito boa (80 % a 100 % de ação herbicida) contra plantas prejudiciais como *Abutilon theophrasti*, *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Echinochloa crus-gali*, *Hordeum murinum*, *Lolium rigidum*, *Pharbitis purpurea*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Stellaria media*, *Veronica*

persica e *Viola tricolor* a uma taxa de aplicação de 0,32 kg de substância ativa ou menos por hectare.

REIVINDICAÇÕES

1. 3-Fenilisoxazolina-5-carboxamida ou -5-tioamida caracterizada por ser da fórmula geral (I)



ou um sal agroquimicamente aceitável da mesma em que R¹ e R² independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio ou ciano,

ou

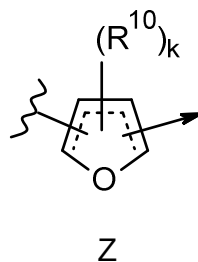
representam (C₁-C₄)-alquila ou (C₁-C₄)-alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em halogênio e ciano;

R³ representa (C₁-C₅)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₂-C₅)-alquenila, (C₂-C₅)-alquinila ou (C₁-C₅)-alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano, (C₁-C₅)-alcóxi e hidróxi;

Y representa oxigênio ou enxofre;

W representa oxigênio ou enxofre;

Z representa um anel de furano totalmente saturado ou parcialmente saturado que é substituído por k radicais do grupo R¹⁰,



em que a seta em cada caso denota uma ligação ao grupo C=W da fórmula (I);

R^{10} representa halogênio, ciano ou CO_2R_7 ,

ou

representa (C_1-C_2) -alquila ou (C_1-C_2) -alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro;

R^{11} , R^{12} independentemente um do outro representam hidrogênio, ciano, OR^7 , $S(O)_n R^5$, $SO_2NR^6R^7$, CO_2R^8 , $CONR^6R^8$, COR^6 , NR^6R^8 , NR^6COR^8 , $NR^6CONR^8R^8$, $NR^6CO_2R^8$, $NR^6SO_2R^8$, $NR^6SO_2NR^6R^8$, $C(R^6)=NOR^8$, arila opcionalmente substituída, heteroarila opcionalmente substituída ou heterociclila opcionalmente substituída, ou

representam (C_1-C_{12}) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_7) -cicloalquil- (C_1-C_7) -alquila, (C_2-C_{12}) -alquenila, (C_5-C_7) -cicloalquenila ou (C_2-C_{12}) -alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano, nitro, OR^7 , $S(O)_n R^5$, $SO_2NR^6R^7$, CO_2R^8 , $CONR^6R^8$, COR^6 , NR^6R^8 , NR^6COR^8 , $NR^6CONR^8R^8$, $NR^6CO_2R^8$, $NR^6SO_2R^8$, $NR^6SO_2NR^6R^8$, $C(R^6)=NOR^8$, arila

opcionalmente substituída, heteroarila
opcionalmente substituída ou heterociclila
opcionalmente substituída,
ou

R¹¹ e R¹² juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual os mesmos são fixados formam um anel de cinco, seis ou sete membros saturado, parcial ou totalmente insaturado que é opcionalmente mono- a hexassubstituído por radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano, nitro, (C₁-C₆)-alquila, halo-(C₁-C₆)-alquila, oxo, OR⁷, S(O)_n R⁵, SO₂NR⁶R⁷, CO₂R⁸, CONR⁶R⁸, COR⁶, NR⁶R⁸, NR⁶COR⁸, NR⁶CONR⁸R⁸, NR⁶CO₂R⁸, NR⁶SO₂R⁸, NR⁶SO₂NR⁶R⁸, C(R⁶)=NOR⁸ e que, além desse átomo de nitrogênio, contém r átomos de carbono, n átomos de oxigênio, p átomos de enxofre e p elementos do grupo que consiste em NR⁷ e NCOR⁷ como átomos de anel;

X², X⁴ e X⁶ independentemente um do outro representam, cada um, hidrogênio, halogênio ou ciano,

ou

representam (C₁-C₂)-alquila, em cada caso, substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo e (C₁-C₂)-alcóxi;

X³ e X⁵ independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, hidróxi, ciano, nitro, S(O)_n R⁶ ou CO₂R⁷,

ou

representam (C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₃)-alcóxi,

(C₃-C₄)-cicloalquila, (C₂-C₃)-alquenila ou (C₂-C₃)-alquinila, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e bromo;

R⁵ representa (C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila ou arila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano e hidróxi;

R⁶ representa hidrogênio ou R⁵;

R⁷ representa hidrogênio,

ou

representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₃-C₄)-alquenila ou (C₃-C₄)-alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano e (C₁-C₂)-alcóxi;

R⁸ representa hidrogênio,

ou

representa (C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₃-C₈)-alquenila ou (C₃-C₈)-alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em halogênio, ciano e (C₁-C₂)-alcóxi;

k representa o número sequencial 0, 1 ou 2;

m representa o número sequencial 0, 1, 2, 3, 4 ou

5;

n representa o número sequencial 0, 1 ou 2;

p representa o número sequencial 0 ou 1; e

r representa o número sequencial 3, 4, 5 ou 6.

2. Composto da fórmula geral (I), de acordo com a

reivindicação 1, **caracterizado pelo** fato de que R^1 e R^2 independentemente um do outro representam, cada um, hidrogênio, flúor, cloro ou ciano,

ou

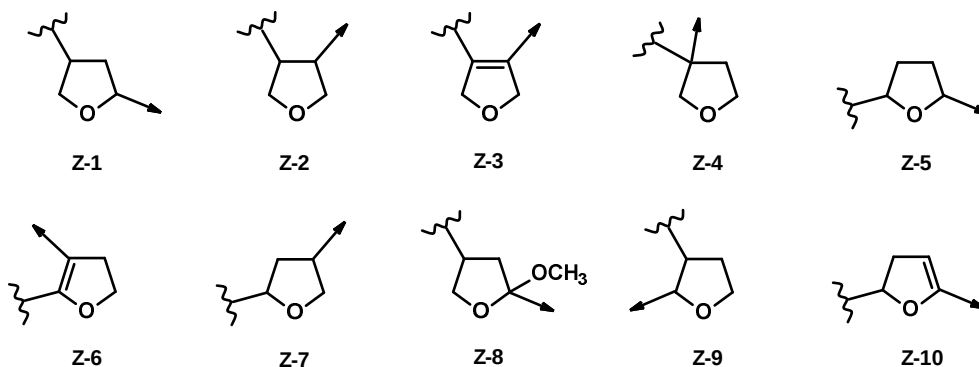
representam (C_1-C_3) -alquila ou (C_1-C_3) -alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo e ciano.

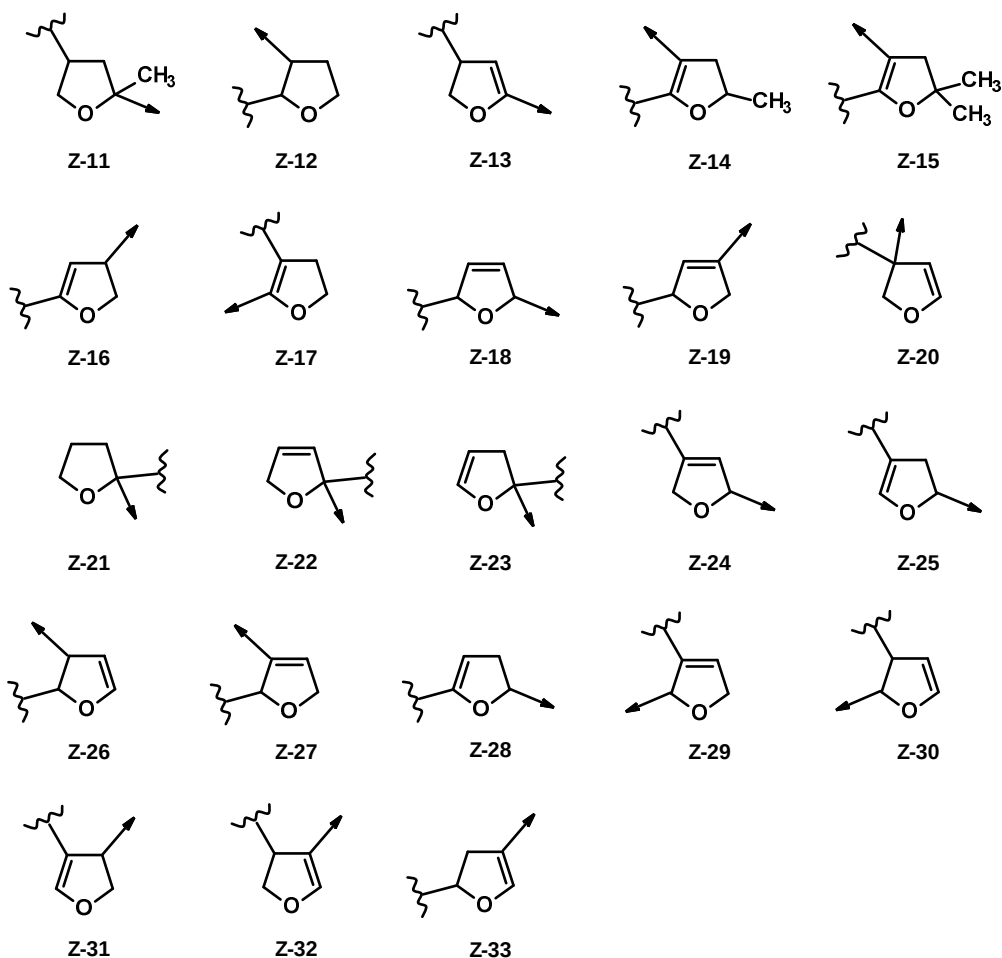
3. Composto da fórmula geral (I), de acordo com a reivindicação 1 ou 2, **caracterizado pelo** fato de que R^3 representa (C_1-C_4) -alquila, (C_3-C_5) -cicloalquila, (C_2-C_4) -alquenila, (C_2-C_4) -alquinila ou (C_1-C_4) -alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo, ciano, (C_1-C_4) -alcóxi e hidróxi.

4. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 3, **caracterizado pelo** fato de que Y representa oxigênio.

5. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 4, **caracterizado pelo** fato de que W representa oxigênio.

6. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 5, **caracterizado pelo** fato de que Z representa um grupo Z-1 a Z-33, em que Z-1 a Z-33 têm o seguinte significado:





em que a seta em cada caso denota uma ligação ao grupo C=W da fórmula (I).

7. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 6, **caracterizado pelo** fato de que R^{10} representa flúor, cloro, ciano, CO_2H , CO_2CH_3 ou $CO_2CH_2CH_3$,

ou

representa (C_1-C_2) -alquila ou (C_1-C_2) -alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro.

8. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 7, **caracterizado pelo**

fato de que R^{11} representa hidrogênio,

ou

representa (C_1-C_3) -alquila ou (C_3-C_6) -cicloalquila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro.

9. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 8, **caracterizado pelo** fato de que R^{12} representa hidrogênio, ciano ou hidróxi,

ou

representa OR^7 , $S(O)_n$, R^5 , NR^6R^8 , $NR^6CO_2R^8$, (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_2-C_3) -alquenila ou (C_2-C_3) -alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo, ciano e hidróxi.

10. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 9, **caracterizado pelo** fato de que R^{11} e R^{12} juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual os mesmos são fixados formam um anel de cinco ou seis membros saturado, parcial ou totalmente insaturado que, além desse átomo de nitrogênio, contém r átomos de carbono, n átomos de oxigênio e p elementos do grupo que consiste em NR^7 e $NCOR^7$ como átomos de anel, em que um átomo de carbono carrega p grupos oxo.

11. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 10, **caracterizado pelo** fato de que X^2 , X^4 e X^6 independentemente um do outro representam, cada um, hidrogênio, flúor, cloro, bromo ou ciano,

ou

representam metila ou metóxi, cada um dos quais é

substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro.

12. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 11,

caracterizado pelo fato de que X^3 e X^5 independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, hidróxi ou ciano,
ou

representam (C_1-C_3) -alquila, (C_1-C_3) -alcóxi, (C_3-C_4) -cicloalquila, (C_2-C_3) -alquenila ou (C_2-C_3) -alquinila, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e bromo.

13. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 12, **caracterizado pelo** fato de que R^5 representa (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_6) -cicloalquila ou arila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e hidróxi.

14. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 13, **caracterizado pelo** fato de que R^7 representa hidrogênio,

ou

representa (C_1-C_6) -alquila ou (C_3-C_6) -cicloalquila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e (C_1-C_2) -alcóxi.

15. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 14, **caracterizado pelo** fato de que R^8 representa hidrogênio,

ou

representa (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_6) -cicloalquila ou

arila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e (C₁-C₂)-alcóxi.

16. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 15, **caracterizado pelo** fato de que o número sequencial m é 0, 1, 2 ou 3.

17. Composto da fórmula geral (I), de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 16, **caracterizado pelo** fato de que

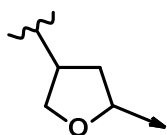
R¹ e R² representam, cada um, hidrogênio;

R³ representa (C₁-C₃)-alquila, (C₃-C₄)-cicloalquila, (C₂-C₃)-alquenila, (C₂-C₃)-alquinila ou (C₁-C₃)-alcóxi, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo, ciano, (C₁-C₂)-alcóxi e hidróxi;

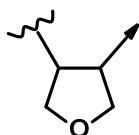
Y representa oxigênio;

W representa oxigênio;

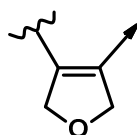
Z representa um grupo Z-1 a Z-4, em que Z-1 a Z-4 têm o seguinte significado:



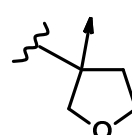
Z-1



Z-2



Z-3



Z-4

em que a seta em cada caso denota uma ligação ao grupo C=W da fórmula (I);

R¹¹ representa hidrogênio,

ou

representa (C₁-C₃)-alquila ou (C₃-C₆)-cicloalquila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor e cloro;

- R¹² representa hidrogênio, ciano ou hidróxi,
ou
representa OR⁷, S(O)_n R⁵, NR⁶R⁸, NR⁶CO₂R⁸, (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₂-C₃)-alquenila ou (C₂-C₃)-alquinila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo, ciano e hidróxi;
ou
- R¹¹ e R¹² juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual os mesmos são fixados formam um anel de cinco ou seis membros saturado, parcial ou totalmente insaturado que, além desse átomo de nitrogênio, contém r átomos de carbono, n átomos de oxigênio e p elementos do grupo que consiste em NR⁷ e NCOR⁷ como átomos de anel, em que um átomo de carbono carrega p grupos oxo;
- X², X⁴ e X⁶ independentemente um do outro representam, cada um, hidrogênio ou flúor;
- X³ e X⁵ independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, hidróxi ou ciano,
ou
representam (C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₃)-alcóxi, (C₃-C₄)-cicloalquila, (C₂-C₃)-alquenila ou (C₂-C₃)-alquinila, cada um dos quais é substituído por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e bromo;
- R⁵ representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila ou arila, cada uma das quais é substituída por m

radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e hidróxi;

R⁶ representa hidrogênio ou R⁵;

R⁷ representa hidrogênio,
ou

representa (C₁-C₆)-alquila ou (C₃-C₆)-cicloalquila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e (C₁-C₂)-alcóxi;

R⁸ representa hidrogênio,
ou

representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila ou arila, cada uma das quais é substituída por m radicais do grupo que consiste em flúor, cloro e (C₁-C₂)-alcóxi;

m representa o número sequencial 0, 1, 2 ou 3;

n representa o número sequencial 0, 1 ou 2;

p representa o número sequencial 0 ou 1; e

r representa o número sequencial 3, 4 ou 5.

18. Composição herbicida ou composição reguladora de crescimento de plantas **caracterizada por** compreender um ou mais compostos da fórmula geral (I) ou seus sais conforme definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 17.

19. Composição herbicida, de acordo com a reivindicação 18, **caracterizada por** compreender adicionalmente uma formulação auxiliar.

20. Composição herbicida, de acordo com a reivindicação 18 ou 19, **caracterizada por** compreender pelo menos um composto ativo adicional do grupo de inseticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, protetores e/ou

reguladores de crescimento.

21. Composição herbicida, de acordo com a reivindicação 19 ou 20, **caracterizada por** compreender um fitoprotetor.

22. Composição herbicida, de acordo com a reivindicação 21, **caracterizada pelo** fato de que o fitoprotetor é selecionado a partir do grupo que consiste em mefenpir-dietila, ciprosulfamida, isoxadifen-etila, cloquintocet-mexila, benoxacor e diclormida.

23. Método de controle de plantas indesejadas **caracterizado pelo** fato de que uma quantidade eficaz de pelo menos um composto da fórmula (I) conforme definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 17, ou de uma composição herbicida conforme definida em qualquer uma das reivindicações 18 a 22, é aplicada às plantas ou ao local da vegetação indesejada.

24. Uso **caracterizado por** ser de compostos da fórmula (I) conforme definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 17, ou das composições herbicidas conforme definidas em qualquer uma das reivindicações 18 a 22, para o controle de plantas indesejadas.

25. Uso, de acordo com a reivindicação 24, **caracterizado pelo** fato de que os compostos da fórmula (I) são usados para controlar plantas indesejadas em culturas de plantas úteis.

26. Uso, de acordo com a reivindicação 25, **caracterizado pelo** fato de que as plantas úteis são plantas úteis transgênicas.

RESUMO

**“3-FENILISOXAZOLINA-5-CARBOXAMIDAS HERBICIDAMENTE ATIVAS
DE TETRA-HIDRO- E DI-HIDROFURANCARBOXAMIDAS”**

A invenção se refere a 3-fenilisoaxazolina-4-carboxamidas de tetra-hidro e di-hidrofuran carboxamidas da fórmula geral (I) e a seus sais agroquimicamente compatíveis (I) assim como ao uso das mesmas no campo de proteção de planta.