

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

(21) **PI0711655-1 A2**



(22) Data de Depósito: 10/05/2007
(43) Data da Publicação: 29/11/2011
(RPI 2134)

(51) *Int.Cl.:*
C07C 233/78
C07C 233/87
A01N 37/18
A01N 41/12
C07C 271/12
C07C 275/24
C07C 311/05
C07C 311/55
C07C 335/08

(54) **Título:** COMPOSTO, PROCESSO PARA PREPARAR COMPOSTOS, COMPOSIÇÃO, PROCESSO PARA PREPARAR COMPOSIÇÕES, PROCESSO PARA COMBATER VEGETAÇÃO INDESEJADA, E, USO DO COMPOSTO

(30) **Prioridade Unionista:** 19/05/2006 EP 06114235.2

(73) **Titular(es):** Basf SE

(72) **Inventor(es):** Andrea Vescovi, Bernd Sievernich, Cyrill Zagar, Eike Hupe, Frank Stelzer, Klaus Grossmann, Lilliana Parra Rapado, Matthias Witschel, Robert Reinhard, Thomas Ehrhardt, Toralf Kühn, William Karl Moberg

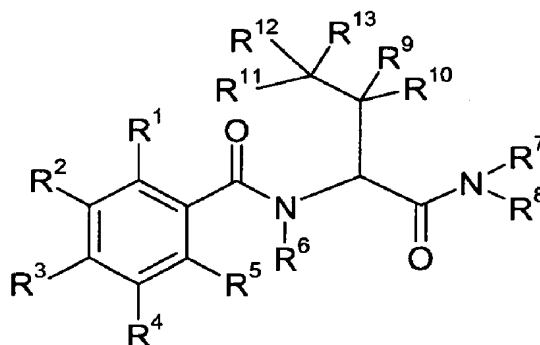
(74) **Procurador(es):** Momsen, Leonardos & CIA.

(86) **Pedido Internacional:** PCT EP2007054509 de 10/05/2007

(87) **Publicação Internacional:** WO 2007/134971 de 29/11/2007

(57) **Resumo:** COMPOSTO, PROCESSO PARA PREPARAR COMPOSTOS, COMPOSIÇÃO, PROCESSO PARA PREPARAR COMPOSIÇÕES, PROCESSO PARA COMBATER VEGETAÇÃO INDESEJADA, E, USO DO COMPOSTO. A invenção refere-se a alaninas substituídas por benzoila de fórmula (I), em que as variáveis R^1 a R^{13} são definidas como citado na descrição, e a seus sais agriculturalmente utilizáveis. A invenção também refere-se a processos e intermediários para a produção de referidos compostos, ao uso de referidos compostos ou a agentes contendo os últimos para combater plantas indesejáveis.

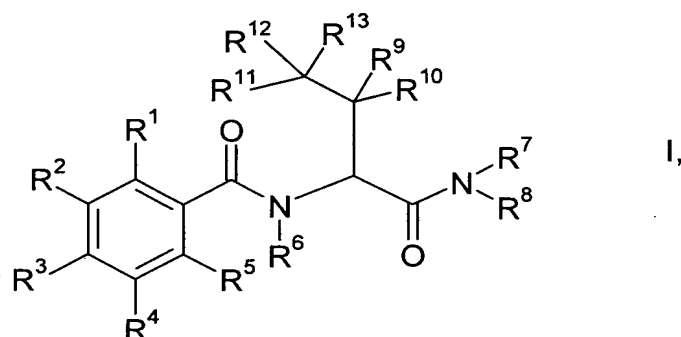
(I)





“COMPOSTO, PROCESSO PARA PREPARAR COMPOSTOS, COMPOSIÇÃO, PROCESSO PARA PREPARAR COMPOSIÇÕES, PROCESSO PARA COMBATER VEGETAÇÃO INDESEJADA, E, USO DO COMPOSTO”

5 A presente invenção refere-se a alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I



em que as variáveis são como definidas abaixo:

10 R^1 é halogênio, ciano, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -haloalquila ou C_1 - C_6 -haloalcóxi;

R^2, R^3, R^4, R^5 são hidrogênio, halogênio, ciano, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -haloalquila, C_1 - C_6 -alcóxi ou C_1 - C_6 -haloalcóxi;

R^6, R^7 são hidrogênio, hidroxila ou C_1 - C_6 -alcóxi;

R^8 é C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_4 -cianoalquila ou C_1 - C_6 -haloalquila;

15 R^9 é hidrogênio ou C_1 - C_6 -alquila;

R^{10} é hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_2 - C_6 -alquenila, C_2 - C_6 -alquinila, C_1 - C_6 -haloalquila, C_2 - C_6 -haloalquenila, C_2 - C_6 -haloalquinila, C_1 - C_6 -cianoalquila, C_2 - C_6 -cianoalquenila, C_2 - C_6 -cianoalquinila, C_1 - C_6 -hidroxialquila, C_2 - C_6 -hidroxialquenila, C_2 - C_6 -hidroxialquinila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_3 - C_6 -cicloalquenila, heterociclila de 3 a 6 membros,

20 onde os radicais cicloalquila, cicloalquenila ou heterociclila de 3 a 6 membros acima mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três radicais dentre o grupo consistindo de oxo, ciano, nitro, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -haloalquila, hidroxila,
25 C_1 - C_6 -alcóxi, C_1 - C_6 -haloalcóxi, hidroxicarbonila, C_1 - C_6 -alcoxicarbonila,

hidroxicarbonil-C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-alcoxicarbonil-C₁-C₆-alcóxi, amino, C₁-C₆-alquilamino, di(C₁-C₆-alquil)amino, C₁-C₆-alquilsulfonilamino, C₁-C₆-haloalquilsulfonilamino, aminocarbonilamino, (C₁-C₆-alquilamino)carbonilamino, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino, arila e
 5 aril(C₁-C₆-alquila);

C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alqueniloxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alquiniloxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalcóxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-haloalqueniloxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-haloalquiniloxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquiltio-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alqueniltio-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alquiniltio-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalquil-C₁-C₄-tioalquila, C₂-C₆-haloalquenil-C₁-C₄-tioalquila, C₂-C₆-haloalquinil-C₁-C₄-tioalquila, C₁-C₆-alquilsulfinil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalquilsulfinil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalquilsulfonil-C₁-C₄-alquila, amino-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquilsulfonil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfonil-(C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarbonila, hidroxicarbonila, C₁-C₆-alcoxicarbonila, aminocarbonila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, formilamino-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alcoxicarbonil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarbonil-C₁-C₆-alquila, hidroxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalcoxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarboniloxi-C₁-C₄-alquila, aminocarbonil-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonil-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonil-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquilcarbonil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarbonil(C₁-C₆-alquilamino)C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)aminocarboniloxi-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarboniloxi-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino-C₁-C₄-alquila;

fenila, fenil-C₁-C₄-alquila, fenil-C₂-C₄-alquenila, fenil-C₂-C₄-

alquinila, fenil-C₁-C₄-haloalquila, fenil-C₂-C₄-haloalquenila, fenil-C₂-C₄-haloalquinila, fenil-C₁-C₄-hidroxialquila, fenil-C₂-C₄-hidroxialquenila, fenil-C₂-C₄-hidroxialquinila, fenilcarbonil-C₁-C₄-alquila, fenilcarboniloxi-C₁-C₄-alquila, feniloxicarbonil-C₁-C₄-alquila, feniloxi-C₁-C₄-alquila, feniltio-C₁-C₄-alquila, fenilsulfinil-C₁-C₄-alquila, fenilsulfonil-C₁-C₄-alquila, heteroarila, heteroaril-C₁-C₄-alquila, heteroaril-C₂-C₄-alquenila, heteroaril-C₂-C₄-alquinila, heteroaril-C₁-C₄-haloalquila, heteroaril-C₂-C₄-haloalquenila, heteroaril-C₂-C₄-haloalquinila, heteroaril-C₁-C₄-hidroxialquila, heteroaril-C₂-C₄-hidroxialquenila, heteroaril-C₂-C₄-hidroxialquinila, heteroarilcarbonil-C₁-C₄-alquila, heteroarilcarboniloxi-C₁-C₄-alquila, heteroariloxicarbonil-C₁-C₄-alquila, heteroariloxi-C₁-C₄-alquila, heteroariltio-C₁-C₄-alquila, heteroarilsulfinil-C₁-C₄-alquila, heteroarilsulfonil-C₁-C₄-alquila,

onde os radicais fenila e heteroarila acima mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três radicais dentre o grupo consistindo de ciano, nitro, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-haloalquila, hidroxila, C₁-C₆-hidroxialquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-haloalcóxi, hidroxicarbonila, C₁-C₆-alcoxicarbonila, hidroxicarbonil-C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-alcoxicarbonil-C₁-C₆-alcóxi, amino, C₁-C₆-alquilamino, di(C₁-C₆-alquil)amino, C₁-C₆-alquilsulfonilamino, C₁-C₆-haloalquilsulfonilamino, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino, di(C₁-C₆-alquil)-aminocarbonilamino, arila e aril(C₁-C₆-alquila);

R¹¹ é OR¹⁴, NR¹⁵R¹⁶ ou NO₂;

R¹² é hidrogênio, C₁-C₆-alquila ou C₁-C₆-haloalquila;

R¹³ é hidrogênio, C₁-C₆-alquila ou C₁-C₆-haloalquila;

R¹⁴, R¹⁵ são hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₃-C₆-alquenila, C₃-C₆-alquinila, C₃-C₆-haloalquenila, C₃-C₆-haloalquinila, formila, C₁-C₆-alquilcarbonila, C₁-C₆-alquiltiocarbonila, C₃-C₆-cicloalquilcarbonila, C₂-C₆-alquenilcarbonila, C₂-C₆-alquinilcarbonila, C₁-C₆-

alcoxicarbonila, C₃-C₆-alqueniloxicarbonila, C₃-C₆-alquiniloxicarbonila, aminocarbonila, C₁-C₆-alquilaminocarbonila, C₃-C₆-alquenilaminocarbonila, C₃-C₆-alquinilaminocarbonila, C₁-C₆-alquilsulfonilaminocarbonila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, N-(C₃-C₆-alquenil)-N-(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, N-(C₃-C₆-alquinil)-N-(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, N-(C₁-C₆-alcoxi)-N-(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, N-(C₃-C₆-alquenil)-N-(C₁-C₆-alcoxi)aminocarbonila, N-(C₃-C₆-alquinil)-N-(C₁-C₆-alcoxi)aminocarbonila, [(C₁-C₆-alquil)aminocarbonil-(C₁-C₆-alquil)amino]carbonila, (C₁-C₆-alquil)aminotiocarbonila, di(C₁-C₆-alquil)aminotiocarbonila, (C₁-C₆-alquil)cianoimino, (amino)cianoimino, (C₁-C₆-alquil)aminocianoimino, di(C₁-C₆-alquil)aminocianoimino, C₁-C₆-alquilcarbonil-C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcoxiimino-C₁-C₆-alquila, N-(C₁-C₆-alquilamino)imino-C₁-C₆-alquila, N-(di-C₁-C₆-alquilamino)imino-C₁-C₆-alquila ou tri-C₁-C₄-alquilsilila,

onde os radicais alquila, cicloalquila e alcóxi mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, hidroxila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, di(C₁-C₄-alquil)amino, C₁-C₄-alquil-C₁-C₆-alcoxicarbonilamino, C₁-C₄-alquilcarbonila, hidroxicarbonila, C₁-C₄-alcoxicarbonila, aminocarbonila, C₁-C₄-alquilaminocarbonila, di(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila ou C₁-C₄-alquilcarboniloxi;

fenila, fenil-C₁-C₆-alquila, fenilcarbonil-C₁-C₆-alquila, fenoxicarbonila, fenilaminocarbonila, fenilsulfonilaminocarbonila, N-(C₁-C₆-alquil)-N-(fenil)aminocarbonila, fenil-C₁-C₆-alquilcarbonila,

onde um radical fenila pode ser parcialmente ou totalmente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: nitro, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₄-haloalcóxi; ou

SO₂R¹⁷;

R¹⁶ é hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₃-C₆-

alquenila, C₃-C₆-alquinila, C₃-C₆-haloalquenila, C₃-C₆-haloalquinila, hidroxila ou C₁-C₆-alcóxi;

R¹⁷ é C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-haloalquila, di(C₁-C₆-alquil)amino ou fenila,

5 onde um radical fenila pode ser parcialmente ou totalmente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-haloalquila ou C₁-C₆-alcóxi;

e sais agriculturalmente utilizáveis dos mesmos.

10 Além disso, a invenção refere-se a processos e intermediários para preparar compostos da fórmula I, a composições compreendendo os mesmos e ao uso destes derivados ou de composições compreendendo os mesmos para combater plantas nocivas.

Os compostos 2, ω -Diaminocarbonila com atividade herbicida são descritos, inter alia, em WO 03/045878.

15 Também são conhecidas da literatura (por exemplo WO 05/061443) fenilalaninas substituídas por benzoíla que podem carregar um grupo amino opcionalmente substituído na β -posição.

20 No entanto, as propriedades herbicidas dos compostos de arte anterior e/ou sua compatibilidade com as plantas de colheita não são completamente satisfatórias.

Assim, é um objeto da presente invenção prover novos compostos, em particular herbicidamente ativos, tendo propriedades melhoradas.

25 Os requerentes verificaram que este objeto é alcançado pelas alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I e sua ação herbicida.

Além disso, os requerentes descobriram composições herbicidas que compreendem os compostos I e apresentam uma ação herbicida muito boa. Além disso, os requerentes descobriram processos para preparar estas composições e métodos para combater vegetação indesejada

usando os compostos I.

Dependendo do padrão de substituição, os compostos da fórmula I compreendem dois ou mais centros de quiralidade, em cujo caso eles estão presentes como enantiômeros ou misturas de diastereômeros. A invenção prove tanto os enantiômeros puros como os diastereômeros e suas misturas.

Os compostos da fórmula I também podem estar presentes na forma de seus sais agriculturalmente utilizáveis, a natureza do sal geralmente não sendo material. Os sais apropriados são, geralmente, os cátions ou os sais de adição de ácido dos ácidos cujos cátions e Ânions, respectivamente, não tem efeito adverso sobre a ação herbicida dos compostos I.

Os cátions apropriados são em particular íons dos metais alcalinos, preferivelmente lítio, sódio e potássio, dos metais alcalinos terrosos, preferivelmente cálcio e magnésio, e dos metais de transição, preferivelmente manganês, cobre, zinco e ferro, e também amônio, onde, se desejado, um a quarto átomos de hidrogênio podem ser substituídos por C₁-C₄-alquila, hidroxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila, hidroxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila, fenila ou benzila, preferivelmente amônio, dimetilamônio, diisopropilamônio, tetrametilamônio, tetrabutilamônio, 2-(2-hidroxiet-1-oxi)et-1-ilamônio, di-(2-hidroxiet-1-il)amônio, trimetilbenzilamônio, além de íons fosfônio, íons sulfônio, preferivelmente tri(C₁-C₄-alquil)sulfônio, e íons sulfoxônio, preferivelmente tri(C₁-C₄-alquil)sulfoxônio.

Ânions de sais de adição de ácido utilizáveis são primariamente cloreto, brometo, fluoreto, hidrogenossulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, e os Ânions de ácidos C₁-C₄-alcanóicos, preferivelmente formato, acetato, propionato e butirato.

As porções orgânicas mencionados para os substituintes R¹-R¹⁷ ou como radicais em anéis fenila, heterociclila, arila, heteroarila ou

heterociclila são termos coletivos para enumerações individuais dos membros do grupo específicos.

Todas as cadeias de hidrocarbonetos, isto é todas as porções alquila, alquenila, alquinila, haloalquila, haloalquenila, haloalquinila, cianoalquila, cianoalquenila, cianoalquinila, hidroxialquila, hidroxialquenila, hidroxialquinila, alcóxi, haloalcóxi e alquiltio podem ser de cadeia reta ou ramificada.

Salvo especificado em contrário, substituintes halogenados preferivelmente carregam um a cinco átomos de halogênio idênticos ou diferentes. O termo halogênio denota em cada caso flúor, cloro, bromo ou iodo.

Exemplos de outros significados são:

- C₁-C₄-alquila e também as porções alquila de tri-C₁-C₄-alquilsilila, C₁-C₆-alcoxi-carbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilcarboniloxi, C₁-C₄-alquil-C₁-C₆-alcoxicarbonilamino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alqueniloxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alquiniloxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-haloalqueniloxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-haloalquiniloxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquiltio-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alqueniltio-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alquiniltio-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfinil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalquilsulfinil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalquilsulfonil-C₁-C₄-alquila, amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilamino-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, formilamino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxicarbonilamino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfonilamino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfonil-(C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, hidroxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalcoxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarboniloxi-C₁-C₄-alquila, aminocarbonil-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonil-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonil-C₁-C₄-

alquila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino]C₁-C₄-alquila, [di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino]C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarbonilamino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarbonil-(C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquilamino)carboniloxi-C₁-C₄-alquila, [di(C₁-C₆-alquilamino)carboniloxi]C₁-C₄-alquila, fenil-C₁-C₄-alquila, fenilcarbonil-C₁-C₄-alquila, fenilcarboniloxi-C₁-C₄-alquila, feniloxicarbonil-C₁-C₄-alquila, feniloxi-C₁-C₄-alquila, feniltio-C₁-C₄-alquila, fenilsulfinil-C₁-C₄-alquila, fenilsulfonil-C₁-C₄-alquila, heteroaril-C₁-C₄-alquila, heteroarilcarbonil-C₁-C₄-alquila, heteroarilcarboniloxi-C₁-C₄-alquila, heteroariloxicarbonil-C₁-C₄-alquila, heteroariloxi-C₁-C₄-alquila, heteroariltio-C₁-C₄-alquila, heteroarilsulfinil-C₁-C₄-alquila, heteroarilsulfonil-C₁-C₄-alquila, e aril(C₁-C₄-alquila):

por exemplo metila, etila, n-propila, 1-metiletila, n-butila, 1-metilpropila, 2-metilpropila e 1,1-dimetiletila;

- C₁-C₆-alquila e também as porções alquila de C₁-C₆-cianoalquila, C₁-C₆-alquilcarbonil-C₁-C₆-alquila, N-(C₃-C₆-alquenil)-N-(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, N-(C₃-C₆-alquinil)-N-(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, N-(C₁-C₆-alcoxi)-N-(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, C₁-C₆-alquilcarbonil-C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcoxiimino-C₁-C₆-alquila, N-(C₁-C₆-alquilamino)imino-C₁-C₆-alquila, N-(di-C₁-C₆-alquilamino)imino-C₁-C₆-alquila, (C₁-C₆-alquil)cianoimino, fenil-C₁-C₆-alquila, fenilcarbonil-C₁-C₆-alquila, N-(C₁-C₆-alquil)-N-fenilaminocarbonila:

C₁-C₄-alquila como acima mencionado, e também, por exemplo, n-pentila, 1-metilbutila, 2-metilbutila, 3-metilbutila, 2,2-dimetilpropila, 1-etilpropila, n-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-etil-1-metilpropila e 1-etil-3-metilpropila;

- C₁-C₄-alquilcarbonila: por exemplo metilcarbonila,

etilcarbonila, propilcarbonila, 1-metiletilcarbonila, butilcarbonila, 1-metilpropilcarbonila, 2-metilpropilcarbonila ou 1,1-dimetiletilcarbonila;

- C_1 - C_6 -alquilcarbonila e também os radicais alquilcarbonila de C_1 - C_6 -alquilcarbonil- C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -alquilcarboniloxi- C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -alquilcarbonilamino- C_1 - C_4 -alquila, fenil- C_1 - C_6 -alquilcarbonila, C_1 - C_6 -alquilcarbonil-(C_1 - C_6 -alquilamino)- C_1 - C_4 -alquila:

C_1 - C_4 -alquilcarbonila como acima mencionado, e também, por exemplo, pentilcarbonila, 1-metilbutilcarbonila, 2-metilbutilcarbonila, 3-metilbutilcarbonila, 2,2-dimetilpropilcarbonila, 1-etilpropilcarbonila, hexilcarbonila, 1,1-dimetilpropilcarbonila, 1,2-dimetilpropilcarbonila, 1-metilpentilcarbonila, 2-metilpentilcarbonila, 3-metilpentilcarbonila, 4-metilpentilcarbonila, 1,1-dimetilbutilcarbonila, 1,2-dimetilbutilcarbonila, 1,3-dimetilbutilcarbonila, 2,2-dimetilbutilcarbonila, 2,3-dimetilbutilcarbonila, 3,3-dimetilbutilcarbonila, 1-etilbutilcarbonila, 2-etilbutilcarbonila, 1,1,2-trimetilpropilcarbonila, 1,2,2-trimetilpropilcarbonila, 1-etil-1-metilpropilcarbonila ou 1-etil-2-metilpropilcarbonila;

- C_3 - C_6 -cicloalquila e também as porções cicloalquila de C_3 - C_6 -cicloalquilcarbonila: hidrocarboneto saturado monocíclico tendo 3 a 6 membros no anel, como ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila e ciclo-hexila;

- C_3 - C_6 -cicloalquenila: por exemplo 1-ciclopropenila, 2-ciclopropenila, 1-ciclobutenila, 2-ciclobutenila, 1-ciclopentenila, 2-ciclopentenila, 1,3-ciclopentadienila, 1,4-ciclopentadienila, 2,4-ciclopentadienila, 1-ciclo-hexenila, 2-ciclo-hexenila, 3-ciclo-hexenila, 1,3-ciclo-hexadienila, 1,4-ciclo-hexadienila, 2,5-ciclo-hexadienila;

- C_3 - C_6 -alquenila e também as porções alquenila de C_3 - C_6 -alqueniloxicarbonila, C_3 - C_6 -alquenilaminocarbonila, N-(C_3 - C_6 -alquenil)-N-(C_1 - C_6 -alquil)aminocarbonila e N-(C_3 - C_6 -alquenil)-N-(C_1 - C_6 -alcoxi)aminocarbonila: por exemplo 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;

- C_2 - C_6 -alquenila e também as porções alquenila de C_2 - C_6 -alquencilcarbonila, C_2 - C_6 -alquenciloxi- C_1 - C_4 -alquila, C_2 - C_6 -alquenciltio- C_1 - C_4 -alquila, fenil- C_2 - C_4 -alquenila, heteroaril- C_2 - C_4 -alquenila: C_3 - C_6 -alquenila como acima mencionado, e também etenila;

- C_3 - C_6 -alquinila e também as porções alquinila de C_3 - C_6 -alquinoxiloxycarbonila, C_3 - C_6 -alquinoxilaminocarbonila, N-(C_3 - C_6 -alquinoxil)-N-(C_1 - C_6 -alquil)aminocarbonila, N-(C_3 - C_6 -alquinoxil)-N-(C_1 - C_6 -alcoxi)aminocarbonila: por exemplo 1-propinila, 2-propinila, 1-butinila, 2-butinila, 3-butinila, 1-metil-2-propinila, 1-pentinila, 2-pentinila, 3-pentinila, 4-pentinila, 1-metil-2-butinila, 1-metil-3-butinila, 2-metil-3-butinila, 3-metil-1-butinila, 1,1-dimetil-2-propinila, 1-etil-2-propinila, 1-hexinila, 2-hexinila,

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

- C_2 - C_6 -alquinila e também as porções alquinila de C_2 - C_6 -alquinilcarbonila, C_2 - C_2 -alquiniloxi- C_1 - C_4 -alquila, C_2 - C_6 -alquiniltio- C_1 - C_4 -alquila, fenil- C_2 - C_4 -alquinila, heteroaril- C_2 - C_4 -alquinila: C_3 - C_6 -alquinila
 10 como acima mencionado, e também etinila;

- C_1 - C_4 -cianoalquila: por exemplo cianometila, 1-cianoet-1-ila, 2-cianoet-1-ila, 1-cianoprop-1-ila, 2-cianoprop-1-ila, 3-cianoprop-1-ila, 1-cianoprop-2-ila, 2-cianoprop-2-ila, 1-cianobut-1-ila, 2-cianobut-1-ila, 3-cianobut-1-ila, 4-cianobut-1-ila, 1-cianobut-2-ila, 2-cianobut-2-ila, 1-
 15 cianobut-3-ila, 2-cianobut-3-ila, 1-ciano-2-metilprop-3-ila, 2-ciano-2-metilprop-3-ila, 3-ciano-2-metilprop-3-ila e 2-cianometilprop-2-ila;

- C_1 - C_4 -hidroxialquila e também as porções C_1 - C_4 -hidroxialquila de fenil- C_1 - C_4 -hidroxialquila, heteroaril- C_1 - C_4 -hidroxialquila: por exemplo hidroximetila, 1-hidroxiet-1-ila, 2-hidroxiet-1-ila, 1-hidroxiprop-1-ila, 2-hidroxiprop-1-ila, 3-hidroxiprop-1-ila, 1-hidroxiprop-2-ila, 2-hidroxiprop-2-ila, 1-hidroxibut-1-ila, 2-hidroxibut-1-ila, 3-hidroxibut-1-ila, 4-hidroxibut-1-ila, 1-hidroxibut-2-ila, 2-hidroxibut-2-ila, 1-hidroxibut-3-ila, 2-hidroxibut-3-ila, 1-hidroxi-2-metilprop-3-ila, 2-hidroxi-2-metilprop-3-ila, 3-hidroxi-2-metilprop-3-ila e 2-hidroximetilprop-2-ila, 1,2-diidroxietila, 1,2-
 20 diidroxiprop-3-ila, 2,3-diidroxiprop-3-ila, 1,2-diidroxiprop-2-ila, 1,2-diidroxibut-4-ila, 2,3-diidroxibut-4-ila, 3,4-diidroxibut-4-ila, 1,2-diidroxibut-2-ila, 1,2-diidroxibut-3-ila, 2,3-diidroxibut-3-ila, 1,2-diidroxiet-2-metilprop-3-ila, 2,3-diidroxiet-2-metilprop-3-ila;

- C_1 - C_6 -hidroxialquila: C_1 - C_4 -hidroxialquila como acima

mencionado e também, por exemplo, 1-hidroxipent-5-ila, 2-hidroxipent-5-ila, 3-hidroxipent-5-ila, 4-hidroxipent-5-ila, 5-hidroxipent-5-ila, 1-hidroxipent-4-ila, 2-hidroxipent-4-ila, 3-hidroxipent-4-ila, 4-hidroxipent-4-ila, 1-hidroxipent-3-ila, 2-hidroxipent-3-ila, 3-hidroxipent-3-ila, 1-hidroxi-2-metilbut-3-ila, 2-hidroxi-2-metilbut-3-ila, 3-hidroxi-2-metilbut-3-ila, 1-hidroxi-2-metilbut-4-ila, 2-hidroxi-2-metilbut-4-ila, 3-hidroxi-2-metilbut-4-ila, 4-hidroxi-2-metilbut-4-ila, 1-hidroxi-3-metilbut-4-ila, 2-hidroxi-3-metilbut-4-ila, 3-hidroxi-3-metilbut-4-ila, 4-hidroxi-3-metilbut-4-ila, 1-hidroxi-2-metilpent-5-ila, 2-hidroxi-2-metilpent-5-ila, 3-hidroxi-2-metilpent-5-ila, 4-hidroxi-2-metilpent-5-ila, 5-hidroxi-2-metilpent-5-ila, 1-hidroxi-3-metilpent-5-ila, 2-hidroxi-3-metilpent-5-ila, 3-hidroxi-3-metilpent-5-ila, 4-hidroxi-3-metilpent-5-ila, 5-hidroxi-3-metilpent-5-ila, 1-hidroxi-4-metilpent-5-ila, 2-hidroxi-4-metilpent-5-ila, 3-hidroxi-4-metilpent-5-ila, 4-hidroxi-4-metilpent-5-ila, 5-hidroxi-4-metilpent-5-ila, 1-hidroxi-5-metilpent-5-ila, 2-hidroxi-5-metilpent-5-ila, 3-hidroxi-5-metilpent-5-ila, 4-hidroxi-5-metilpent-5-ila, 5-hidroxi-5-metilpent-5-ila, 1-hidroxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 2-hidroxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 3-hidroxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 4-hidroxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 1,2-diidroxipent-5-ila, 2,3-diidroxipent-5-ila, 3,4-diidroxipent-5-ila, 4,5-diidroxipent-5-ila, 1,2-diidroxipent-4-ila, 2,3-diidroxipent-4-ila, 3,4-diidroxipent-4-ila, 4,5-diidroxipent-4-ila, 1,2-diidroxipent-3-ila, 2,3-diidroxipent-3-ila, 1,2-diidroxipent-2-metilbut-3-ila, 2,3-diidroxipent-2-metilbut-3-ila, 3,4-diidroxipent-2-metilbut-3-ila, 2-hidroxi-2-hidroximetilbut-3-ila, 1,2-diidroxipent-2-metilbut-4-ila, 2,3-diidroxipent-2-metilbut-4-ila, 3,4-diidroxipent-2-metilbut-4-ila, 1,2-diidroxipent-3-metilbut-4-ila, 2,3-diidroxipent-3-metilbut-4-ila, 3,4-diidroxipent-3-metilbut-4-ila, 3-hidroxi-3-hidroximetilbut-4-ila, 1,2-diidroxihex-6-ila, 2,3-diidroxihex-6-ila, 3,4-diidroxihex-6-ila, 4,5-diidroxihex-6-ila, 5,6-diidroxihex-6-ila, 1,2-diidroxipent-2-metilpent-5-ila, 2,3-diidroxipent-2-metilpent-5-ila, 3,4-diidroxipent-2-metilpent-5-ila,

4,5-diidroxi-2-metilpent-5-ila, 2-hidroxi-2-hidroximetilpent-5-ila, 1,2-diidroxi-3-metilpent-5-ila, 2,3-diidroxi-3-metilpent-5-ila, 3,4-diidroxi-3-metilpent-5-ila, 4,5-diidroxi-3-metilpent-5-ila, 3-hidroxi-3-hidroximetilpent-5-ila, 1,2-diidroxi-4-metilpent-5-ila, 2,3-diidroxi-4-metilpent-5-ila, 3,4-diidroxi-4-metilpent-5-ila, 4,5-diidroxi-4-metilpent-5-ila, 4-hidroxi-4-hidroximetilpent-5-ila, 1,2-diidroxi-5-metilpent-5-ila, 2,3-diidroxi-5-metilpent-5-ila, 3,4-diidroxi-5-metilpent-5-ila, 4,5-diidroxi-5-metilpent-5-ila, 5-hidroxi-5-hidroximetilpent-5-ila, 1,2-diidroxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 2,3-diidroxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 3,4-diidroxi-2,3-dimetilbut-4-ila, 2-hidroxi-2-hidroximetil-3-metilbut-4-ila, 3-hidroxi-3-hidroximetil-2-metilbut-4-ila;

- C_1 - C_4 -haloalquila e também as porções haloalquila de fenil- C_1 - C_4 -haloalquila, heteroaril- C_1 - C_4 -haloalquila: um radical C_1 - C_4 -alquila como acima mencionado que é parcialmente ou totalmente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, isto é, por exemplo, clorometila, diclorometila, triclorometila, fluorometila, difluorometila, trifluorometila, clorofluorometila, diclorofluorometila, clorodifluorometila, bromometila, iodometila, 2-fluoroetila, 2-cloroetila, 2-bromoetila, 2-iodoetila, 2,2-difluoroetila, 2,2,2-trifluoroetila, 2-cloro-2-fluoroetila, 2-cloro-2,2-difluoroetila, 2,2-dicloro-2-fluoroetila, 2,2,2-tricloroetila, pentafluoroetila, 2-fluoropropila, 3-fluoropropila, 2,2-difluoropropila, 2,3-difluoropropila, 2-cloropropila, 3-cloropropila, 2,3-dicloropropila, 2-bromopropila, 3-bromopropila, 3,3,3-trifluoropropila, 3,3,3-tricloropropila, 2,2,3,3,3-pentafluoropropila, heptafluoropropila, 1-(fluorometil)-2-fluoroetila, 1-(clorometil)-2-cloroetila, 1-(bromometil)-2-bromoetila, 4-fluorobutila, 4-clorobutila, 4-bromobutila, nonafluorobutila, 1,1,2,2-tetrafluoroetila e 1-trifluorometil-1,2,2,2-tetrafluoroetila;

- C_1 - C_6 -haloalquila e também as porções haloalquila de C_1 - C_6 -haloalquil- C_1 - C_4 -tioalquila: C_1 - C_4 -haloalquila como acima mencionado, e também, por exemplo, 5-fluoropentila, 5-cloropentila, 5-bromopentila, 5-

iodopentila, undecafluoropentila, 6-fluorohexila, 6-clorohexila, 6-bromohexila, 6-iodohexila e tridecafluorohexila;

- C₃-C₆-haloalquenila: um radical C₃-C₆-alquenila como acima mencionado que é parcialmente ou totalmente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, por exemplo 2-cloroprop-2-en-1-ila, 3-cloroprop-2-en-1-ila, 2,3-dicloroprop-2-en-1-ila, 3,3-dicloroprop-2-en-1-ila, 2,3,3-tricloro-2-en-1-ila, 2,3-diclorobut-2-en-1-ila, 2-bromoprop-2-en-1-ila, 3-bromoprop-2-en-1-ila, 2,3-dibromoprop-2-en-1-ila, 3,3-dibromoprop-2-en-1-ila, 2,3,3-tribromo-2-en-1-ila ou 2,3-dibromobut-2-en-1-ila;

- C₂-C₆-haloalquenila e também as porções C₂-C₆-haloalquenila de C₂-C₆-haloalqueniloxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-haloalquenil-C₁-C₄-tioalquila, fenil-C₂-C₄-haloalquenila, heteroaril-C₂-C₄-haloalquenila: um radical C₂-C₆-alquenila como acima mencionado que é parcialmente ou totalmente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo: por exemplo 2-clorovinila, 2-cloroalila, 3-cloroalila, 2,3-dicloroalila, 3,3-dicloroalila, 2,3,3-tricloroalila, 2,3-diclorobut-2-enila, 2-bromovinila, 2-bromoalila, 3-bromoalila, 2,3-dibromoalila, 3,3-dibromoalila, 2,3,3-tribromoalila ou 2,3-dibromobut-2-enila;

- C₂-C₆-cianoalquenila: por exemplo 2-cianovinila, 2-cianoalila, 3-cianoalila, 2,3-dicianoalila, 3,3-dicianoalila, 2,3,3-tricianoalila, 2,3-dicianobut-2-enila;

- C₂-C₆-hidroxialquenila e também as porções hidroxila de fenil-C₁-C₄-hidroxialquenila, heteroaril-C₁-C₄-hidroxialquenila: por exemplo 2-hidroxivinila, 2-hidroxialila, 3-hidroxialila, 2,3-diidroxialila, 3,3-diidroxialila, 2,3,3-triidroxialila, 2,3-diidroxibut-2-enila;

- C₃-C₆-haloalquinila: um radical C₃-C₆-alquinila como acima mencionado que é parcialmente ou totalmente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, por exemplo 1,1-difluoroprop-2-in-1-ila, 3-iodoprop-2-in-1-ila, 4-fluorobut-2-in-1-ila, 4-clorobut-2-in-1-ila, 1,1-difluorobut-2-in-

1-ila, 4-iodobut-3-in-1-ila, 5-fluoropent-3-in-1-ila, 5-iodopent-4-in-1-ila, 6-fluorohex-4-in-1-ila ou 6-iodohex-5-in-1-ila;

- C₂-C₆-haloalquinila e também as porções C₂-C₆-haloalquinila de C₂-C₆-haloalquiniloxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-haloalquinil-C₁-C₄-tioalquila, fenil-C₂-C₄-haloalquinila, heteroaril-C₂-C₄-haloalquinil: um radical C₂-C₆-alquinila como acima mencionado que é parcialmente ou totalmente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, por exemplo 1,1-difluoroprop-2-in-1-ila, 3-iodoprop-2-in-1-ila, 4-fluorobut-2-in-1-ila, 4-clorobut-2-in-1-ila, 1,1-difluorobut-2-in-1-ila, 4-iodobut-3-in-1-ila, 5-fluoropent-3-in-1-ila, 5-iodopent-4-in-1-ila, 6-fluorohex-4-in-1-ila ou 6-iodohex-5-in-1-ila;

- C₂-C₆-cianoalquinila: por exemplo 1,1-dicianoprop-2-in-1-ila, 3-cianoprop-2-in-1-ila, 4-cianobut-2-in-1-ila, 1,1-dicianobut-2-in-1-ila, 4-cianobut-3-in-1-ila, 5-cianopent-3-in-1-ila, 5-cianopent-4-in-1-ila, 6-cianohept-4-in-1-ila ou 6-cianohept-5-in-1-ila;

- C₂-C₆-hidroxialquinila e também as porções hidroxila de fenil-C₂-C₄-hidroxialquinila, heteroaril-C₂-C₄-hidroxialquinil: por exemplo 1,1-diidroxiprop-2-in-1-ila, 3-hidroxiprop-2-in-1-ila, 4-hidroxibut-2-in-1-ila, 1,1-diidroxibut-2-in-1-ila, 4-hidroxibut-3-in-1-ila, 5-hidroxipent-3-in-1-ila, 5-hidroxipent-4-in-1-ila, 6-hidroxihex-4-in-1-ila ou 6-hidroxihex-5-in-1-ila;

- C₁-C₆-alquilsulfinila (C₁-C₆-alquil-S(=O)-) e também as porções C₁-C₆-alquilsulfinila de C₁-C₆-alquilsulfinil-C₁-C₄-alquila: por exemplo metilsulfinila, etilsulfinila, propilsulfinila, 1-metiletilsulfinila, butilsulfinila, 1-metilpropilsulfinila, 2-metilpropilsulfinila, 1,1-dimetiletilsulfinila, pentilsulfinila, 1-metilbutilsulfinila, 2-metilbutilsulfinila, 3-metilbutilsulfinila, 2,2-dimetilpropilsulfinila, 1-etilpropilsulfinila, 1,1-dimetilpropilsulfinila, 1,2-dimetilpropilsulfinila, hexilsulfinila, 1-metilpentilsulfinila, 2-metilpentilsulfinila, 3-metilpentilsulfinila, 4-metilpentilsulfinila, 1,1-dimetilbutilsulfinila, 1,2-dimetilbutilsulfinila, 1,3-

dimetilbutilsulfinila, 2,2-dimetilbutilsulfinila, 2,3-dimetilbutilsulfinila, 3,3-dimetilbutilsulfinila, 1-etilbutilsulfinila, 2-etilbutilsulfinila, 1,1,2-trimetilpropilsulfinila, 1,2,2-trimetilpropilsulfinila, 1-etil-1-metilpropilsulfinila e 1-etil-2-metilpropilsulfinila;

- 5 - C₁-C₆-haloalquilsulfinila e também as porções C₁-C₆-haloalquilsulfinila de C₁-C₆-haloalquilsulfinil-C₁-C₄-alquila: radical C₁-C₆-alquilsulfinila como acima mencionado que é parcialmente ou totalmente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, isto é por exemplo
- 10 fluorometilsulfinila, difluorometilsulfinila, trifluorometilsulfinila, clorodifluorometilsulfinila, bromodifluorometilsulfinila, 2-fluoroetilsulfinila, 2-cloroetilsulfinila, 2-bromoetilsulfinila, 2-iodoetilsulfinila, 2,2-difluoroetilsulfinila, 2,2,2-trifluoroetilsulfinila, 2,2,2-tricloroetilsulfinila, 2-cloro-2-fluoroetilsulfinila, 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfinila, 2,2-dicloro-2-fluoroetilsulfinila, pentafluoroetilsulfinila, 2-fluoropropilsulfinila, 3-
- 15 fluoropropilsulfinila, 2-cloropropilsulfinila, 3-cloropropilsulfinila, 2-bromopropilsulfinila, 3-bromopropilsulfinila, 2,2-difluoropropilsulfinila, 2,3-difluoropropilsulfinila, 2,3-dicloropropilsulfinila, 3,3,3-trifluoropropilsulfinila, 3,3,3-tricloropropilsulfinila, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilsulfinila, heptafluoropropilsulfinila, 1-(fluorometil)-2-
- 20 fluoroetilsulfinila, 1-(clorometil)-2-cloroetilsulfinila, 1-(bromometil)-2-bromoetilsulfinila, 4-fluorobutilsulfinila, 4-clorobutilsulfinila, 4-bromobutilsulfinila, nonafluorobutilsulfinila, 5-fluoropentilsulfinila, 5-cloropentilsulfinila, 5-bromopentilsulfinila, 5-iodopentilsulfinila, undecafluoropentilsulfinila, 6-fluorohexilsulfinila, 6-clorohexilsulfinila, 6-
- 25 bromohexilsulfinila, 6-iodohexilsulfinila e dodecafluorohexilsulfinila;

- C₁-C₆-alquilsulfonila (C₁-C₆-alquil-S(O)₂-) e também as porções C₁-C₆-alquilsulfonila de C₁-C₆-alquilsulfonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfonilamino, C₁-C₆-alquilsulfonilamino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfonil-(C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfonilamino-

carbonila: por exemplo metilsulfonila, etilsulfonila, propilsulfonila, 1-metiletilsulfonila, butilsulfonila, 1-metilpropilsulfonila, 2-metilpropilsulfonila, 1,1-dimetiletilsulfonila, pentilsulfonila, 1-metilbutilsulfonila, 2-metilbutilsulfonila, 3-metilbutilsulfonila, 1,1-dimetilpropilsulfonila, 1,2-dimetilpropilsulfonila, 2,2-dimetilpropilsulfonila, 1-etilpropilsulfonila, hexilsulfonila, 1-metilpentilsulfonila, 2-metilpentilsulfonila, 3-metilpentilsulfonila, 4-metilpentilsulfonila, 1,1-dimetilbutilsulfonila, 1,2-dimetilbutilsulfonila, 1,3-dimetilbutilsulfonila, 2,2-dimetilbutilsulfonila, 2,3-dimetilbutilsulfonila, 3,3-dimetilbutilsulfonila, 1-etilbutilsulfonila, 2-etilbutilsulfonila, 1,1,2-trimetilpropilsulfonila, 1,2,2-trimetilpropilsulfonila, 1-etil-1-metilpropilsulfonila e 1-etil-2-metilpropilsulfonila;

- C₁-C₆-haloalquilsulfonila e também as porções C₁-C₆-haloalquilsulfonila de C₁-C₆-haloalquilsulfonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalquilsulfonilamino: um radical C₁-C₆-alquilsulfonila como acima mencionado que é parcialmente ou totalmente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, isto é por exemplo fluorometilsulfonila, difluorometilsulfonila, trifluorometilsulfonila, clorodifluorometilsulfonila, bromodifluorometilsulfonila, 2-fluoroetilsulfonila, 2-cloroetilsulfonila, 2-bromoetilsulfonila, 2-iodoetilsulfonila, 2,2-difluoroetilsulfonila, 2,2,2-trifluoroetilsulfonila, 2-cloro-2-fluoroetilsulfonila, 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfonila, 2,2-dicloro-2-fluoroetilsulfonila, 2,2,2-tricloroetilsulfonila, pentafluoroetilsulfonila, 2-fluoropropilsulfonila, 3-fluoropropilsulfonila, 2-cloropropilsulfonila, 3-cloropropilsulfonila, 2-bromopropilsulfonila, 3-bromopropilsulfonila, 2,2-difluoropropilsulfonila, 2,3-difluoropropilsulfonila, 2,3-dicloropropilsulfonila, 3,3,3-trifluoropropilsulfonila, 3,3,3-tricloropropilsulfonila, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilsulfonila, heptafluoropropilsulfonila, 1-(fluorometil)-2-fluoroetilsulfonila, 1-(clorometil)-2-cloroetilsulfonila, 1-(bromometil)-2-

bromoetilsulfonila, 4-fluorobutilsulfonila, 4-clorobutilsulfonila, 4-bromobutilsulfonila, nonafluorobutilsulfonila, 5-fluoropentilsulfonila, 5-cloropentilsulfonila, 5-bromopentilsulfonila, 5-iodopentilsulfonila, 6-fluorohexilsulfonila, 6-bromohexilsulfonila, 6-iodohexilsulfonila e
 5 dodecafluorohexilsulfonila;

C_1 - C_4 -alcóxi e também as porções alcóxi de hidroxycarbonil- C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -alcoxycarbonil- C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquila e C_1 - C_4 -alquil- C_1 - C_4 -alcoxycarbonilamino: por exemplo metóxi, etóxi, propóxi, 1-metiletóxi, butóxi, 1-metilpropóxi, 2-metilpropóxi e 1,1-
 10 dimetiletóxi;

- C_1 - C_6 -alcóxi e também as porções alcóxi de hidroxycarbonil- C_1 - C_6 -alcóxi, C_1 - C_4 -alquil- C_1 - C_6 -alcoxycarbonilamino, C_1 - C_6 -alcoxycarbonil- C_1 - C_6 -alcóxi, N -(C_1 - C_6 -alcoxi)- N -(C_1 - C_6 -alquil)aminocarbonila, N -(C_3 - C_6 -alquenil)- N -(C_1 - C_6 -alcoxi)aminocarbonila, N -(C_3 - C_6 -alquinil)- N -(C_1 - C_6 -alcoxi)aminocarbonila, C_1 - C_6 -alcoxiimino- C_1 - C_6 -alquila e C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_4 -alcóxi:
 15

C_1 - C_4 -alcóxi como acima mencionado, e também, por exemplo, pentóxi, 1-metilbutóxi, 2-metilbutóxi, 3-metoxilbutóxi, 1,1-dimetilpropóxi, 1,2-dimetilpropóxi, 2,2-dimetilpropóxi, 1-etilpropóxi, hexóxi, 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;
 20

- C_1 - C_4 -haloalcóxi: um radical C_1 - C_4 -alcóxi como acima mencionado que é parcialmente ou totalmente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, isto é, por exemplo, fluorometóxi, difluorometóxi, trifluorometóxi, clorodifluorometóxi, bromodifluorometóxi, 2-fluoroetóxi, 2-cloroetóxi, 2-bromometóxi, 2-iodoetóxi, 2,2-difluoroetóxi, 2,2,2-
 25

trifluoroetóxi, 2-cloro-2-fluoroetóxi, 2-cloro-2,2-difluoroetóxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetóxi, 2,2,2-tricloroetóxi, pentafluoroetóxi, 2-fluoropropóxi, 3-fluoropropóxi, 2-cloropropóxi, 3-cloropropóxi, 2-bromopropóxi, 3-bromopropóxi, 2,2-difluoropropóxi, 2,3-difluoropropóxi, 2,3-dicloropropóxi, 3,3,3-trifluoropropóxi, 3,3,3-tricloropropóxi, 2,2,3,3,3-pentafluoropropóxi, heptafluoropropóxi, 1-(fluorometil)-2-fluoroetóxi, 1-(clorometil)-2-cloroetóxi, 1-(bromometil)-2-bromoetóxi, 4-fluorobutóxi, 4-clorobutóxi, 4-bromobutóxi e nonafluorobutóxi;

10 - C₁-C₆-haloalcóxi e também as porções C₁-C₆-haloalcóxi de C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalcoxycarbonil-C₁-C₄-alquila: C₁-C₄-haloalcóxi como acima mencionado, e também, por exemplo, 5-fluoropentóxi, 5-cloropentóxi, 5-bromopentóxi, 5-iodopentóxi, undecafluoropentóxi, 6-fluorohexóxi, 6-clorohexóxi, 6-bromohexóxi, 6-iodohexóxi e dodecafluorohexóxi;

15 - C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquila e também as porções C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquila de C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila: C₁-C₄-alquila que é substituído por C₁-C₆-alcóxi como acima mencionado, isto é, por exemplo, metoximetila, etoximetila, propoximetila, (1-metiletoxi)metila, butoximetila, (1-metilpropoxi)metila, (2-metilpropoxi)metila, (1,1-dimetiletoxi)metila, 2-(metoxi)etila, 2-(etoxi)etila, 2-(propoxi)etila, 2-(1-metiletoxi)etila, 2-(butoxi)etila, 2-(1-metilpropoxi)etila, 2-(2-metilpropoxi)etila, 2-(1,1-dimetiletoxi)etila, 2-(metoxi)propila, 2-(etoxi)propila, 2-(propoxi)propila, 2-(1-metiletoxi)propila, 2-(butoxi)propila, 2-(1-metilpropoxi)propila, 2-(2-metilpropoxi)propila, 2-(1,1-dimetiletoxi)propila, 3-(metoxi)propila, 3-(etoxi)propila, 3-(propoxi)propila, 3-(1-metiletoxi)propila, 3-(butoxi)propila, 3-(1-metilpropoxi)propila, 3-(2-metilpropoxi)propila, 3-(1,1-dimetiletoxi)propila, 2-(metoxi)butila, 2-(etoxi)butila, 2-(propoxi)butila, 2-(1-metiletoxi)butila, 2-(butoxi)butila, 2-(1-metilpropoxi)butila, 2-(2-metilpropoxi)butila, 2-(1,1-dimetiletoxi)butila, 3-

(metoxi)butila, 3-(etoxi)butila, 3-(propoxi)butila, 3-(1-metiletoxi)butila, 3-(butoxi)butila, 3-(1-metilpropoxi)butila, 3-(2-metilpropoxi)butila, 3-(1,1-dimetiletoxi)butila, 4-(metoxi)butila, 4-(etoxi)butila, 4-(propoxi)butila, 4-(1-metiletoxi)butila, 4-(butoxi)butila, 4-(1-metilpropoxi)butila, 4-(2-metilpropoxi)butila e 4-(1,1-dimetiletoxi)butila;

- C₁-C₄-alcoxycarbonila e também as porções alcoxycarbonila de C₁-C₄-alcoxycarbonil-C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alcoxycarbonila e di-(C₁-C₄-alquil)amino-C₁-C₄-alcoxycarbonila: por exemplo metoxycarbonila, etoxycarbonila, propoxycarbonila, 1-metiletoxycarbonila, butoxycarbonila, 1-metilpropoxycarbonila, 2-metilpropoxycarbonila ou 1,1-dimetiletoxycarbonila;

- C₁-C₆-alcoxycarbonila e também as porções alcoxycarbonila de C₁-C₆-alcoxycarbonil-C₁-C₆-alcóxi (C₁-C₆-alcoxycarbonil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxycarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquil-(C₁-C₆-alcoxycarbonil)amino: C₁-C₄-alcoxycarbonila como acima mencionado, e também, por exemplo, pentoxycarbonila, 1-metilbutoxycarbonila, 2-metilbutoxycarbonila, 3-metilbutoxycarbonila, 2,2-dimetilpropoxycarbonila, 1-etilpropoxycarbonila, hexoxycarbonila, 1,1-dimetilpropoxycarbonila, 1,2-dimetilpropoxycarbonila, 1-metilpentoxycarbonila, 2-metilpentoxycarbonila, 3-metilpentoxycarbonila, 4-metilpentoxycarbonila, 1,1-dimetilbutoxycarbonila, 1,2-dimetilbutoxycarbonila, 1,3-dimetilbutoxycarbonila, 2,2-dimetilbutoxycarbonila, 2,3-dimetilbutoxycarbonila, 3,3-dimetilbutoxycarbonila, 1-etilbutoxycarbonila, 2-etilbutoxycarbonila, 1,1,2-trimetilpropoxycarbonila, 1,2,2-trimetilpropoxycarbonila, 1-etil-1-metilpropoxycarbonila ou 1-etil-2-metilpropoxycarbonila;

- C₁-C₄-alquiltio e também as porções C₁-C₄-alquiltio de C₁-C₆-haloalquil-C₁-C₄-tioalquila, C₂-C₆-haloalquenil-C₁-C₄-tioalquila, C₂-C₆-haloalquinil-C₁-C₄-tioalquila: por exemplo metiltio, etiltio, propiltio, 1-

metiletiltio, butiltio, 1-metilpropiltio, 2-metilpropiltio e 1,1-dimeteletiltio;

- C₁-C₆-alquiltio e também as porções C₁-C₆-alquiltio C₁-C₆-alquiltio-C₁-C₄-alquila: C₁-C₄-alquiltio como acima mencionado, e também, por exemplo, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio e 1-etil-2-metilpropiltio;

- C₁-C₆-alquilamino e também as porções C₁-C₆-alquilamino de N-(C₁-C₆-alquilamino)imino-C₁-C₆-alquila, (C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfonil-(C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarbonil-(C₁-C₆-alquilamino)-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)aminotiocarbonila e [(C₁-C₆-alquil)amino]cianoimino: por exemplo metilamino, etilamino, propilamino, 1-meteletilamino, butilamino, 1-metilpropilamino, 2-metilpropilamino, 1,1-dimeteletilamino, pentilamino, 1-metilbutilamino, 2-metilbutilamino, 3-metilbutilamino, 2,2-dimetilpropilamino, 1-etilpropilamino, hexilamino, 1,1-dimetilpropilamino, 1,2-dimetilpropilamino, 1-metilpentilamino, 2-metilpentilamino, 3-metilpentilamino, 4-metilpentilamino, 1,1-dimetilbutilamino, 1,2-dimetilbutilamino, 1,3-dimetilbutilamino, 2,2-dimetilbutilamino, 2,3-dimetilbutilamino, 3,3-dimetilbutilamino, 1-etilbutilamino, 2-etilbutilamino, 1,1,2-trimetilpropilamino, 1,2,2-trimetilpropilamino, 1-etil-1-metilpropilamino ou 1-etil-2-metilpropilamino;

- di(C₁-C₄-alquil)amino: por exemplo N,N-dimetilamino, N,N-dietilamino, N,N-dipropilamino, N,N-di-(1-meteletil)amino, N,N-dibutilamino, N,N-di-(1-metilpropil)amino, N,N-di-(2-metilpropil)amino, N,N-di-(1,1-dimeteletil)amino, N-etil-N-metilamino, N-metil-N-propilamino,

N-metil-N-(1-metiletil)amino, N-butil-N-metilamino, N-metil-N-(1-metilpropil)amino, N-metil-N-(2-metilpropil)amino, N-(1,1-dimetiletil)-N-metilamino, N-etil-N-propilamino, N-etil-N-(1-metiletil)amino, N-butil-N-etilamino, N-etil-N-(1-metilpropil)amino, N-etil-N-(2-metilpropil)amino, N-etil-N-(1,1-dimetiletil)amino, N-(1-metiletil)-N-propilamino, N-butil-N-propilamino, N-(1-metilpropil)-N-propilamino, N-(2-metilpropil)-N-propilamino, N-(1,1-dimetiletil)-N-propilamino, N-butil-N-(1-metiletil)amino, N-(1-metiletil)-N-(1-metilpropil)amino, N-(1-metiletil)-N-(2-metilpropil)amino, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-metiletil)amino, N-butil-N-(1-metilpropil)amino, N-butil-N-(2-metilpropil)amino, N-butil-N-(1,1-dimetiletil)amino, N-(1-metilpropil)-N-(2-metilpropil)amino, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-metilpropil)amino e N-(1,1-dimetiletil)-N-(2-metilpropil)amino;

- di(C₁-C₆-alquil)amino e também os radicais dialquilamino de N-(di-C₁-C₆-alquilamino)-imino-C₁-C₆-alquila, di(C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila e di(C₁-C₆-alquil)aminocianoimino: di(C₁-C₄-alquil)amino como acima mencionado, e também, por exemplo, N,N-dipentilamino, N,N-dihexilamino, N-metil-N-pentilamino, N-etil-N-pentilamino, N-metil-N-hexilamino e N-etil-N-hexilamino; (C₁-C₄-alquilamino)carbonila: por exemplo metilaminocarbonila, etilaminocarbonila, propilaminocarbonila, 1-metiletilaminocarbonila, butilaminocarbonila, 1-metilpropilaminocarbonila, 2-metilpropilaminocarbonila ou 1,1-dimetiletilaminocarbonila;

- (C₁-C₄-alquil)aminocarbonila e também as porções (C₁-C₄-alquil)aminocarbonila de (C₁-C₄-alquilamino)carbonilamino: por exemplo metilaminocarbonila, etilaminocarbonila, propilaminocarbonila, 1-metiletilaminocarbonila, butilaminocarbonila, 1-metilpropilaminocarbonila, 2-metilpropilaminocarbonila ou 1,1-dimetiletilaminocarbonila;

- di(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila e também as porções di(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila de di(C₁-C₄-alquil)aminocarbonilamino: por

exemplo N,N-dimetilaminocarbonila, N,N-dietilaminocarbonila, N,N-di-(1-metiletil)aminocarbonila, N,N-dipropilaminocarbonila, N,N-dibutilaminocarbonila, N,N-di-(1-metilpropil)aminocarbonila, N,N-di-(2-metilpropil)aminocarbonila, N,N-di-(1,1-dimetiletil)aminocarbonila, N-etil-

5 N-metilaminocarbonila, N-metil-N-propilaminocarbonila, N-metil-N-(1-metiletil)aminocarbonila, N-butil-N-metilaminocarbonila, N-metil-N-(1-metilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-(2-metilpropil) aminocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-metilaminocarbonila, N-etil-N-propilaminocarbonila, N-etil-N-(1-metiletil)aminocarbonila, N-butil-N-etilaminocarbonila, N-etil-N-(1-

10 metilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(2-metilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(1,1-dimetiletil)aminocarbonila, N-(1-metiletil)-N-propilaminocarbonila, N-butil-N-propilaminocarbonila, N-(1-metilpropil)-N-propilaminocarbonila, N-(2-metilpropil)-N-propilaminocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-propilaminocarbonila, N-butil-N-(1-metiletil)aminocarbonila, N-(1-metiletil)-

15 N-(1-metilpropil) aminocarbonila, N-(1-metiletil)-N-(2-metilpropil)aminocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-metiletil)aminocarbonila, N-butil-N-(1-metilpropil) aminocarbonila, N-butil-N-(2-metilpropil)aminocarbonila, N-butil-N-(1,1-dimetiletil)aminocarbonila, N-(1-metilpropil)-N-(2-metilpropil)aminocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-

20 metilpropil) aminocarbonila ou N-(1,1-dimetiletil)-N-(2-metilpropil)aminocarbonila;

- (C₁-C₆-alquil)aminocarbonila e também as porções (C₁-C₆-alquil)aminocarbonila de (C₁-C₆-alquilamino)carbonilamino, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonil-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)aminocarboniloxi- C₁-C₄-

25 alquila e (C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino-C₁-C₄-alquila: (C₁-C₄-alquilamino)carbonila como acima mencionado, e também, por exemplo, pentilaminocarbonila, 1-metilbutilaminocarbonila, 2-metilbutilaminocarbonila, 3-metilbutilaminocarbonila, 2,2-dimetilpropilaminocarbonila, 1-etilpropilaminocarbonila,

- hexilaminocarbonila, 1,1-dimetilpropilaminocarbonila, 1,2-dimetilpropilaminocarbonila, 1-metilpentilaminocarbonila, 2-metilpentilaminocarbonila, 3-metilpentilaminocarbonila, 4-metilpentilaminocarbonila, 1,1-dimetilbutilaminocarbonila, 1,2-dimetilbutilaminocarbonila, 1,3-dimetilbutilaminocarbonila, 2,2-dimetilbutilaminocarbonila, 2,3-dimetilbutilaminocarbonila, 3,3-dimetilbutilaminocarbonila, 1-etilbutilaminocarbonila, 2-etilbutilaminocarbonila, 1,1,2-trimetilpropilaminocarbonila, 1,2,2-trimetilpropilaminocarbonila, 1-etil-1-metilpropilaminocarbonila ou 1-etil-2-metilpropilaminocarbonila;
- 10 - di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila e também as porções di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila de di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonil-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarboniloxi-C₁-C₄-alquila e di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino-C₁-C₄-alquila:
- 15 di(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila como acima mencionado, e também, por exemplo, N-metil-N-pentilaminocarbonila, N-metil-N-(1-metilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(2-metilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(3-metilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(2,2-dimetilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-(1-etilpropil)aminocarbonila,
- 20 N-metil-N-hexilaminocarbonila, N-metil-N-(1,1-dimetilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-(1,2-dimetilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-(1-metilpentil)aminocarbonila, N-metil-N-(2-metilpentil)aminocarbonila, N-metil-N-(3-metilpentil)aminocarbonila, N-metil-N-(4-metilpentil)aminocarbonila, N-metil-N-(1,1-dimetilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(1,2-dimetilbutil)aminocarbonila,
- 25 N-metil-N-(1,3-dimetilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(2,2-dimetilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(2,3-dimetilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(3,3-dimetilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(1-etilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(2-etilbutil)aminocarbonila, N-metil-N-(1,1,2-

trimetilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-(1,2,2-
 trimetilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-(1-etil-1-
 metilpropil)aminocarbonila, N-metil-N-(1-etil-2-metilpropil)aminocarbonila,
 N-etil-N-pentilaminocarbonila, N-etil-N-(1-metilbutil)aminocarbonila, N-etil-
 5 N-(2-metilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-(3-metilbutil)aminocarbonila, N-
 etil-N-(2,2-dimetilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(1-
 etilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-hexilaminocarbonila, N-etil-N-(1,1-
 dimetilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(1,2-dimetilpropil)aminocarbonila, N-
 etil-N-(1-metilpentil)aminocarbonila, N-etil-N-(2-metilpentil)aminocarbonila,
 10 N-etil-N-(3-metilpentil)aminocarbonila, N-etil-N-(4-
 metilpentil)aminocarbonila, N-etil-N-(1,1-dimetilbutil)aminocarbonila, N-
 etil-N-(1,2-dimetilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-(1,3-
 dimetilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-(2,2-dimetilbutil)aminocarbonila, N-
 etil-N-(2,3-dimetilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-(3,3-
 15 dimetilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-(1-etilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-
 (2-etilbutil)aminocarbonila, N-etil-N-(1,1,2-trimetilpropil)aminocarbonila,
 N-etil-N-(1,2,2-trimetilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(1-etil-1-
 metilpropil)aminocarbonila, N-etil-N-(1-etil-2-metilpropil)aminocarbonila, N-
 propil-N-pentilaminocarbonila, N-butil-N-pentilaminocarbonila, N,N-
 20 dipentilaminocarbonila, N-propil-N-hexilaminocarbonila, N-butil-N-
 hexilaminocarbonila, N-pentil-N-hexilaminocarbonila ou N,N-
 dihexilaminocarbonila;

- di(C₁-C₆-alquil)aminotiocarbonila: por exemplo N,N-
 dimetilaminotiocarbonila, N,N-dietilaminotiocarbonila, N,N-di-(1-
 25 metiletil)aminotiocarbonila, N,N-dipropilaminotiocarbonila, N,N-
 dibutilaminotiocarbonila, N,N-di-(1-metilpropil)aminotiocarbonila, N,N-di-
 (2-metilpropil)aminotiocarbonila, N,N-di-(1,1-dimetiletil)aminotiocarbonila,
 N-etil-N-metilaminotiocarbonila, N-metil-N-propilaminotiocarbonila, N-
 metil-N-(1-metiletil)aminotiocarbonila, N-butil-N-metilaminotiocarbonila, N-

metil-N-(1-metilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(2-metilpropil)
 aminotiocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-metilaminotiocarbonila, N-etil-N-
 propilaminotiocarbonila, N-etil-N-(1-metiletil)aminotiocarbonila, N-butil-N-
 etilaminotiocarbonila, N-etil-N-(1-metilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2-
 5 metilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,1-dimetiletil)aminotiocarbonila,
 N-(1-metiletil)-N-propilaminotiocarbonila, N-butil-N-
 propilaminotiocarbonila, N-(1-metilpropil)-N-propilaminotiocarbonila, N-(2-
 metilpropil)-N-propilaminotiocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-
 propilaminotiocarbonila, N-butil-N-(1-metiletil)aminotiocarbonila, N-(1-
 10 metiletil)-N-(1-metilpropil) aminotiocarbonila, N-(1-metiletil)-N-(2-
 metilpropil)aminotiocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-
 metiletil)aminotiocarbonila, N-butil-N-(1-metilpropil)aminotiocarbonila, N-
 butil-N-(2-metilpropil)aminotiocarbonila, N-butil-N-(1,1-
 dimetiletil)aminotiocarbonila, N-(1-metilpropil)-N-(2-
 15 metilpropil)aminotiocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-
 metilpropil)aminotiocarbonila, N-(1,1-dimetiletil)-N-(2-
 metilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-pentilaminotiocarbonila, N-metil-
 N-(1-metilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(2-
 metilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(3-metilbutil)aminotiocarbonila, N-
 20 metil-N-(2,2-dimetilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1-
 etilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-hexilaminotiocarbonila, N-metil-N-
 (1,1-dimetilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1,2-
 dimetilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1-metilpentil)aminotiocarbonila,
 N-metil-N-(2-metilpentil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(3-
 25 metilpentil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(4-metilpentil)aminotiocarbonila,
 N-metil-N-(1,1-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1,2-
 dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1,3-
 dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(2,2-
 dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(2,3-

- dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(3,3-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1-etilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(2-etilbutil)aminotiocarbonila, N-metil-N-etil-N-(1,1,2-trimetilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1,2,2-trimetilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1-etil-1-metilpropil)aminotiocarbonila, N-metil-N-(1-etil-2-metilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-pentilaminotiocarbonila, N-etil-N-(1-metilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2-metilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(3-metilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2,2-dimetilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-1-etilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-hexilaminotiocarbonila, N-etil-N-(1,1-dimetilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,2-dimetilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1-metilpentil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2-metilpentil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(3-metilpentil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(4-metilpentil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,1-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,2-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,3-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2,2-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2,3-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(3,3-dimetilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1-etilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(2-etilbutil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,1,2-trimetilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1,2,2-trimetilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1-etil-1-metilpropil)aminotiocarbonila, N-etil-N-(1-etil-2-metilpropil)aminotiocarbonila, N-propil-N-pentilaminotiocarbonila, N-butyl-N-pentilaminotiocarbonila, N,N-dipentilaminotiocarbonila, N-propil-N-hexilaminotiocarbonila, N-butyl-N-hexilaminotiocarbonila, N-pentil-N-hexilaminotiocarbonila ou N,N-dihexilaminotiocarbonila;

- heterociclila de três a seis membros: hidrocarbonetos saturados ou parcialmente insaturados monocíclicos, tendo três a seis

membros no anel como mencionado acima que, além dos átomos de carbono, pode conter um a quatro átomos de nitrogênio ou um a três átomos de nitrogênio e um átomo de oxigênio ou enxofre ou um a três átomos de oxigênio ou um a três átomos de enxofre e que podem ser fixados via um

5 átomo de carbono ou um átomo de nitrogênio, por exemplo

por exemplo 2-oxiranila, 2-oxetanila, 3-oxetanila, 2-aziridinila, 3-tietanila, 1-azetidinila, 2-azetidinila,

por exemplo 2-tetraidrofuranoila, 3-tetraidrofuranoila, 2-tetraidrotienila, 3-tetraidrotienila, 2-pirrolidinila, 3-pirrolidinila, 3-

10 isoxazolidinila, 4-isoxazolidinila, 5-isoxazolidinila, 3-isotiazolidinila, 4-isotiazolidinila, 5-isotiazolidinila, 3-pirazolidinila, 4-pirazolidinila, 5-pirazolidinila, 2-oxazolidinila, 4-oxazolidinila, 5-oxazolidinila, 2-tiazolidinila, 4-tiazolidinila, 5-tiazolidinila, 2-imidazolidinila, 4-imidazolidinila, 1,2,4-

15 oxadiazolidin-3-ila, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ila, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ila, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ila, 1,2,4-triazolidin-3-ila, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ila, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ila, 1,3,4-triazolidin-2-ila, 1,2,3,4-tetrazolidin-5-ila;

por exemplo 1-pirrolidinila, 2-isotiazolidinila, 2-isotiazolidinila, 1-pirazolidinila, 3-oxazolidinila, 3-tiazolidinila, 1-imidazolidinila, 1,2,4-triazolidin-1-ila, 1,2,4-oxadiazolidin-2-ila, 1,2,4-

20 oxadiazolidin-4-ila, 1,2,4-tiadiazolidin-2-ila, 1,2,4-tiadiazolidin-4-ila, 1,2,3,4-tetrazolidin-1-ila,

por exemplo 2,3-diidrofur-2-ila, 2,3-diidrofur-3-ila, 2,4-diidrofur-2-ila, 2,4-diidrofur-3-ila, 2,3-diidrotien-2-ila, 2,3-diidrotien-3-ila, 2,4-diidrotien-2-ila, 2,4-diidrotien-3-ila, 4,5-diidropirrol-2-ila, 4,5-

25 diidropirrol-3-ila, 2,5-diidropirrol-2-ila, 2,5-diidropirrol-3-ila, 4,5-diidroisoxazol-3-ila, 2,5-diidroisoxazol-3-ila, 2,3-diidroisoxazol-3-ila, 4,5-diidroisoxazol-4-ila, 2,5-diidroisoxazol-4-ila, 2,3-diidroisoxazol-4-ila, 4,5-diidroisoxazol-5-ila, 2,5-diidroisoxazol-5-ila, 2,3-diidroisoxazol-5-ila, 4,5-diidroisotiazol-3-ila, 2,5-diidroisotiazol-3-ila, 2,3-diidroisotiazol-3-ila, 4,5-

- diidroisotiazol-4-ila, 2,5-diidroisotiazol-4-ila, 2,3-diidroisotiazol-4-ila, 4,5-diidroisotiazol-5-ila, 2,5-diidroisotiazol-5-ila, 2,3-diidroisotiazol-5-ila, 2,3-diidropirazol-2-ila, 2,3-diidropirazol-3-ila, 2,3-diidropirazol-4-ila, 2,3-diidropirazol-5-ila, 3,4-diidropirazol-3-ila, 3,4-diidropirazol-4-ila, 3,4-diidropirazol-5-ila, 4,5-diidropirazol-3-ila, 4,5-diidropirazol-4-ila, 4,5-diidropirazol-5-ila, 2,3-diidroimidazol-2-ila, 2,3-diidroimidazol-3-ila, 2,3-diidroimidazol-4-ila, 2,3-diidroimidazol-5-ila, 4,5-diidroimidazol-2-ila, 4,5-diidroimidazol-4-ila, 4,5-diidroimidazol-5-ila, 2,5-diidroimidazol-2-ila, 2,5-diidroimidazol-4-ila, 2,5-diidroimidazol-5-ila, 2,3-diidrooxazol-3-ila, 2,3-diidrooxazol-4-ila, 2,3-diidrooxazol-5-ila, 3,4-diidrooxazol-3-ila, 3,4-diidrooxazol-4-ila, 3,4-diidrooxazol-5-ila, 2,3-diidrotiazol-3-ila, 2,3-diidrotiazol-4-ila, 2,3-diidrotiazol-5-ila, 3,4-diidrotiazol-3-ila, 3,4-diidrotiazol-4-ila, 3,4-diidrotiazol-5-ila, 3,4-diidrotiazol-2-ila, 3,4-diidrotiazol-3-ila, 3,4-diidrotiazol-4-ila,
- 15 por exemplo 4,5-diidropirrol-1-ila, 2,5-diidropirrol-1-ila, 4,5-diidroisoxazol-2-ila, 2,3-diidroisoxazol-1-ila, 4,5-diidroisotiazol-1-ila, 2,3-diidroisotiazol-1-ila, 2,3-diidropirazol-1-ila, 4,5-diidropirazol-1-ila, 3,4-diidropirazol-1-ila, 2,3-diidroimidazol-1-ila, 4,5-diidroimidazol-1-ila, 2,5-diidroimidazol-1-ila, 2,3-diidrooxazol-2-ila, 3,4-diidrooxazol-2-ila, 2,3-diidrotiazol-2-ila, 3,4-diidrotiazol-2-ila;
- 20 por exemplo 2-piperidinila, 3-piperidinila, 4-piperidinila, 1,3-dioxan-2-ila, 1,3-dioxan-4-ila, 1,3-dioxan-5-ila, 1,4-dioxan-2-ila, 1,3-ditian-2-ila, 1,4-ditian-3-ila, 1,3-ditian-4-ila, 1,4-ditian-2-ila, 2-tetraidropiranila, 3-tetraidropiranila, 4-tetraidropiranila, 2-tetraidrotiopiranila, 3-tetraidrotiopiranila, 4-tetraidrotiopiranila, 3-hexahidropiridazinila, 4-hexahidropiridazinila, 2-hexahidropirimidinila, 4-hexahidropirimidinila, 5-hexahidropirimidinila, 2-piperazinila, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ila, 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ila, tetraidro-1,3-oxazin-2-ila, tetraidro-1,3-oxazin-6-ila, 2-morfolinila, 3-morfolinila, 1,3,5-trioxan-2-ila;
- 25

por exemplo 1-piperidinila, 1-hexahidropiridazinila, 1-hexahidropirimidinila, 1-piperazinila, 1,3,5-hexahidrotiazin-1-ila, 1,2,4-hexahidrotiazin-1-ila, tetraidro-1,3-oxazin-1-ila, 1-morfolinila;

por exemplo 2H-piran-2-ila, 2H-piran-3-ila, 2H-piran-4-ila, 2H-piran-5-ila, 2H-piran-6-ila, 3,6-diidro-2H-piran-2-ila, 3,6-diidro-2H-piran-3-ila, 3,6-diidro-2H-piran-4-ila, 3,6-diidro-2H-piran-5-ila, 3,6-diidro-2H-piran-6-ila, 3,4-diidro-2H-piran-3-ila, 3,4-diidro-2H-piran-4-ila, 3,4-diidro-2H-piran-6-ila, 2H-tiopiran-2-ila, 2H-tiopiran-3-ila, 2H-tiopiran-4-ila, 2H-tiopiran-5-ila, 2H-tiopiran-6-ila, 5,6-diidro-4H-1,3-oxazin-2-ila;

- arila e a porção arila de aril-(C₁-C₆-alquil), aril-(C₁-C₄-alquila): um carbociclo aromático monocíclico a tricíclico tendo 6 a 14 membros no anel, como, por exemplo, fenila, naftila e antracenila;

- heteroarila e também os radicais heteroarila em heteroaril-C₁-C₄-alquila, heteroaril-C₁-C₄-alquila, heteroaril-C₂-C₄-alquenila, heteroaril-C₂-C₄-alquinila, heteroaril-C₁-C₄-haloalquila, heteroaril-C₂-C₄-haloalquenila, heteroaril-C₂-C₄-haloalquinila, heteroaril-C₁-C₄-hidroxialquila, heteroaril-C₂-C₄-hidroxialquenila, heteroaril-C₂-C₄-hidroxialquinila, heteroarilcarbonil-C₁-C₄-alquila, heteroarilcarboniloxi-C₁-C₄-alquila, heteroariloxicarbonil-C₁-C₄-alquila, heteroariloxi-C₁-C₄-alquila, heteroariltio-C₁-C₄-alquila, heteroarilsulfinil-C₁-C₄-alquila, heteroarilsulfonil-C₁-C₄-alquila:

heteroarila aromática mono- ou bicíclica tendo 5 a 10 membros no anel que, além dos átomos de carbono, contém 1 a 4 átomos de nitrogênio, ou 1 a 3 átomos de nitrogênio e um átomo de oxigênio ou enxofre, ou um átomo de oxigênio ou enxofre, por exemplo

monociclos, como furila (por exemplo 2-furila, 3-furil), tienila (por exemplo 2-tienila, 3-tienil), pirrolila (por exemplo pirrol-2-ila, pirrol-3-il), pirazolila (por exemplo pirazol-3-ila, pirazol-4-il), isoxazolila (por exemplo isoxazol-3-ila, isoxazol-4-ila, isoxazol-5-il), isotiazolila (por exemplo isotiazol-3-ila, isotiazol-4-ila, isotiazol-5-il), imidazolila (por

exemplo imidazol-2-ila, imidazol-4-il), oxazolila (por exemplo oxazol-2-ila, oxazol-4-ila, oxazol-5-il), tiazolila (por exemplo tiazol-2-ila, tiazol-4-ila, tiazol-5-il), oxadiazolila (por exemplo 1,2,3-oxadiazol-4-ila, 1,2,3-oxadiazol-5-ila, 1,2,4-oxadiazol-3-ila, 1,2,4-oxadiazol-5-ila, 1,3,4-oxadiazol-2-il),
 5 tiadiazolila (por exemplo 1,2,3-tiadiazol-4-ila, 1,2,3-tiadiazol-5-ila, 1,2,4-tiadiazol-3-ila, 1,2,4-tiadiazol-5-ila, 1,3,4-tiadiazolil-2-il), triazolila (por exemplo 1,2,3-triazol-4-ila, 1,2,4-triazol-3-il), tetrazol-5-ila, piridila (por exemplo piridin-2-ila, piridin-3-ila, piridin-4-il), pirazinila (por exemplo piridazin-3-ila, piridazin-4-il), pirimidinila (por exemplo pirimidin-2-ila,
 10 pirimidin-4-ila, pirimidin-5-il), pirazin-2-ila, triazinila (por exemplo 1,3,5-triazin-2-ila, 1,2,4-triazin-3-ila, 1,2,4-triazin-5-ila, 1,2,4-triazin-6-il), tetrazinila (por exemplo 1,2,4,5-tetrazin-3-il); e também

biciclos como os derivados benzo fundidos dos acima mencionados monociclos, por exemplo quinolinila, isoquinolinila, indolila,
 15 benzotienila, benzofuranila, benzoxazolila, benzotiazolila, benzisotiazolila, benzimidazolila, benzopirazolila, benzotiadiazolila, benzotriazolila;

- heteroarila tendo, um a quatro átomos de nitrogênio de 5 a 6 membros, ou um a três átomos de nitrogênio e um átomo de oxigênio ou enxofre, ou tendo um átomo de oxigênio ou enxofre:

20 por exemplo heterociclos aromáticos, de 5 membros, que são fixados via um átomo de carbono e que, além dos átomos de carbono, podem conter um a quatro átomos de nitrogênio, ou um a três átomos de nitrogênio e um átomo de oxigênio ou enxofre, ou um átomo de oxigênio ou enxofre como membros no anel, por exemplo, 2-furila, 3-furila, 2-tienila, 3-tienila, 2-
 25 pirrolila, 3-pirrolila, 3-isoxazolila, 4-isoxazolila, 5-isoxazolila, 3-isotiazolila, 4-isotiazolila, 5-isotiazolila, 3-pirazolila, 4-pirazolila, 5-pirazolila, 2-oxazolila, 4-oxazolila, 5-oxazolila, 2-tiazolila, 4-tiazolila, 5-tiazolila, 2-imidazolila, 4-imidazolila, 1,2,4-oxadiazol-3-ila, 1,2,4-oxadiazol-5-ila, 1,2,4-tiadiazol-3-ila, 1,2,4-tiadiazol-5-ila, 1,2,4-triazol-3-ila, 1,3,4-oxadiazol-2-ila,

1,3,4-tiadiazol-2-ila e 1,3,4-triazol-2-ila;

por exemplo heterociclos aromáticos de 6 membros, que são fixados via um átomo de carbono e que, além dos átomos de carbono, podem conter um a quatro, preferivelmente um a três átomos de nitrogênio como

5 membros no anel, por exemplo, 2-piridinila, 3-piridinila, 4-piridinila, 3-piridazinila, 4-piridazinila, 2-pirimidinila, 4-pirimidinila, 5-pirimidinila, 2-pirazinila, 1,3,5-triazin-2-ila e 1,2,4-triazin-3-ila.

Em uma forma de realização particular, as variáveis das alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I tem os seguintes significados,

10 que tanto sozinhos como em combinação entre si, são formas de realização particulares dos compostos da fórmula I:

Preferência é dada às alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I em que

R^1 é halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_6 -haloalquila;

15 particularmente preferivelmente halogênio ou C_1 - C_6 -haloalquila;

especialmente preferivelmente halogênio ou C_1 - C_4 -haloalquila;
o mais preferivelmente flúor, cloro ou CF_3 .

Preferência é dada também às alaninas substituídas por

20 benzoíla da fórmula I em que

R^2 e R^3 , independentemente um do outro, são

hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_6 -haloalquila;

muito preferivelmente hidrogênio, halogênio ou C_1 - C_6 -haloalquila;

25 particularmente preferivelmente hidrogênio, halogênio ou C_1 - C_4 -haloalquila;

especialmente preferivelmente hidrogênio, flúor, cloro ou CF_3 ;
o mais preferivelmente hidrogênio, flúor ou cloro;
o mais extremamente preferivelmente hidrogênio ou flúor.

Preferência é dada também às alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I em que

R^4 é hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila;

5 particularmente preferivelmente hidrogênio, halogênio ou C_1 - C_4 -alquila;

especialmente preferivelmente hidrogênio ou halogênio;
o mais preferivelmente hidrogênio.

Preferência é dada também às alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I em que

R^5 é hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila;

particularmente preferivelmente hidrogênio, halogênio ou C_1 - C_4 -alquila;

15 especialmente preferivelmente hidrogênio ou halogênio;
o mais preferivelmente hidrogênio.

Preferência é dada também às alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I em que

R^6 é hidrogênio.

20 Preferência é dada também às alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I em que

R^7 é hidrogênio ou hidroxila;
particularmente preferivelmente hidrogênio.

Preferência é dada também às alaninas substituídas por

25 benzoíla da fórmula I em que

R^8 é C_1 - C_6 -alquila ou C_1 - C_6 -haloalquila;
particularmente preferivelmente C_1 - C_6 -alquila;
especialmente preferivelmente C_1 - C_4 -alquila;
o mais preferivelmente CH_3 .

Preferência é dada também às alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I em que

R^9 é hidrogênio ou C_1 - C_4 -alquila;

preferivelmente hidrogênio ou CH_3 ;

5 especialmente preferivelmente hidrogênio.

Preferência é dada também às alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I em que

R^{10} é hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_2 - C_6 -alquenila, C_2 - C_6 -alquinila, C_1 - C_6 -haloalquila, C_2 - C_6 -haloalquenila, C_2 - C_6 -haloalquinila, C_1 - C_6 -
10 cianoalquila, C_1 - C_6 -hidroxialquila, C_2 - C_6 -hidroxialquenila, C_2 - C_6 -hidroxialquinila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_3 - C_6 -cicloalquenila ou heterociclila de 3 a 6 membros,

onde radicais cicloalquila, cicloalquenila ou heterociclila de 3 a 6 membros acima mencionados podem ser parcialmente ou totalmente
15 halogenados e/ou podem carregar um a três radicais dentre o grupo consistindo de oxo, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -haloalquila, hidroxicarbonila e C_1 - C_6 -alcoxicarbonila;

C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_6 -haloalcoxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_6 -alquiltio- C_1 - C_4 -alquila, C_1 -
20 C_6 -alquilsulfonilamino- C_1 - C_4 -alquila, hidroxicarbonila, C_1 - C_6 -alcoxicarbonila, aminocarbonila, hidroxicarbonil- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_6 -alcoxicarbonil- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_6 -haloalcoxicarbonil- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_6 -alquilcarboniloxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_6 -alquilcarbonilamino- C_1 - C_4 -alquila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino- C_1 - C_4 -alquila, di(C₁-C₆-
25 alquil)aminocarbonilamino- C_1 - C_4 -alquila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarboniloxi- C_1 - C_4 -alquila, formilamino- C_1 - C_4 -alquila;

fenila, fenil- C_1 - C_4 -alquila, fenil- C_2 - C_4 -alquenila, fenil- C_2 - C_4 -alquinila, fenil- C_1 - C_4 -haloalquila, fenil- C_2 - C_4 -haloalquenila, fenil- C_1 - C_4 -hidroxialquila, feniloxi- C_1 - C_4 -alquila, feniltio- C_1 - C_4 -alquila, fenilsulfinil- C_1 -

C₄-alquila, fenilsulfonyl-C₁-C₄-alquila;

heteroarila, heteroaril-C₁-C₄-alquila, heteroaril-C₁-C₄-hidroxialquila, heteroariloxi-C₁-C₄-alquila, heteroariltio-C₁-C₄-alquila, heteroarilsulfonyl-C₁-C₄-alquila ou heteroarilsulfonyl-C₁-C₄-alquila,

5 onde os radicais fenila e heteroarila acima mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três radicais dentre o grupo consistindo de ciano, nitro, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-haloalquila, hidroxila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-haloalcóxi, hidroxicarbonila, C₁-C₆-alcoxicarbonila, hidroxicarbonil-C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-alquilsulfonylamino e
10 C₁-C₆-haloalquilsulfonylamino;

particularmente preferivelmente C₂-C₆-alquenila, C₁-C₆-haloalquila, heterociclila de 3 a 6 membros, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila, aminocarbonila, C₁-C₆-alquilcarbonilamino-C₁-C₄-alquila, formilamino-C₁-C₄-alquila, fenila ou
15 heteroarila,

onde uma heterociclila de 3 a 6 membros e os radicais fenila e heteroarila acima mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três radicais C₁-C₆-alquila;

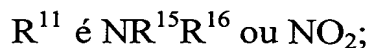
especialmente preferivelmente C₂-C₆-alquenila, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila, fenila ou heteroarila.
20

Preferência é dada também às alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I em que



particularmente preferivelmente OR^{14} .

25 Preferência é dada também às alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I em que



particularmente preferivelmente $NR^{15}R^{16}$.

Preferência é dada também às alaninas substituídas por

heteroarila da fórmula I em que

R^{11} é OR^{14} ou NO_2 ;

particularmente preferivelmente NO_2 .

Preferência é dada também às alaninas substituídas por

5 benzoíla da fórmula I em que

R^{12} é hidrogênio ou C_1 - C_6 -alquila;

particularmente preferivelmente hidrogênio ou C_1 - C_4 -alquila;

especialmente preferivelmente hidrogênio.

Preferência é dada também às alaninas substituídas por

10 benzoíla da fórmula I em que

R^{13} é hidrogênio ou C_1 - C_6 -alquila;

particularmente preferivelmente hidrogênio ou C_1 - C_4 -alquila;

especialmente preferivelmente hidrogênio.

Preferência é dada também às alaninas substituídas por

15 benzoíla da fórmula I em que

R^{14} e R^{15} em cada caso independentemente um do outro são

hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_3 - C_6 -alquenila, C_3 - C_6 -alquinila,

formila, C_1 - C_6 -alquilcarbonila, C_2 - C_6 -alquenilcarbonila, C_3 - C_6 -

cicloalquilcarbonila, C_1 - C_6 -alcoxycarbonila, aminocarbonila, C_1 - C_6 -

20 alquilaminocarbonila, C_1 - C_6 -alquilsulfonilaminocarbonila, di(C_1 - C_6 -

alquil)aminocarbonila, N-(C_1 - C_6 -alcoxi)-N-(C_1 - C_6 -alquil)aminocarbonila,

[(C_1 - C_6 -alquil)aminocarbonil(C_1 - C_6 -alquil)amino]carbonila, (C_1 - C_6 -

alquil)aminotiocarbonila, di(C_1 - C_6 -alquil)aminotiocarbonila, C_1 - C_6 -

alcoxiimino- C_1 - C_6 -alquila,

25 onde os radicais alquila, cicloalquila e alcóxi mencionados

podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a

três dos seguintes grupos: ciano, hidroxila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_1 - C_4 -alcóxi,

C_1 - C_4 -alquiltio, di(C_1 - C_4 -alquil)amino, C_1 - C_4 -alquilcarbonila,

hidroxycarbonila, C_1 - C_4 -alcoxycarbonila, aminocarbonila, C_1 - C_4 -

alquilaminocarbonila, di(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila ou C₁-C₄-alquilcarboniloxi;

fenila, fenil-C₁-C₆-alquila, fenilcarbonil-C₁-C₆-alquila, fenilsulfonilaminocarbonila ou fenil-C₁-C₆-alquilcarbonila,

5 onde um anel fenila pode ser parcialmente ou totalmente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: nitro, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₄-haloalcóxi; ou

SO₂R¹⁷;

Particularmente preferivelmente hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₃-
 10 C₆-alquenila, C₃-C₆-alquinila, formila, C₁-C₆-alquilcarbonila, C₂-C₆-alquenilcarbonila, C₁-C₆-alcoxicarbonila, aminocarbonila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, C₁-C₆-alquilsulfonilaminocarbonila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, N-(C₁-C₆-alcoxi)-N-(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, [(C₁-C₆-alquil)aminocarbonil(C₁-C₆-alquil)amino]carbonila, (C₁-C₆-
 15 alquil)aminotiocarbonila ou di(C₁-C₆-alquil)aminotiocarbonila,

onde os radicais alquila ou alcóxi mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três dos seguintes grupos: C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alcoxicarbonila, C₁-C₄-alquilaminocarbonila ou di(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila; ou

20 SO₂R¹⁷;

especialmente preferivelmente hidrogênio, C₁-C₆-alquila, formila, C₁-C₆-alquilcarbonila, C₁-C₆-haloalquilcarbonila, C₁-C₆-alcoxicarbonila, aminocarbonila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, N-(C₁-C₆-alcoxi)-N-(C₁-C₆-alquil)-aminocarbonila,
 25 [(C₁-C₆-alquil)aminocarbonil(C₁-C₆-alquil)amino]carbonila ou di(C₁-C₆-alquil)aminotiocarbonila; ou

SO₂R¹⁷.

Preferência é dada também às alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I em que

R^{14} e R^{15} em cada caso independentemente um do outro são

hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_3 - C_6 -alquenila, C_3 - C_6 -alquinila, formila, C_1 - C_6 -alquilcarbonila, C_2 - C_6 -alquenilcarbonila, C_3 - C_6 -cicloalquilcarbonila, C_1 - C_6 -alcoxycarbonila, aminocarbonila, C_1 - C_6 -alquilaminocarbonila, di(C_1 - C_6 -alquil)aminocarbonila, N-(C_1 - C_6 -alcoxi)-N-(C_1 - C_6 -alquil) aminocarbonila, [(C_1 - C_6 -alquil)aminocarbonil(C_1 - C_6 -alquil)amino]carbonila, di(C_1 - C_6 -alquil)aminotiocarbonila ou C_1 - C_6 -alcoxiimino- C_1 - C_6 -alquila,

onde os radicais alquila, cicloalquila ou alcóxi mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três dos seguintes grupos: ciano, hidroxila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -alquiltio, di(C_1 - C_4 -alquil)amino, C_1 - C_4 -alquilcarbonila, hidroxycarbonila, C_1 - C_4 -alcoxycarbonila, aminocarbonila, C_1 - C_4 -alquilaminocarbonila, di(C_1 - C_4 -alquil)aminocarbonila ou C_1 - C_4 -alquilcarboniloxi; ou

SO_2R^{17} .

Preferência é dada também às alaninas substituídas por heteroíla da fórmula I em que

R^{16} é hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, hidroxila ou C_1 - C_6 -alcóxi; particularmente preferivelmente hidrogênio ou C_1 - C_6 -alquila; especialmente preferivelmente hidrogênio ou metila; o mais preferivelmente hidrogênio.

Preferência é dada também às alaninas substituídas por heteroíla da fórmula I em que

R^{17} é C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -haloalquila, di(C_1 - C_6 -alquil)amino ou fenila,

onde um radical fenila pode ser parcialmente ou parcialmente halogenado e/ou pode ser substituído por C_1 - C_4 -alquila;

particularmente preferivelmente C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -

haloalquila, di(C₁-C₆-alquil)amino ou fenila;

especialmente preferivelmente metila, trifluorometila ou fenila.

Preferência é dada também às alaninas substituídas por
5 hetaroíla da fórmula I em que

R¹⁷ é C₁-C₆-alquila ou (C₁-C₆-alquil)amino;

particularmente preferivelmente C₁-C₄-alquila ou di(C₁-C₄-alquil)amino.

Preferência particular é dada às alaninas substituídas por
10 benzoíla da fórmula I em que

R¹ é flúor, cloro ou CF₃;

R² e R³, independentemente um do outro, são hidrogênio, flúor ou cloro;

R⁴, R⁵, R⁶ e R⁷ são hidrogênio;

15 R⁸ é C₁-C₄-alquila,

particularmente preferivelmente CH₃;

R⁹ é hidrogênio;

R¹⁰ é C₂-C₆-alquenila, C₁-C₆-haloalquila, heterociclila de 3 a 6
membros, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-
20 alquila, aminocarbonila, C₁-C₆-alquilcarbonilamino-C₁-C₄-alquila,
formilamino-C₁-C₄-alquila, fenila ou heteroarila, onde a heterociclila de 3 a 6
membros e os radicais fenila e heteroarila, acima mencionados, podem ser
parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três
radicais C₁-C₆-alquila;

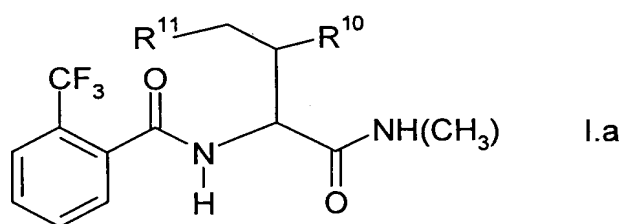
25 R¹² e R¹³ são hidrogênio;

R¹⁴ e R¹⁵ são hidrogênio, C₁-C₆-alquila, formila, C₁-C₆-
alquilcarbonila, C₁-C₆-haloalquilcarbonila, C₁-C₆-alcoxicarbonila,
aminocarbonila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, di(C₁-C₆-
alquil)aminocarbonila, N-(C₁-C₆-alcoxi)-N-(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila,

[(C₁-C₆-alquil)aminocarbonil(C₁-C₆-alquil)amino]carbonila ou di(C₁-C₆-alquil)aminotiocarbonila ou SO₂R¹⁷; e

R¹⁶ é hidrogênio.

- 5 A maior preferência é dada aos compostos da fórmula I.a (corresponde à fórmula I onde R¹ = CF₃, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹² e R¹³ = H; R⁸ = CH₃), especialmente os compostos das fórmulas I.a.1 a I.a.384 da tabela 1, onde as definições das variáveis R¹ a R¹³ são de particular importância para os compostos de acordo com a invenção não somente em combinação um com o outro mas em cada caso também sozinho.



10

Tabela 1

No.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.1	H	OH
I.a.2	CH ₃	OH
I.a.3	CH=CH ₂	OH
I.a.4	CH=CH(CH ₃)	OH
I.a.5	CH=C(CH ₃) ₂	OH
I.a.6	C(CH ₃)=CH ₂	OH
I.a.7	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OH
I.a.8	C≡CH	OH
I.a.9	C≡CCH ₃	OH
I.a.10	CF ₃	OH
I.a.11	CHF ₂	OH
I.a.12	CF ₂ CF ₃	OH
I.a.13	CH ₂ OH	OH
I.a.14	CH ₂ OCH ₃	OH
I.a.15	CH ₂ OC(O)CH ₃	OH
I.a.16	CH(OH)CH ₂ OH	OH
I.a.17	CH ₂ NHC(O)H	OH
I.a.18	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OH
I.a.19	ciclopropila	OH
I.a.20	ciclopentila	OH
I.a.21	ciclo-hexila	OH
I.a.22	ciclopenten-2-ila	OH
I.a.23	ciclo-hexen-2-ila	OH
I.a.24	tetraidrofur-2-ila	OH
I.a.25	tetraidrofur-3-ila	OH
I.a.26	tetraidropiran-2-ila	OH
I.a.27	tetraidropiran-3-ila	OH

No.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.28	tetraidropiran-4-ila	OH
I.a.29	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	OH
I.a.30	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	OH
I.a.31	fenila	OH
I.a.32	pirid-2-ila	OH
I.a.33	H	OC(O)H
I.a.34	CH ₃	OC(O)H
I.a.35	CH=CH ₂	OC(O)H
I.a.36	CH=CH(CH ₃)	OC(O)H
I.a.37	CH=C(CH ₃) ₂	OC(O)H
I.a.38	C(CH ₃)=CH ₂	OC(O)H
I.a.39	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OC(O)H
I.a.40	C≡CH	OC(O)H
I.a.41	C≡CCH ₃	OC(O)H
I.a.42	CF ₃	OC(O)H
I.a.43	CHF ₂	OC(O)H
I.a.44	CF ₂ CF ₃	OC(O)H
I.a.45	CH ₂ OH	OC(O)H
I.a.46	CH ₂ OCH ₃	OC(O)H
I.a.47	CH ₂ OC(O)CH ₃	OC(O)H
I.a.48	CH(OH)CH ₂ OH	OC(O)H
I.a.49	CH ₂ NHC(O)H	OC(O)H
I.a.50	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OC(O)H
I.a.51	ciclopropila	OC(O)H
I.a.52	ciclopentila	OC(O)H
I.a.53	ciclo-hexila	OC(O)H
I.a.54	ciclopenten-2-ila	OC(O)H
I.a.55	ciclo-hexen-2-ila	OC(O)H
I.a.56	tetraidrofur-2-ila	OC(O)H
I.a.57	tetraidrofur-3-ila	OC(O)H
I.a.58	tetraidropiran-2-ila	OC(O)H
I.a.59	tetraidropiran-3-ila	OC(O)H
I.a.60	tetraidropiran-4-ila	OC(O)H
I.a.61	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	OC(O)H
I.a.62	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	OC(O)H
I.a.63	fenila	OC(O)H
I.a.64	pirid-2-ila	OC(O)H
I.a.65	H	OC(O)CH ₃
I.a.66	CH ₃	OC(O)CH ₃
I.a.67	CH=CH ₂	OC(O)CH ₃
I.a.68	CH=CH(CH ₃)	OC(O)CH ₃
I.a.69	CH=C(CH ₃) ₂	OC(O)CH ₃
I.a.70	C(CH ₃)=CH ₂	OC(O)CH ₃
I.a.71	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OC(O)CH ₃
I.a.72	C≡CH	OC(O)CH ₃
I.a.73	C≡CCH ₃	OC(O)CH ₃
I.a.74	CF ₃	OC(O)CH ₃
I.a.75	CHF ₂	OC(O)CH ₃
I.a.76	CF ₂ CF ₃	OC(O)CH ₃
I.a.77	CH ₂ OH	OC(O)CH ₃
I.a.78	CH ₂ OCH ₃	OC(O)CH ₃
I.a.79	CH ₂ OC(O)CH ₃	OC(O)CH ₃
I.a.80	CH(OH)CH ₂ OH	OC(O)CH ₃

No.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.81	CH ₂ NHC(O)H	OC(O)CH ₃
I.a.82	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OC(O)CH ₃
I.a.83	ciclopropila	OC(O)CH ₃
I.a.84	ciclopentila	OC(O)CH ₃
I.a.85	ciclo-hexila	OC(O)CH ₃
I.a.86	ciclopenten-2-ila	OC(O)CH ₃
I.a.87	ciclo-hexen-2-ila	OC(O)CH ₃
I.a.88	tetraidrofur-2-ila	OC(O)CH ₃
I.a.89	tetraidrofur-3-ila	OC(O)CH ₃
I.a.90	tetraidropiran-2-ila	OC(O)CH ₃
I.a.91	tetraidropiran-3-ila	OC(O)CH ₃
I.a.92	tetraidropiran-4-ila	OC(O)CH ₃
I.a.93	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	OC(O)CH ₃
I.a.94	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	OC(O)CH ₃
I.a.95	fenila	OC(O)CH ₃
I.a.96	pirid-2-ila	OC(O)CH ₃
I.a.97	H	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.98	CH ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.99	CH=CH ₂	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.100	CH=CH(CH ₃)	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.101	CH=C(CH ₃) ₂	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.102	C(CH ₃)=CH ₂	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.103	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.104	C≡CH	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.105	C≡CCH ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.106	CF ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.107	CHF ₂	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.108	CF ₂ CF ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.109	CH ₂ OH	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.110	CH ₂ OCH ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.111	CH ₂ OC(O)CH ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.112	CH(OH)CH ₂ OH	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.113	CH ₂ NHC(O)H	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.114	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.115	ciclopropila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.116	ciclopentila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.117	ciclo-hexila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.118	ciclopenten-2-ila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.119	ciclo-hexen-2-ila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.120	tetraidrofur-2-ila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.121	tetraidrofur-3-ila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.122	tetraidropiran-2-ila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.123	tetraidropiran-3-ila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.124	tetraidropiran-4-ila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.125	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.126	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.127	fenila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.128	pirid-2-ila	OC(O)NH(CH ₃)
I.a.129	H	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.130	CH ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.131	CH=CH ₂	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.132	CH=CH(CH ₃)	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.133	CH=C(CH ₃) ₂	OC(O)N(CH ₃) ₂

No.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.134	C(CH ₃)=CH ₂	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.135	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.136	C≡CH	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.137	C≡CCH ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.138	CF ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.139	CHF ₂	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.140	CF ₂ CF ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.141	CH ₂ OH	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.142	CH ₂ OCH ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.143	CH ₂ OC(O)CH ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.144	CH(OH)CH ₂ OH	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.145	CH ₂ NHC(O)H	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.146	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.147	ciclopropila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.148	ciclopentila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.149	ciclo-hexila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.150	ciclopenten-2-ila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.151	ciclo-hexen-2-ila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.152	tetraidrofur-2-ila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.153	tetraidrofur-3-ila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.154	tetraidropiran-2-ila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.155	tetraidropiran-3-ila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.156	tetraidropiran-4-ila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.157	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.158	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.159	fenila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.160	pirid-2-ila	OC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.161	H	OC(O)OCH ₃
I.a.162	CH ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.163	CH=CH ₂	OC(O)OCH ₃
I.a.164	CH=CH(CH ₃)	OC(O)OCH ₃
I.a.165	CH=C(CH ₃) ₂	OC(O)OCH ₃
I.a.166	C(CH ₃)=CH ₂	OC(O)OCH ₃
I.a.167	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	OC(O)OCH ₃
I.a.168	C≡CH	OC(O)OCH ₃
I.a.169	C≡CCH ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.170	CF ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.171	CHF ₂	OC(O)OCH ₃
I.a.172	CF ₂ CF ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.173	CH ₂ OH	OC(O)OCH ₃
I.a.174	CH ₂ OCH ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.175	CH ₂ OC(O)CH ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.176	CH(OH)CH ₂ OH	OC(O)OCH ₃
I.a.177	CH ₂ NHC(O)H	OC(O)OCH ₃
I.a.178	CH ₂ NHC(O)CH ₃	OC(O)OCH ₃
I.a.179	ciclopropila	OC(O)OCH ₃
I.a.180	ciclopentila	OC(O)OCH ₃
I.a.181	ciclo-hexila	OC(O)OCH ₃
I.a.182	ciclopenten-2-ila	OC(O)OCH ₃
I.a.183	ciclo-hexen-2-ila	OC(O)OCH ₃
I.a.184	tetraidrofur-2-ila	OC(O)OCH ₃
I.a.185	tetraidrofur-3-ila	OC(O)OCH ₃
I.a.186	tetraidropiran-2-ila	OC(O)OCH ₃

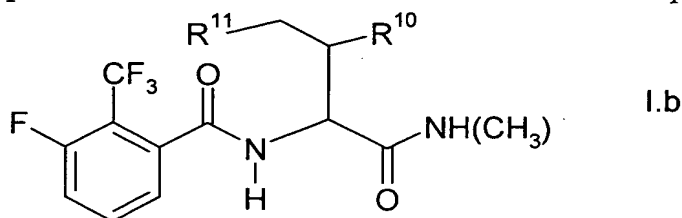
No.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.187	tetraidropiran-3-ila	OC(O)OCH ₃
I.a.188	tetraidropiran-4-ila	OC(O)OCH ₃
I.a.189	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	OC(O)OCH ₃
I.a.190	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	OC(O)OCH ₃
I.a.191	fenila	OC(O)OCH ₃
I.a.192	pirid-2-ila	OC(O)OCH ₃
I.a.193	H	NH ₂
I.a.194	CH ₃	NH ₂
I.a.195	CH=CH ₂	NH ₂
I.a.196	CH=CH(CH ₃)	NH ₂
I.a.197	CH=C(CH ₃) ₂	NH ₂
I.a.198	C(CH ₃)=CH ₂	NH ₂
I.a.199	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NH ₂
I.a.200	C≡CH	NH ₂
I.a.201	C≡CCH ₃	NH ₂
I.a.202	CF ₃	NH ₂
I.a.203	CHF ₂	NH ₂
I.a.204	CF ₂ CF ₃	NH ₂
I.a.205	CH ₂ OH	NH ₂
I.a.206	CH ₂ OCH ₃	NH ₂
I.a.207	CH ₂ OC(O)CH ₃	NH ₂
I.a.208	CH(OH)CH ₂ OH	NH ₂
I.a.209	CH ₂ NHC(O)H	NH ₂
I.a.210	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NH ₂
I.a.211	ciclopropila	NH ₂
I.a.212	ciclopentila	NH ₂
I.a.213	ciclo-hexila	NH ₂
I.a.214	ciclopenten-2-ila	NH ₂
I.a.215	ciclo-hexen-2-ila	NH ₂
I.a.216	tetraidrofur-2-ila	NH ₂
I.a.217	tetraidrofur-3-ila	NH ₂
I.a.218	tetraidropiran-2-ila	NH ₂
I.a.219	tetraidropiran-3-ila	NH ₂
I.a.220	tetraidropiran-4-ila	NH ₂
I.a.221	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	NH ₂
I.a.222	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	NH ₂
I.a.223	fenila	NH ₂
I.a.224	pirid-2-ila	NH ₂
I.a.225	H	NHC(O)H
I.a.226	CH ₃	NHC(O)H
I.a.227	CH=CH ₂	NHC(O)H
I.a.228	CH=CH(CH ₃)	NHC(O)H
I.a.229	CH=C(CH ₃) ₂	NHC(O)H
I.a.230	C(CH ₃)=CH ₂	NHC(O)H
I.a.231	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NHC(O)H
I.a.232	C≡CH	NHC(O)H
I.a.233	C≡CCH ₃	NHC(O)H
I.a.234	CF ₃	NHC(O)H
I.a.235	CHF ₂	NHC(O)H
I.a.236	CF ₂ CF ₃	NHC(O)H
I.a.237	CH ₂ OH	NHC(O)H
I.a.238	CH ₂ OCH ₃	NHC(O)H
I.a.239	CH ₂ OC(O)CH ₃	NHC(O)H

No.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.240	CH(OH)CH ₂ OH	NHC(O)H
I.a.241	CH ₂ NHC(O)H	NHC(O)H
I.a.242	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NHC(O)H
I.a.243	ciclopropila	NHC(O)H
I.a.244	ciclopentila	NHC(O)H
I.a.245	ciclo-hexila	NHC(O)H
I.a.246	ciclopenten-2-ila	NHC(O)H
I.a.247	ciclo-hexen-2-ila	NHC(O)H
I.a.248	tetraidrofur-2-ila	NHC(O)H
I.a.249	tetraidrofur-3-ila	NHC(O)H
I.a.250	tetraidropiran-2-ila	NHC(O)H
I.a.251	tetraidropiran-3-ila	NHC(O)H
I.a.252	tetraidropiran-4-ila	NHC(O)H
I.a.253	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	NHC(O)H
I.a.254	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	NHC(O)H
I.a.255	fenila	NHC(O)H
I.a.256	pirid-2-ila	NHC(O)H
I.a.257	H	NHC(O)CH ₃
I.a.258	CH ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.259	CH=CH ₂	NHC(O)CH ₃
I.a.260	CH=CH(CH ₃)	NHC(O)CH ₃
I.a.261	CH=C(CH ₃) ₂	NHC(O)CH ₃
I.a.262	C(CH ₃)=CH ₂	NHC(O)CH ₃
I.a.263	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NHC(O)CH ₃
I.a.264	C=CH	NHC(O)CH ₃
I.a.265	C=CCH ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.266	CF ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.267	CHF ₂	NHC(O)CH ₃
I.a.268	CF ₂ CF ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.269	CH ₂ OH	NHC(O)CH ₃
I.a.270	CH ₂ OCH ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.271	CH ₂ OC(O)CH ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.272	CH(OH)CH ₂ OH	NHC(O)CH ₃
I.a.273	CH ₂ NHC(O)H	NHC(O)CH ₃
I.a.274	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NHC(O)CH ₃
I.a.275	ciclopropila	NHC(O)CH ₃
I.a.276	ciclopentila	NHC(O)CH ₃
I.a.277	ciclo-hexila	NHC(O)CH ₃
I.a.278	ciclopenten-2-ila	NHC(O)CH ₃
I.a.279	ciclo-hexen-2-ila	NHC(O)CH ₃
I.a.280	tetraidrofur-2-ila	NHC(O)CH ₃
I.a.281	tetraidrofur-3-ila	NHC(O)CH ₃
I.a.282	tetraidropiran-2-ila	NHC(O)CH ₃
I.a.283	tetraidropiran-3-ila	NHC(O)CH ₃
I.a.284	tetraidropiran-4-ila	NHC(O)CH ₃
I.a.285	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	NHC(O)CH ₃
I.a.286	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	NHC(O)CH ₃
I.a.287	fenila	NHC(O)CH ₃
I.a.288	pirid-2-ila	NHC(O)CH ₃
I.a.289	H	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.290	CH ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.291	CH=CH ₂	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.292	CH=CH(CH ₃)	NHC(O)NH(CH ₃)

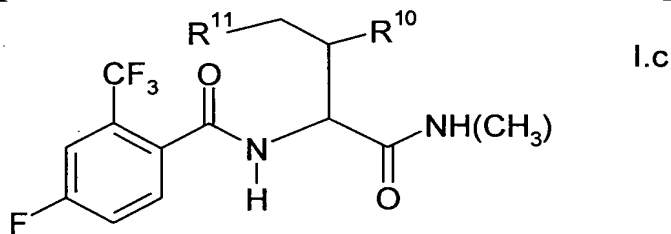
No.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.293	CH=C(CH ₃) ₂	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.294	C(CH ₃)=CH ₂	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.295	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.296	C≡CH	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.297	C≡CCH ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.298	CF ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.299	CHF ₂	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.300	CF ₂ CF ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.301	CH ₂ OH	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.302	CH ₂ OCH ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.303	CH ₂ OC(O)CH ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.304	CH(OH)CH ₂ OH	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.305	CH ₂ NHC(O)H	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.306	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.307	ciclopropila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.308	ciclopentila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.309	ciclo-hexila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.310	ciclopenten-2-ila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.311	ciclo-hexen-2-ila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.312	tetraidrofur-2-ila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.313	tetraidrofur-3-ila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.314	tetraidropiran-2-ila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.315	tetraidropiran-3-ila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.316	tetraidropiran-4-ila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.317	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.318	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.319	fenila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.320	pirid-2-ila	NHC(O)NH(CH ₃)
I.a.321	H	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.322	CH ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.323	CH=CH ₂	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.324	CH=CH(CH ₃)	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.325	CH=C(CH ₃) ₂	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.326	C(CH ₃)=CH ₂	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.327	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.328	C≡CH	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.329	C≡CCH ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.330	CF ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.331	CHF ₂	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.332	CF ₂ CF ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.333	CH ₂ OH	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.334	CH ₂ OCH ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.335	CH ₂ OC(O)CH ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.336	CH(OH)CH ₂ OH	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.337	CH ₂ NHC(O)H	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.338	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.339	ciclopropila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.340	ciclopentila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.341	ciclo-hexila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.342	ciclopenten-2-ila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.343	ciclo-hexen-2-ila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.344	tetraidrofur-2-ila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.345	tetraidrofur-3-ila	NHC(O)N(CH ₃) ₂

No.	R ¹⁰	R ¹¹
I.a.346	tetraidropiran-2-ila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.347	tetraidropiran-3-ila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.348	tetraidropiran-4-ila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.349	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.350	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.351	fenila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.352	pirid-2-ila	NHC(O)N(CH ₃) ₂
I.a.353	H	NHC(O)OCH ₃
I.a.354	CH ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.355	CH=CH ₂	NHC(O)OCH ₃
I.a.356	CH=CH(CH ₃)	NHC(O)OCH ₃
I.a.357	CH=C(CH ₃) ₂	NHC(O)OCH ₃
I.a.358	C(CH ₃)=CH ₂	NHC(O)OCH ₃
I.a.359	C(CH ₃)=CH(CH ₃)	NHC(O)OCH ₃
I.a.360	C≡CH	NHC(O)OCH ₃
I.a.361	C≡CCH ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.362	CF ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.363	CHF ₂	NHC(O)OCH ₃
I.a.364	CF ₂ CF ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.365	CH ₂ OH	NHC(O)OCH ₃
I.a.366	CH ₂ OCH ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.367	CH ₂ OC(O)CH ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.368	CH(OH)CH ₂ OH	NHC(O)OCH ₃
I.a.369	CH ₂ NHC(O)H	NHC(O)OCH ₃
I.a.370	CH ₂ NHC(O)CH ₃	NHC(O)OCH ₃
I.a.371	ciclopropila	NHC(O)OCH ₃
I.a.372	ciclopentila	NHC(O)OCH ₃
I.a.373	ciclo-hexila	NHC(O)OCH ₃
I.a.374	ciclopenten-2-ila	NHC(O)OCH ₃
I.a.375	ciclo-hexen-2-ila	NHC(O)OCH ₃
I.a.376	tetraidrofur-2-ila	NHC(O)OCH ₃
I.a.377	tetraidrofur-3-ila	NHC(O)OCH ₃
I.a.378	tetraidropiran-2-ila	NHC(O)OCH ₃
I.a.379	tetraidropiran-3-ila	NHC(O)OCH ₃
I.a.380	tetraidropiran-4-ila	NHC(O)OCH ₃
I.a.381	3,6-diidro-2H-piran-4-ila	NHC(O)OCH ₃
I.a.382	3,6-diidro-2H-piran-5-ila	NHC(O)OCH ₃
I.a.383	fenila	NHC(O)OCH ₃
I.a.384	pirid-2-ila	NHC(O)OCH ₃

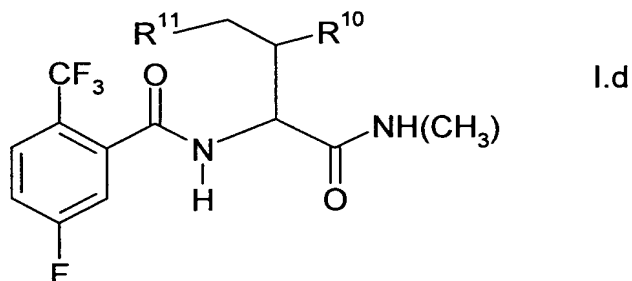
A maior preferência é dada também aos compostos da fórmula I.b, especialmente os compostos das fórmulas I.b.1 a I.b.384 que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.384 em que R² é flúor:



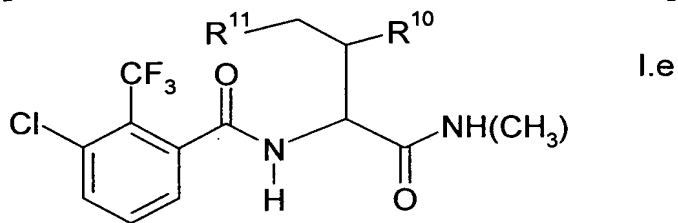
A maior preferência é dada também aos compostos da fórmula I.c, especialmente os compostos das fórmulas I.c.1 a I.c.384 que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.384 em que R³ é flúor:



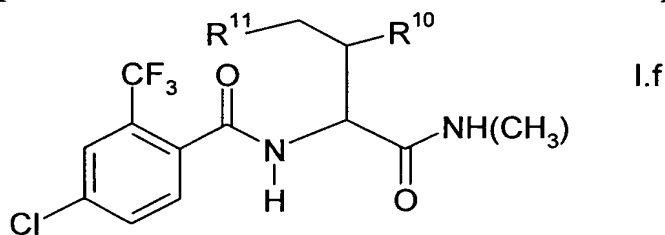
5 A maior preferência é dada também aos compostos da fórmula I.d, especialmente os compostos das fórmulas I.d.1 a I.d.384 que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.384 em que R⁴ é flúor:



10 A maior preferência é dada também aos compostos da fórmula I.e, especialmente os compostos das fórmulas I.e.1 to I.e.384 que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.384 em que R² é cloro:

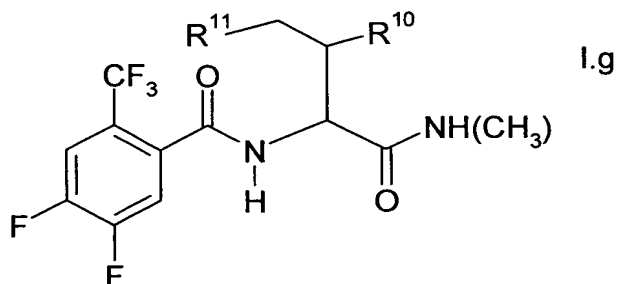


A maior preferência é dada também aos compostos da fórmula I.f, especialmente os compostos das fórmulas I.f.1 a I.f.384 que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.384 em que R³ é cloro:

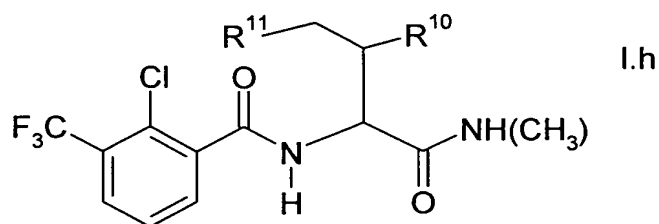


A maior preferência é dada também aos compostos da fórmula

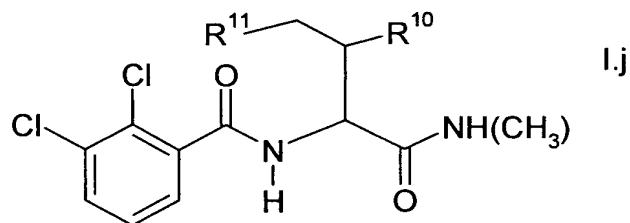
I.g, especialmente os compostos das fórmulas I.g.1 a I.g.384 que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.384 em que R^3 e R^4 são flúor:



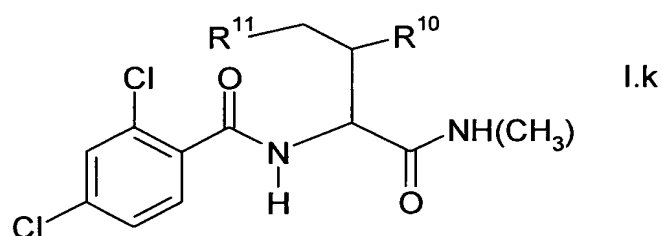
5 A maior preferência é dada também aos compostos da fórmula I.h, especialmente os compostos das fórmulas I.h.1 a I.h.384 que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.384 em que R^1 é cloro e R^2 é CF_3 :



10 A maior preferência é dada também aos compostos da fórmula I.j, especialmente os compostos das fórmulas I.j.1 a I.j.384 que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.384 em que R^1 e R^2 são cloro:



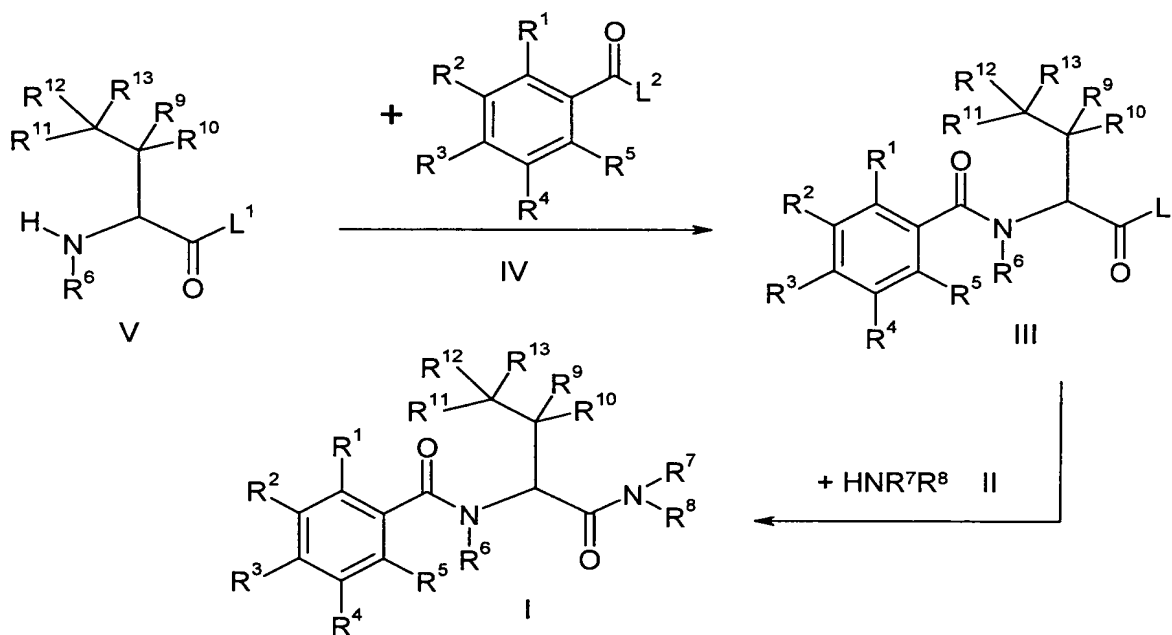
15 A maior preferência é dada também aos compostos da fórmula I.k, especialmente os compostos das fórmulas I.k.1 a I.k.384 que diferem dos compostos correspondentes das fórmulas I.a.1 a I.a.384 em que R^1 e R^3 são cloro:



As alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I podem ser obtidas por vias diferentes, por exemplo pelos seguintes processos:

Processo A

Derivados de alanina da fórmula V são inicialmente reagidos com ácidos benzóicos/derivados de ácido benzóico da fórmula IV para dar os correspondentes derivados de benzoíla da fórmula III que então reagem com aminas da fórmula II para dar as desejadas alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I:



L^1 é um grupo de saída nucleofílicamente deslocável, por exemplo hidroxila ou C_1 - C_6 -alcóxi.

L^2 é um grupo de saída nucleofílicamente deslocável, por exemplo hidroxila, halogênio, C_1 - C_6 -alquilcarbonila, C_1 - C_6 -alcoxicarbonila, C_1 - C_4 -alquilsulfonila, fosforila ou isoureíla.

A reação dos derivados de alanina da fórmula V com ácidos benzóicos/derivados de ácido benzóico da fórmula IV onde L^2 é hidroxila

para dar derivados de benzoíla da fórmula III é realizada na presença de um agente ativante e uma base, geralmente em temperaturas de 0°C para o ponto de ebulição de uma mistura de reação, preferivelmente de 0°C a 110°C, particularmente preferivelmente em temperatura ambiente, em um solvente orgânico inerte [confere C. Montalbetti et al., Tetrahedron 2005, 61, 10827 e a literatura citada no mesmo].

Os agente ativantes apropriados são agentes condensantes, como, por exemplo, diciclo-hexilcarbodiimida suportada em poliestireno, diisopropilcarbodiimida, carbonildiimidazol, cloroformatos, como metil cloroformato, etil cloroformato, isopropil cloroformato, isobutil cloroformato, *sec*-butil cloroformato ou alil cloroformato, cloreto de pivaloíla, ácido polifosfórico, anidrido propanofosfônico, cloreto de (bis(2-oxo-3-oxazolidinil)-fosforila BOPCl) ou cloretos de sulfonila, como cloreto de metanossulfonila, cloreto de toluenossulfonila ou cloreto de benzenossulfonila.

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C₅-C₈-alcanos, hidrocarbonetos aromáticos, como benzeno, tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano (THF), nitrilas, como acetonitrila e propionitrila, cetonas, como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA) e N-metilpirrolidona (NMP) ou também em água; preferência particular é dada aos cloreto de metileno, THF e água.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

As bases apropriadas são, em geral, compostos inorgânicos, como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio,

óxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidreto de lítio, hidreto de sódio, hidreto de potássio e hidreto de cálcio, carbonatos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como carbonato e lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, e também bicarbonatos de metal alcalino, como bicarbonato de sódio, além disso, bases orgânicas, por exemplo aminas terciárias, como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina, N-metilmorfolina, e N-metilpiperidina, piridina, substituído piridinas, como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. Preferência particular é dada aos hidróxido de sódio, trietilamina e piridina.

As bases são geralmente empregadas em quantidades equimolares. No entanto, elas também podem ser usadas em excesso e, se apropriado, como solventes.

Os edutos são geralmente reagidos um com o outro em quantidades equimolares. Eles podem com vantagem empregar um excesso de IV, com base em V.

As misturas de reação são trabalhadas em um modo comum, por exemplo por misturação com água, separação das fases e, se apropriado, purificação cromatográfica de produtos brutos. Alguns dos intermediários e produtos finais são obtidos na forma de óleos viscosos que podem ser purificados ou livres de componentes voláteis sob pressão reduzida e em temperatura moderadamente elevada. Se os intermediários e produtos finais forem obtidos como sólidos, a purificação também pode ser realizada por recristalização ou digestão.

A reação dos derivados de alanina da fórmula V com ácidos benzóicos/derivados de ácido benzóico da fórmula IV onde L^2 é halogênio, C_1 - C_6 -alquilcarbonila, C_1 - C_6 -alcoxycarbonila, C_1 - C_4 -alquilsulfonila, fosforila ou isoureíla para dar derivados de benzoíla da fórmula III é realizada na

presença de uma base, geralmente em temperaturas de 0°C para o ponto de ebulição de uma mistura de reação, preferivelmente de 0°C a 100 °C, particularmente preferivelmente em temperatura ambiente, em um solvente orgânico inerte [confere C. Montalbetti et al., Tetrahedron 2005, 61, 10827 e
5 literatura citada no mesmo].

Apropriados solventes são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C₅-C₈-alcanos, hidrocarbonetos aromáticos, como benzeno, tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres,
10 como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano (THF), nitrilas, como acetonitrila e propionitrila, cetonas, como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA) e N-metilpirrolidona (NMP) ou também em água; preferência
15 particular é dada aos cloreto de metileno, THF e água.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Bases apropriadas são, em geral, compostos inorgânicos, como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio, óxidos de
20 metal alcalino e metal alcalino-terroso, como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidreto de lítio, hidreto de sódio, hidreto de potássio e hidreto de cálcio, carbonatos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, e também
25 bicarbonatos de metal alcalino, como bicarbonato de sódio, além de bases orgânicas, por exemplo aminas terciárias, como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina, N-metilmorfolina, e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. Preferência particular é dada aos hidróxido de

sódio, trietilamina e piridina.

As bases são geralmente empregadas em quantidades equimolares. No entanto, elas também podem ser usadas em excesso ou, se apropriado, como solventes.

- 5 Os edutos são geralmente reagidos um com o outro em quantidades equimolares. Pode ser vantajoso empregar um excesso de IV, com base em V.

Trabalho e isolamento dos produtos podem ser realizados em um modo conhecido por si.

- 10 Também é possível, como evidente, reagir inicialmente, em um modo análogo, os derivados de alanina da fórmula V com aminas da fórmula II para dar as amidas correspondentes que são então reagidas com ácidos benzóicos/derivados de ácido benzóico da fórmula IV para dar as desejadas alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I.

- 15 Os derivados de alanina da fórmula V (por exemplo onde L^1 = hidroxila ou C_1 - C_6 -alcoxi) requeridos para preparar os derivados de benzoíla da fórmula III são, mesmo em uma forma enantiomericamente e diastereomericamente pura, conhecidos da literatura, ou eles podem ser preparados de acordo com a literatura citada.

- 20 1. Adição de equivalentes de enolato de glicina a nitroolefinas:

B. Mendler et al., Org. Lett. 2005, 7(9), 1715; D. Dixon et al., Org. Lett. 2004, 6(24), 4427; M. Alcantara et al., Synthesis 1996, (1), 64; M. Rowley et al., Tetrahedron 1992, 48(17), 3557.

2. Rearranjo de derivados de glicina alilamina:

- 25 J. Blid et al., J. Am. Chem. Soc. 2005, 127(26), 9352. H. Mues et al., Synthesis 2001, (3), 487; U. Kazmaier, Angew. Chem. 1994, 106(9), 1046.

3. Adição de equivalentes de enolato de glicina a epóxidos:

V. Rolland-Fulcrand et al., Europ. J. of Org. Chem. 2004, (4),

873; U. Schoellkopf et al., *Angew. Chem.* 1986, 98(8), 755.

Os ácidos benzóicos/derivados de ácido benzóico da fórmula IV requeridos para preparar os derivados de benzoíla da fórmula III são comercialmente disponíveis ou podem ser preparados de modo análogo aos procedimentos conhecidos da literatura por meio de uma reação de Grignard a partir do halogeneto correspondente [por exemplo Chang-Ling Liu et al., *J. of Fluorine Chem.* (2004), 125(9), 1287-1290; Manfred Sclosser et al., *Europ. J. of Org. Chem.* (2002), (17), 2913-2920; Hoh-Gyu Hahn et al., *Agricult. Chem. and Biotech.* (Ed. em inglês) (2002), 45(1), 37-42; Jonatan O Smith et al., *J. of Fluorine Chem.* (1997), Vol. 1996-1997, 81(2), 123-128; Etsuji Okada et al., *Heterocycles* (1992), 34(4), 791-798; Aliyu B. Abubakar et al., *J. of Fluorine Chem.* (1991), 55(2), 189-198; J. Leroy, *J. of Fluorine Chem.* (1991), 53(1), 61-70; Len F. Lee et al., *J. of Heterocyclic Chem.* (1990), 27(2), 243-245; Len F. Lee et al., *J. of Heterocyclic Chem.* (1985), 22(6), 1621-1630; Jacques Leroy et al., *Synthesis* (1982), (4), 313-315].

A reação dos derivados de benzoíla da fórmula III onde L^1 = hidroxila ou sais dos mesmos com aminas da fórmula II para dar as desejadas serina amidas substituídas por benzoíla da fórmula I é realizada na presença de um agente ativante e, se apropriado, na presença de uma base, geralmente em temperaturas de 0°C para o ponto de ebulição de uma mistura de reação, preferivelmente de 0°C a 100°C, particularmente preferivelmente em temperatura ambiente, em um solvente orgânico inerte [confere C. Montalbetti et al., *Tetrahedron* 2005, 61, 10827 e literatura citada no mesmo].

Os agentes ativantes apropriados são agentes condensantes, como, por exemplo, poliestireno- diciclo-hexilcarbodiimida suportada, diisopropilcarbodiimida, carbonildimidazol, cloroformatos, como cloroformato de metila, cloroformato de etila, cloroformato de isopropila, cloroformato de isobutila, cloroformato de *sec*-butila ou cloroformato de alila, cloreto de pivaloíla, ácido polifosfórico, anidrido propanofosfônico, cloreto

de bis(2-oxo-3-oxazolidinil)-fosforila (BOPCl) ou cloretos de sulfonila, como cloreto de metanossulfonila, cloreto de toluenossulfonila ou cloreto de benzenossulfonila.

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C₅-C₈-alcanos, hidrocarbonetos aromáticos, como benzeno, tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano (THF), nitrilas, como acetonitrila e propionitrila, cetonas, como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, álcoois, como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA) e N-metilpirrolidona (NMP) ou também em água; preferência particular é dada aos cloreto de metileno, THF, metanol, etanol e água.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

As bases apropriadas são, em geral, compostos inorgânicos, como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio, óxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como, óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidreto de lítio, hidreto de sódio, hidreto de potássio e hidreto de cálcio, carbonatos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, e também bicarbonatos de metal alcalino, como bicarbonato de sódio, além de bases orgânicas, por exemplo aminas terciárias, como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina, N-metilmorfolina, e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. Preferência particular é dada aos hidróxido de sódio, trietilamina, etildiisopropilamina, N-

metilmorfolina e piridina.

As bases são geralmente empregadas em quantidades catalíticas; no entanto, elas também podem ser empregadas em quantidades equimolares, em excesso ou, se apropriado, como solvente.

5 Os edutos são geralmente reagidos um com o outro em quantidades equimolares. Eles podem empregar com vantagem um excesso de II, com base em III.

Trabalho e isolamento dos produtos podem ser realizados em um modo conhecido por si.

10 A reação dos derivados de benzoíla da fórmula III onde $L^1 = C_1-C_6$ -alcóxi com aminas da fórmula II para dar as desejadas serina amidas substituídas com benzoíla da fórmula I é geralmente realizada em temperaturas de 0°C para o ponto de ebulição de uma mistura de reação, preferivelmente de 0°C a 100 °C, particularmente preferivelmente em
15 temperatura ambiente, em um solvente orgânico inerte, se apropriado na presença de uma base [confere C. Montalbetti et al., Tetrahedron 2005, 61, 10827 e literatura citada no mesmo].

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C_5-C_8 -alcanos, hidrocarbonetos
20 aromáticos, como benzeno, tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano (THF), nitrilas, como acetonitrila e propionitrila, cetonas, como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, álcoois,
25 como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA) e N-metilpirrolidona (NMP) ou também em água; preferência particular é dada aos cloreto de metileno, THF, metanol, etanol e água.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

A reação pode, se apropriado, ser realizada na presença de uma base. As bases apropriados são, em geral, compostos inorgânicos, como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio, óxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidreto de lítio, hidreto de sódio, hidreto de potássio e hidreto de cálcio, carbonatos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, e também bicarbonatos de metal alcalino, como bicarbonato de sódio, além de bases orgânicas, por exemplo aminas terciárias, como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina, N-metilmorfolina, e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. Preferência particular é dada aos hidróxido de sódio, trietilamina, etildiisopropilamina, N-metilmorfolina e piridina.

As bases são geralmente empregadas em quantidades catalíticas; no entanto, elas também podem ser empregadas em quantidades equimolares, em excesso ou, se apropriado, como solvente.

Os edutos são geralmente reagidos um com o outro em quantidades equimolares. Eles podem empregar com vantagem um excesso de II, com base em III.

Trabalho e isolamento dos produtos podem ser realizados em um modo conhecido por si.

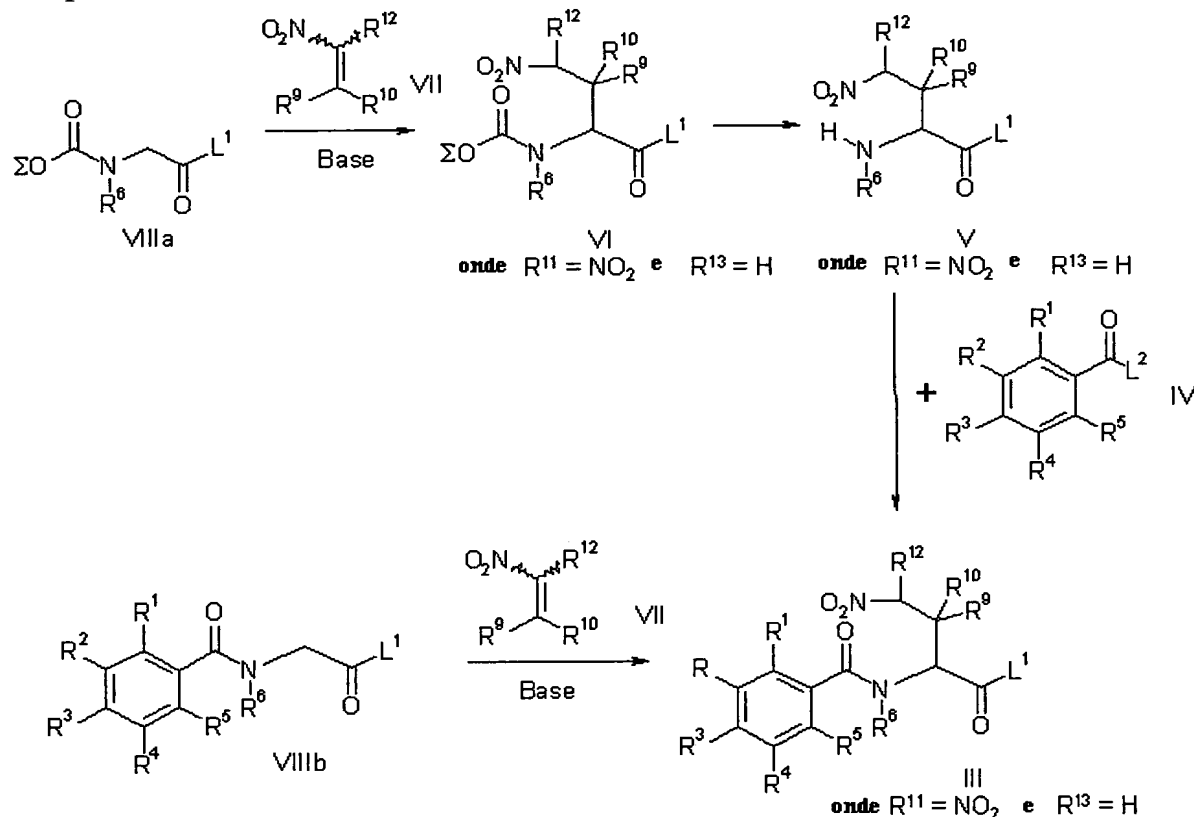
As aminas da fórmula II requeridas para preparar as alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I são comercialmente disponíveis.

Processo B

Derivados de benzoíla da fórmula III onde $R^{11} = NO_2$ e $R^{13} =$ hidrogênio também podem ser obtidos por condensação de derivados de glicina acilados da fórmula VIII onde um grupo acila pode ser um grupo de

proteção removível como benziloxycarbonila (confere VIIIa onde Σ = benzila) ou terc-butiloxycarbonila (confere VIIIa onde Σ = terc-butial) com nitroolefinas VII para dar os produtos de adição correspondentes VI onde $R^{11} = NO_2$ e $R^{13} =$ hidrogênio. O grupo de proteção é então removido, e o derivado de alanina da fórmula V formado deste modo, onde $R^{11} = NO_2$ e $R^{13} =$ hidrogênio é acilado com ácidos benzóicos/derivados de ácido benzóico da fórmula IV.

De modo análogo, é também possível reagir um derivado de glicina acilado da fórmula VIII onde um grupo acila é um radical benzoila substituído (confere VIIIb) na presença de uma base com uma nitroolefina VII para dar o derivado benzoila III onde $R^{11} = NO_2$ e $R^{13} =$ hidrogênio:



L^1 é um grupo de saída nucleofílicamente deslocável, por exemplo hidroxila ou C_1 - C_6 -alcóxi.

L^2 é um grupo de saída nucleofílicamente deslocável, por exemplo hidroxila, halogênio, C_1 - C_6 -alquilcarbonila, C_1 - C_6 -alcoxicarbonila, C_1 - C_4 -alquilsulfonila, fosforila ou isoureíla.

A reação dos derivados de glicina VIII com nitroolefinas VII para dar o produto de adição correspondente VI onde $R^{11} = \text{NO}_2$ e $R^{13} =$ hidrogênio ou derivado de benzoila III onde $R^{11} = \text{NO}_2$ e $R^{13} =$ hidrogênio é geralmente realizada em temperaturas de -100°C para o ponto de ebulição de uma mistura de reação, preferivelmente de -80°C a 20°C , especialmente preferivelmente de -80°C to -20°C , em um solvente orgânico inerte na presença de uma base (confere B. Mendler et al., *Organic Lett.* 2005, 7 (9), 1715; D. Dixon et al., *Organic Lett.* 2004, 6 (24), 4427; M. Alcantara et al., *Synthesis* 1996, (1), 64; M. Rowley et al., *Tetrahedron* 1992, 48 (17), 3557).

Apropriados solventes são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C_5 - C_8 -alcanos, hidrocarbonetos aromáticos, como tolueno, o-, m- e p-xileno, éteres, como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butil metílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida e dimetilacetamida, particularmente preferivelmente éter dietílico, dioxano e tetraidrofurano. Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

As bases apropriadas são, em geral, compostos inorgânicos, como hidretos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidreto de lítio, hidreto de sódio, hidreto de potássio e hidreto de cálcio, amidas de metal alcalino, como lítio isopropilamida e lítio hexametildisilazida, compostos organometálicos, em particular alquilas de metal alcalino, como metillítio, butillítio e fenillítio, e também alcóxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como metóxido de sódio, etóxido de sódio, etóxido de potássio, terc-butóxido e potássio, terc-pentóxido de potássio e dimetoximagnésio, além de bases orgânicas, por exemplo, aminas terciárias, como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. Preferência particular é dada aos hidreto de sódio, lítio hexametildisilazida e lítio diisopropilamida.

As bases são geralmente empregadas em quantidades equimolares; no entanto, elas também podem ser empregadas em quantidades catalíticas, em excesso ou, se apropriado, como solvente.

Os edutos são geralmente reagidos um com o outro em quantidades equimolares. Eles podem empregar com vantagem um excesso da base e/ou dos compostos imino VII, com base em derivados de glicina VIII.

Trabalho e isolamento dos produtos podem ser realizados em um modo conhecido por si.

Os derivados de glicina da fórmula VIII requeridos para preparar os derivados de benzoíla III onde $R^{11} = \text{NO}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ são comercialmente disponíveis, conhecidos da literatura [por exemplo H. Pessoa-Mahana et al., Synth. Comm. 32, 1437 (2002)] ou podem ser preparados de acordo com literatura citada.

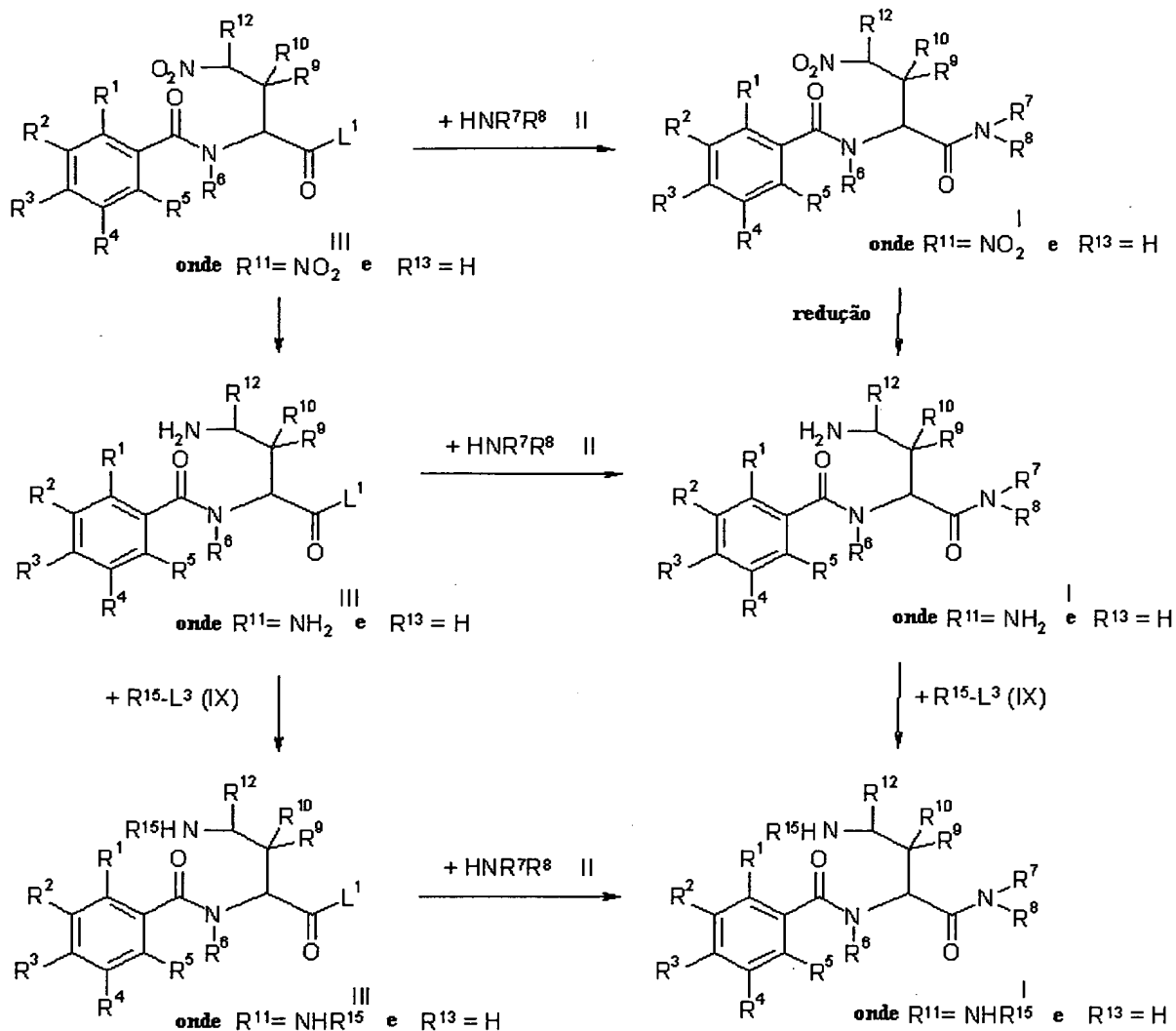
A remoção do grupo de proteção Σ para dar derivados de alanina da fórmula V onde $R^{11} = \text{NO}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ é realizada por métodos conhecidos da literatura [confere J.-F. Rousseau et al., J. Org. Chem. 63, 2731-2737 (1998)]; J. M. Andres, Tetrahedron 56, 1523 (2000)]; no caso de $\Sigma = \text{benzila}$ por hidrogenólise, preferivelmente usando hidrogênio e Pd/C em metanol; no caso de $\Sigma = \text{terc-butil}$ usando ácido, preferivelmente usando ácido clorídrico em dioxano.

A reação dos derivados de alanina V onde $R^{11} = \text{NO}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ com ácidos benzóicos/derivados de ácido benzóico IV para dar derivados de benzoíla III onde $R^{11} = \text{NO}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ é geralmente realizada de modo análogo a uma reação, mencionada sob processo A, dos derivados de alanina da fórmula V com ácidos benzóicos/derivados de ácido benzóico da fórmula IV para dar derivados de benzoíla III.

Os derivados de benzoila, obteníveis deste modo, da fórmula III onde $R^{11} = \text{NO}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ podem ser reagidos com aminas da fórmula II de modo análogo ao processo A para dar as desejadas alaninas

substituídas por benzoíla da fórmula I onde $R^{11} = \text{NO}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$, que podem então, se desejado, ser reduzidos inicialmente para dar alaninas substituídas por benzoíla, da fórmula I onde $R^{11} = \text{NH}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$. As alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde $R^{11} = \text{NH}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ obtidas deste modo então podem ser derivatizadas com compostos IX para dar alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde $R^{11} = \text{NHR}^{15}$ [cf., por exemplo, Yokokawa, F. et al., *Tetrahedron Lett.* 42 (34), 5903-5908 (2001); Arrault, A. et al., *Tetrahedron Lett.* 43(22), 4041-4044 (2002)].

Também é possível inicialmente reduzir os derivados de benzoíla da fórmula III onde $R^{11} = \text{NO}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ para dar outros derivados de benzoíla da fórmula III onde $R^{11} = \text{NH}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ e então, se desejado, derivatizar com compostos IX para dar derivados de benzoíla da fórmula III onde $R^{11} = \text{NHR}^{15}$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ [cf., por exemplo, Jung-Hui Sun et al., *Heterocycles* (2004), 63(7), 585-1599; Christian Lherbet et al., *Bioorg. e Med. Chem. Lett.* (2003), 13(6), 997-1000; Masami Otsuka et al., *Chem. e Pharm. Bull.* (1985), 33(2), 509-514; J. R Piper et al., *J. of Med. Chem.* (1985), 28(8), 1016-1025]. Os derivados de benzoíla da fórmula III onde $R^{11} = \text{NHR}^{15}$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ obtidos deste modo então podem ser reagidos de modo análogo ao processo A com aminas da fórmula II para dar as desejadas alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde $R^{11} = \text{NHR}^{15}$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$:



L^1 é um grupo de saída nucleofilicamente deslocável, por exemplo hidroxila ou $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alcóxi.

L^3 é um grupo de saída nucleofilicamente deslocável, por exemplo halogênio, hidroxila ou $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alcóxi.

- 5 A reação dos derivados de benzoíla da fórmula III onde $R^{11} = \text{NO}_2$, NH_2 ou NHR^{15} e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ com aminas da fórmula II para dar alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde $R^{11} = \text{NO}_2$, NH_2 ou NHR^{15} , e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ geralmente ocorre de modo análogo a uma reação, descrita sob processo A, dos derivados de benzoíla da fórmula III com aminas
- 10 da fórmula II.

A redução dos derivados de benzoíla da fórmula III onde $R^{11} = \text{NO}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ para dar derivados de benzoíla da fórmula III onde

$R^{11} = \text{NH}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$, e a redução das alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde $R^{11} = \text{NO}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ para dar alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde $R^{11} = \text{NH}_2$ e $R^{13} = \text{hidrogênio}$ é geralmente realizada a uma temperatura de 0°C a 100°C , preferivelmente de
 5 10°C to 50°C , em um solvente orgânico inerte na presença de um agente redutor.

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C_5 - C_8 -alcanos, hidrocarbonetos aromáticos, como tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados,
 10 como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano, nitrilas, como acetonitrila e propionitrila, cetonas, como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, álcoois, como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também
 15 sulfóxido de dimetila, dimetilformamida e dimetilacetamida, particularmente preferivelmente diclorometano, éter terc-butil metílico, dioxano e tetraidrofurano. Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Os agentes redutores apropriados são catalisadores de metal de transição (por exemplo Pd/C ou Raney-Ni) em combinação com hidrogênio.

20 Trabalho e isolamento dos produtos podem ser realizados em um modo conhecido por si.

A redução dos derivados nitro da fórmula II ou I onde $R^{11} = \text{NO}_2$ é geralmente realizada na temperatura de -100°C para o ponto de ebulição de uma mistura de reação, preferivelmente de 0°C a 100°C , em um
 25 solvente orgânico inerte usando um agente redutor (confere V. Burgess et al., Aust. J. of Chem. (1988), 41(7), 1063-1070).

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C_5 - C_8 -alcanos, hidrocarbonetos aromáticos, como tolueno, o-, m- e p-xileno, éteres, como éter dietílico, éter

diisopropílico, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano (THF), nitrilas, como acetonitrila e propionitrila, cetonas, como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, álcoois, como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida e dimetilacetamida, particularmente preferivelmente tolueno, THF ou éter terc-butil metílico.

Os agentes redutores apropriados são catalisadores de metal de transição (por exemplo Pd/C ou Raney-Ni) em combinação com hidrogênio.

Trabalho e isolamento dos produtos podem ser realizados em um modo conhecido por si.

A reação dos derivados de benzoíla da fórmula III onde $R^{11} = NH_2$ e $R^{13} =$ hidrogênio ou das alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde $R^{11} = NH_2$ e $R^{13} =$ hidrogênio com compostos da fórmula IX para dar derivados de benzoíla da fórmula III onde $R^{11} = NH_2$ e $R^{13} =$ hidrogênio ou alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde $R^{11} = NH_2$ e $R^{13} =$ hidrogênio é geralmente realizada em temperaturas de 0°C a 100 °C, preferivelmente de 10°C a 50°C, em um solvente orgânico inerte na presença de uma base [confere, por exemplo, Jung-Hui Sun et al., *Heterocycles* (2004), 63(7), 585-1599; Christian Lherbet et al., *Bioorg. e Med. Chem. Lett.* (2003), 13(6), 997-1000; Masami Otsuka et al., *Chem. e Pharm. Bull.* (1985), 33(2), 509-514; J. R Piper et al., *J. of Med. Chem.* (1985), 28(8), 1016-1025].

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C₅-C₈-alcanos, hidrocarbonetos aromáticos, como tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano, nitrilas, como acetonitrila e propionitrila, cetonas, como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, álcoois, como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também

sulfóxido de dimetila, dimetilformamida e dimetilacetamida, particularmente preferivelmente diclorometano, éter terc-butil metílico, dioxano e tetraidrofurano. Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

As bases apropriadas são, em geral, compostos inorgânicos, como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio, óxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidreto de lítio, hidreto de sódio, hidreto de potássio e hidreto de cálcio, amidas de metal alcalino, como lítio amida, sódio amida e potássio amida, carbonatos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio e também bicarbonatos de metal alcalino, como bicarbonato de sódio, compostos organometálicos, em particular alquilas de metal alcalino, como metillítio, butillítio e fenillítio, halogenetos de alquilmagnésio, como cloreto de metilmagnésio, e também alcóxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como metóxido de sódio, etóxido de sódio, etóxido de potássio, terc-butóxido de potássio, terc-pentóxido de potássio e dimetoximagnésio, além de bases orgânicas, por exemplo, aminas terciárias, como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. Preferência particular é dada aos hidróxido de sódio, hidreto de sódio e trietilamina.

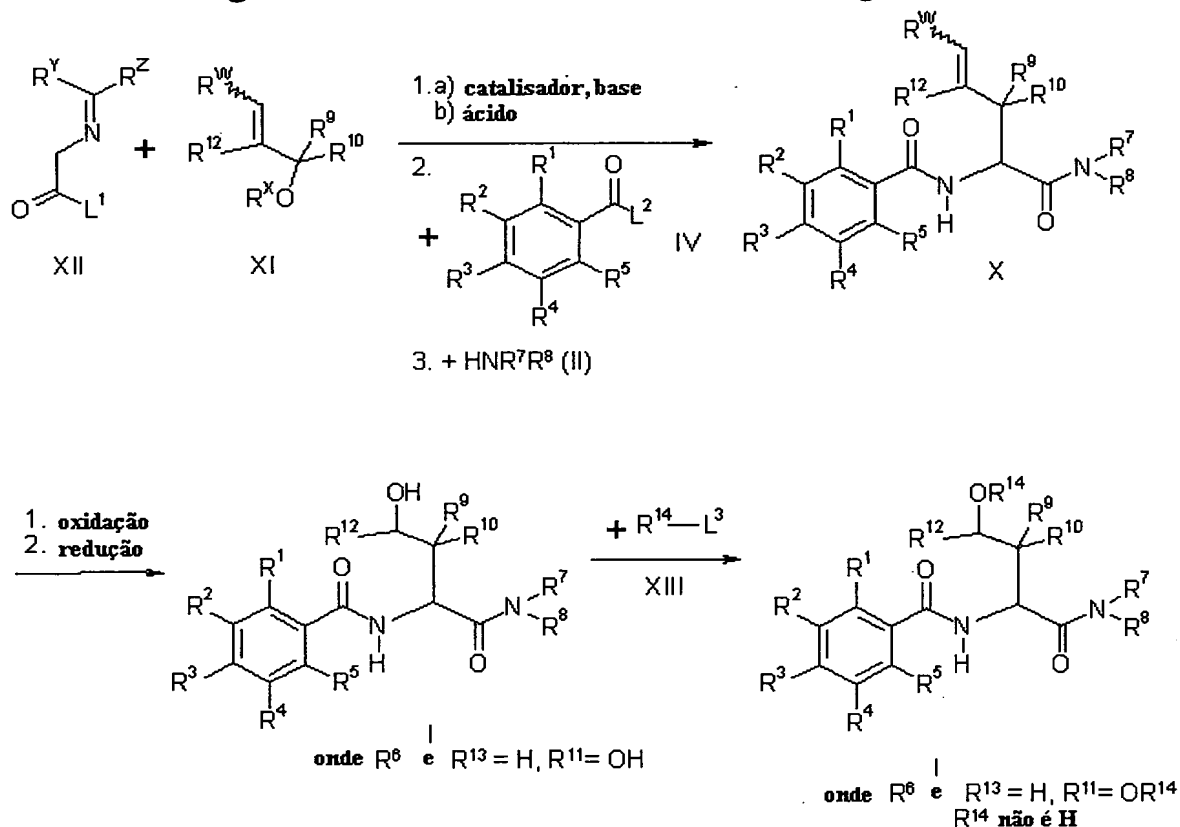
As bases são geralmente empregadas em quantidades equimolares; no entanto, elas também podem ser empregadas em quantidades catalíticas, em excesso ou, se apropriado, como solvente.

Os edutos são geralmente reagidos um com o outro em quantidades equimolares. Eles podem empregar com vantagem um excesso de base e/ou IX, com base em III ou I.

Trabalho e isolamento dos produtos podem ser realizados em um modo conhecido por si.

Processo C

- Alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde R^6 e R^{13} = hidrogênio e R^{11} = OH podem ser obtidas por conversão, em uma primeira etapa, de derivados de glicina da fórmula XII com um derivado de álcool alílico da fórmula XI na presença de um catalisador de metal de transição e uma base, e trabalho aquoso-ácido subsequente em derivados amino que podem então, em uma segunda e terceira etapas, ser acilados de modo análogo ao processo A e convertidos em uma amida X. A ligação dupla da amida X pode ser então clivada oxidativamente, e o aldeído resultante pode ser reduzido em alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde R^6 e R^{13} e R^{11} = OH. As alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde R^6 e R^{13} = hidrogênio e R^{11} = OH obtidas deste modo podem ser, por exemplo, derivatizadas em outras alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde R^6 e R^{13} = hidrogênio e R^{11} = OR^{14} , onde R^{14} não é hidrogênio:



L^1 é um grupo de saída nucleofilicamente deslocável, por exemplo hidroxila ou C_1 - C_6 -alcóxi.

L^2 é um grupo de saída nucleofilicamente deslocável, por exemplo hidroxila, halogênio, C_1 - C_6 -alquilcarbonila, C_1 - C_6 -alcoxicarbonila,
5 C_1 - C_4 -alquilsulfonila, fosforila ou isoureíla.

L^3 é um grupo de saída nucleofilicamente deslocável, por exemplo halogênio, hidroxila ou C_1 - C_6 -alcóxi.

R^Y e R^Z são hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila ou aril.

R^W é hidrogênio ou R^5 .

10 R^X é um grupo acila, como C_1 - C_6 -alquilcarbonila (por exemplo metilcarbonila) ou C_1 - C_6 -alcoxicarbonila (por exemplo metoxicarbonila).

A reação dos derivados de glicina da fórmula XII com um derivado de álcool alílico da fórmula XI é geralmente realizada em temperaturas de -100°C para o ponto de ebulição de uma mistura de reação,
15 preferivelmente de -80°C a 80°C , especialmente preferivelmente de -20°C a 50°C , em um solvente orgânico inerte na presença de um catalisador de metal de transição e uma base, seguido por trabalho aquoso-ácido.

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C_5 - C_8 -alcanos, hidrocarbonetos
20 aromáticos, como tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano, nitrilas, como acetonitrila e propionitrila, cetonas, como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, álcoois, como
25 metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida e dimetilacetamida; preferência particular é dada aos tolueno, THF e acetonitrila.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

São preferidos para uso como catalisadores são catalisadores

de paládio, irídio ou molibdênio, preferivelmente na presença de um ligando de fosfina, como trifenilfosfina na presença de um ligando de fosfina quiral, uma reação também pode ser realizada em um modo enantiosseletivo (confere D. Ikeda et al., *Tetrahedron Lett.* 2005, 46(39), 6663; T.Kanayama et al., *J. of Org. Chem.* 2003, 68(16), 6197; I. Baldwin et al., *Tetrahedron Asym.* 1995, 6(7), 1515; J. Genet et al., *Tetrahedron* 1988, 44(17), 5263).

As bases apropriadas são, em geral, compostos inorgânicos, como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio, óxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidreto de lítio, hidreto de sódio, hidreto de potássio e hidreto de cálcio, carbonatos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio e também bicarbonatos de metal alcalino, como bicarbonato de sódio, metal alcalino e metal alcalino-terroso alcóxidos, como metóxido de sódio, etóxido de sódio, etóxido de potássio, terc-butóxido de potássio, terc-pentóxido de potássio e dimetoximagnésio, além de bases orgânicas, por exemplo, aminas terciárias, como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. Preferência particular é dada aos carbonatos, como Na_2CO_3 .

As bases são geralmente empregadas em quantidades equimolares; no entanto, elas também podem ser empregadas em excesso ou, se apropriado, como solvente.

As etapas subsequentes 2 e 3 podem ser realizadas de modo análogo a uma reação, descrita sob o processo A, de derivados de alanina da fórmula V com ácidos benzóicos/derivados de ácido benzóico da fórmula IV para dar derivados de benzoíla correspondentes da fórmula III e reação

subsequente de um produto de reação com aminas da fórmula II para dar as alaninas substituídas por benzoíla desejadas da fórmula I.

Os edutos são geralmente reagidos um com o outro em quantidades equimolares. Eles podem empregar com vantagem um excesso de base e/ou IX, com base em III ou I.

Trabalho e isolamento dos produtos podem ser realizados em um modo conhecido por si.

Os derivados de glicina da fórmula XII requeridos podem ser obtidos de modo análogo a métodos conhecidos da literatura (confere Vicky A. Burgess et al., Aust. J. of Chem. (1988), 41(7), 1063-1070).

Os derivados de álcool alílico requeridos da fórmula XI são comercialmente disponíveis.

A oxidação da dupla ligação para o aldeído é geralmente realizada em temperaturas de -100°C para o ponto de ebulição de uma mistura de reação, preferivelmente de -80°C a 40°C , especialmente preferivelmente de -80°C to 0°C , em um solvente orgânico inerte na presença de um agente oxidante.

Preferivelmente, a oxidação é realizada usando ozônio ou por dihidroxilação sequencial com catalisadores de ósmio, como OsO_4 ou permanganatos como KMnO_4 e clivagem subsequente do diol, que é preferivelmente realizada usando NaIO_4 (confere A. Siebum et al., J. Europ. J. of Org. Chem. 2004, (13), 2905; S. Hanessian et al., J. of Med. Chem. (2001), 44(19), 3074; J. Sabol et al., Tetrahedron Lett. 1997, 38(21), 3687; D. Hallett et al., J. of Chem. Soc., Chem. Comm. 1995, (6), 657).

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C_5 - C_8 -alcanos, hidrocarbonetos aromáticos, como tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol e

tetraidrofurano (THF), nitrilas, como acetonitrila e propionitrila, cetonas, como acetona, metil etil cetona, dietil cetona e terc-butil metil cetona, álcoois, como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida e dimetilacetamida; preferência particular é dada aos tolueno, THF e acetona.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Trabalho e isolamento do produto podem ser realizados em um modo conhecido por si.

A redução subsequente em alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde R^6 e R^{13} = hidrogênio e R^{11} = OH é geralmente realizada em temperaturas de -100°C para o ponto de ebulição de uma mistura de reação, preferivelmente de -80°C a 40°C , especialmente preferivelmente de -80°C a 20°C , em um solvente orgânico inerte na presença de um agente redutor.

Os agentes redutores preferidos são borohidretos como NaBH_4 (confere A. Siebum et al., J. Europ. J. of Org. Chem. 2004, (13), 2905; S. Hanessian et al., J. of Med. Chem. (2001), 44(19), 3074; J. Sabol et al., Tetrahedron Lett. 1997, 38(21), 3687; D. Hallett et al., J. of Chem. Soc., Chem. Comm. 1995, (6), 657).

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C_5 - C_8 -alcanos, hidrocarbonetos aromáticos, como tolueno, o-, m- e p-xileno, éteres, como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol e tetraidrofurano (THF), álcoois, como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também dimetilformamida e dimetilacetamida; preferência particular é dada aos tolueno, THF e dioxano.

Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Trabalho e isolamento do produto podem ser realizados em um modo conhecido por si.

A derivatização das alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde R^6 e R^{13} e $R^{11} = OH$ com compostos da fórmula XIII para dar alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I onde R^6 e R^{13} e $R^{11} = OR^{14}$, onde R^{14} não é hidrogênio, é geralmente realizada em temperaturas de 0°C a 100 °C, preferivelmente de 10°C a 50°C, em um solvente orgânico inerte na presença de uma base [cf., por exemplo, Jung-Hui Sun et al., *Heterocycles* (2004), 63(7), 585-1599; Christian Lherbet et al., *Bioorg. e Med. Chem. Lett.* (2003), 13(6), 997-1000; Masami Otsuka et al., *Chem. e Pharm. Bull.* (1985), 33(2), 509-514; J. R Piper et al., *J. of Med. Chem.* (1985), 28(8), 1016-1025].

Os solventes apropriados são hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano e misturas de C_5 - C_8 -alcanos, hidrocarbonetos aromáticos, como tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, como cloreto de metileno, clorofórmio e clorobenzeno, éteres, como éter dietílico, éter diisopropílico, éter de terc-butiletila, dioxano, anisol e tetraidrofurano, nitrilas, como acetonitrila e propionitrila, e também sulfóxido de dimetila, dimetilformamida e dimetilacetamida, particularmente preferivelmente diclorometano, éter terc-butil metílico, dioxano e tetraidrofurano. Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

As bases apropriadas são, em geral, compostos inorgânicos, como hidróxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio, óxidos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como hidreto de lítio, hidreto de sódio, hidreto de potássio e hidreto de cálcio, carbonatos de metal alcalino e metal alcalino-terroso, como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio e também bicarbonatos de metal alcalino, como bicarbonato de sódio, compostos organometálicos, em particular alquilas de metal alcalino, como metillítio, butillítio e fenil lítio, halogenetos de alquilmagnésio, como cloreto

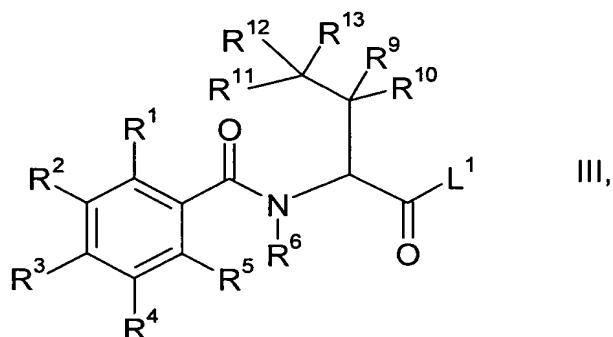
de metilmagnésio, e também bases orgânicas, por exemplo, aminas terciárias, como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina e N-metilpiperidina, piridina, piridinas substituídas, como colidina, lutidina e 4-dimetilaminopiridina, e também aminas bicíclicas. Preferência particular é dada aos carbonato de sódio, hidreto de sódio e trietilamina.

As bases são geralmente empregadas em quantidades equimolares; no entanto, elas também podem ser empregadas em quantidades catalíticas, em excesso ou, se apropriado, como solvente.

Os edutos são geralmente reagidos um com o outro em quantidades equimolares. Eles podem empregar com vantagem um excesso de base e/ou XIII, com base em I.

Trabalho e isolamento dos produtos podem ser realizados em um modo conhecido por si.

Derivados de benzoíla da fórmula III



onde R¹ a R⁶ e R⁹ a R¹³ são como definido acima e L¹ é um grupo de saída nucleofilicamente deslocável, por exemplo hidroxila ou C₁-C₆-alcóxi, são também providos pela presente invenção.

As formas de realização particularmente preferidas dos intermediários com relação às variáveis correspondem às dos radicais R¹ a R⁶ e R⁹ a R¹³ de fórmula I.

Preferência particular é dada aos derivados de benzoíla da fórmula III em que

R¹ é flúor, cloro ou CF₃;

R² e R³, independentemente um do outro, são hidrogênio, flúor

ou cloro;

R^4 , R^5 e R^6 são hidrogênio;

R^9 é hidrogênio;

R^{10} é C_2 - C_6 -alquenila, C_1 - C_6 -haloalquila, heterociclila de 3 a 6 membros, C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_6 -alcoxi- C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquila, aminocarbonila, C_1 - C_6 -alquilcarbonilamino- C_1 - C_4 -alquila, formilamino- C_1 - C_4 -alquila, fenila ou heteroarila, onde a heterociclila de 3 a 6 membros e os radicais fenila e heteroarila acima mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três radicais C_1 - C_6 -alquila;

R^{12} e R^{13} são hidrogênio;

R^{14} e R^{15} são hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, formila, C_1 - C_6 -alquilcarbonila, C_1 - C_6 -haloalquilcarbonila, C_1 - C_6 -alcoxycarbonila, aminocarbonila, $(C_1$ - C_6 -alquil)aminocarbonila, $di(C_1$ - C_6 -alquil)aminocarbonila, N -(C_1 - C_6 -alcoxi)- N -(C_1 - C_6 -alquil)aminocarbonila, $[(C_1$ - C_6 -alquil)aminocarbonil(C_1 - C_6 -alquil)amino]carbonila ou $di(C_1$ - C_6 -alquil)aminotiocarbonila ou SO_2R^{17} ; e

R^{16} é hidrogênio.

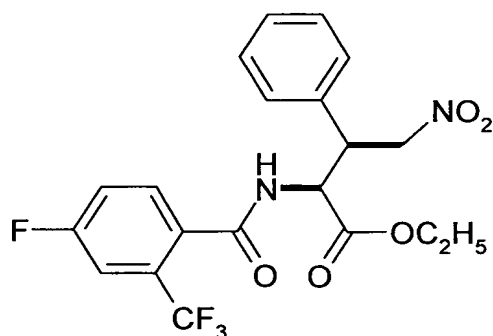
Os seguintes exemplos servem para ilustrar a invenção.

Exemplos de preparação

Exemplo 1

4-Fluoro-N-(1-metilcarbamoil-3-nitro-2-fenilpropil)-2-trifluorometilbenzamida (Tabela 5, No. 5.1)

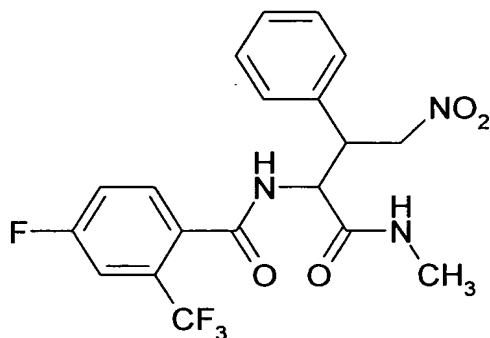
1.1) (2RS,3RS)-2-(4-fluoro-2-trifluorometilbenzoilamino)-4-nitro-3-fenilbutirato de etila (Tabela 2, No. 2.1)



3,3 g (15,9 mmol) de ácido 4-fluoro-2-trifluorometilbenzóico e 3,3 g (15,9 mmol) of N,N-diciclo-hexilcarbodiimida (DCC) foram adicionados a uma solução de 4,0 g (15,9 mmol) de (2RS,3RS)-2-amino-4-nitro-3-fenilbutirato de etila (preparado de acordo com M. Rowley et al., *Tetrahedron* **1992**, 48, 3557-3570) em acetonitrila (50 ml), e a mistura foi agitada em temperatura ambiente durante 16 h. H₂O e acetato de etila foram adicionados a mistura de reação, o precipitado foi filtrado com sucção e a fase orgânica foi lavada com 2 N HCl e solução saturada de NaHCO₃, secada e concentrada. O produto bruto foi cromatografado em sílica gel (ciclo-hexano/acetato de etila 4:1). Isto deu 4,6 g (66% de teoria) do composto titular em forma isomericamente pura.

¹H-NMR (CDCl₃): δ = 1,05 (t, 3H), 4,05 (m, 3H), 4,95 (m, 2H), 5,10 (t, 1H), 6,45 (d, 1H), 7,20-7,35 (m, 6H), 7,45 (dd, 1H), 7,55 (t, 1H).

1.2) 4-Fluoro-N-(1-metilcarbamoil-3-nitro-2-fenilpropil)-2-trifluorometilbenzamida (Tabela 5, No. 5.1)



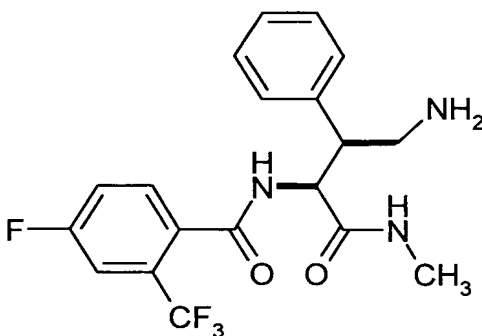
A 0°C, metilamina foi introduzida em uma solução de 5,2 g (11,8 mmol) de (2RS,3RS)-2-(4-fluoro-2-trifluorometilbenzoilamino)-4-nitro-3-fenilbutirato de etila em metanol (100 ml) até a concentração de saturação

ser alcançada. A mistura de reação resultante foi agitada em temperatura ambiente durante mais 16 horas. A remoção do solvente deu 5,2 g (100% de teoria) do composto titular (relação de diastereômeros 3:2) como um sólido branco de p.f. 223°C.

- 5 $^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) para o isômero principal: $\delta = 2,40$ (d, 3H), 3,95 (m, 1H), 4,75 (t, 1H), 4,95 (m, 1H), 5,10 (dd, 1H), 7,25-7,35 (m, 5H), 7,65 (m, 2H), 7,70 (dd, 1H), 7,95 (m, 1H), 9,05 (d, 1H).

Exemplo 2

- 10 N-((1RS,2RS)-3-Amino-1-metilcarbamoil-2-fenilpropil)-4-fluoro-2-trifluorometilbenzamida (Tabela 4, No. 4.1)

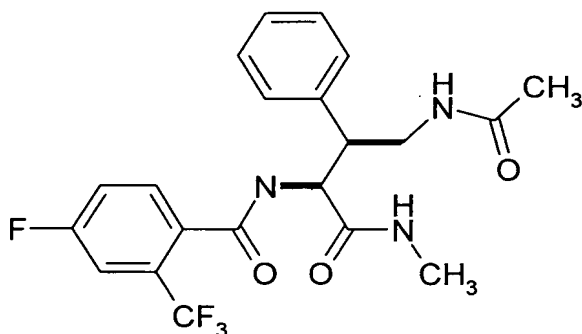


- 15 5,0 g (11,7 mmol) de 4-fluoro-N-(1-metilcarbamoil-3-nitro-2-fenilpropil)-2-trifluorometilbenzamida e 1,1 g de níquel de Raney foram inicialmente carregados em metanol (60 ml). A mistura foi então agitada sob uma atmosfera de hidrogênio (pressão levemente superatmosférica) durante 16 h, varrida com argônio e filtrada, e o solvente foi removido sob pressão reduzida. O resíduo foi cromatografado em sílica gel (acetato de etila/metanol 10:1 - 1:1). Isto deu 2,20 g (47% de teoria) do composto titular (mistura diastereômeros, treó/eritro >5:1) como um sólido branco de p.f. 188°C.

- 20 $^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) para o isômero treó: $\delta = 2,35$ (d, 3H), 2,95 (m, 2H), 3,05 (m, 1H), 4,70 (d, 1H), 7,20-7,35 (m, 6H), 7,55 (m, 1H), 7,60 (m, 1H), 7,70 (dd, 1H), 7,75 (m, 1H).

Exemplo 3

N-((1RS,2RS)-3-Acetilamino-1-metilcarbamoil-2-fenilpropil)-4-fluoro-2-trifluorometilbenzamida (Tabela 4, No. 4.16)



0,049 g (0,63 mmol) de cloreto de acetila foi adicionado a uma
solução de 0,25 g (0,63 mmol) de N-((1RS,2RS)-3-amino-1-metilcarbamoyl-
2-fenilpropil)-4-fluoro-2-trifluorometilbenzamida e 0,07 g (0,69 mmol) de
5 trietilamina em diclorometano(10 ml), e a reação mistura foi agitada em
temperatura ambiente durante 3 h. A mistura foi lavada com H₂O, secada
sobre Na₂SO₄ e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi
cromatografado em sílica gel (ciclo-hexano/acetato de etila 2:3 – acetato de
etila/metanol 10:1). Isto deu 0,22 g (80% de teoria) do composto titular em
10 forma diastereomericamente pura como um sólido branco de p.e. 199°C.

¹H-NMR (d₆-DMSO): δ = 1,65 (d, 3H), 2,40 (d, 3H), 3,35 (m, 2H), 3,45 (m,
1H), 4,70 (dd, 1H), 7,25 (m, 5H), 7,60 (m, 3H), 7,70 (d, 1H), 7,85 (m, 1H),
8,85 (d, 1H).

Além dos compostos acima, Tabelas 2 a 5 abaixo relacionam
15 outros derivados de benzoíla da fórmula III e também alaninas substituídas
por benzoíla da fórmula I que foram preparados ou são preparáveis em um
modo análogo aos processos descritos acima.

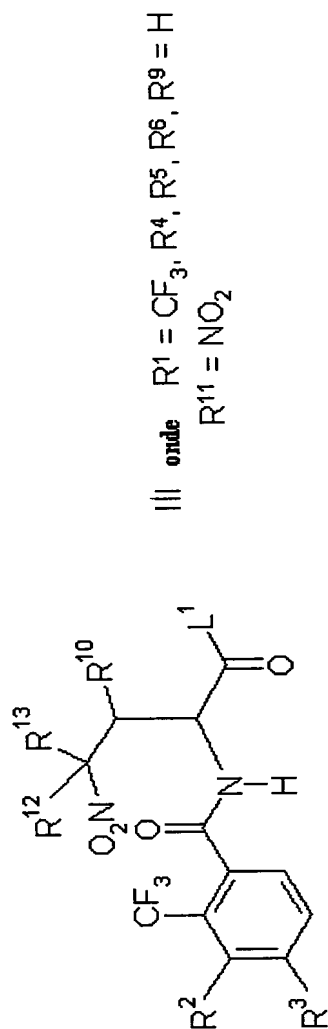


Tabela 2

No.	R ²	R ³	R ¹⁰	R ¹²	R ¹³	L ¹	Relação diastereométrica	Quiralidade	P.f. [°C]	M ⁺ +H (m/z)
2.1.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	OC ₂ H ₅	1:0	rac		443
2.2.	H	F	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₅	H	H	OC ₂ H ₅	1:0	rac		475
2.3.	H	F	3-F-C ₆ H ₅	H	H	OC ₂ H ₅	1:0	rac		461

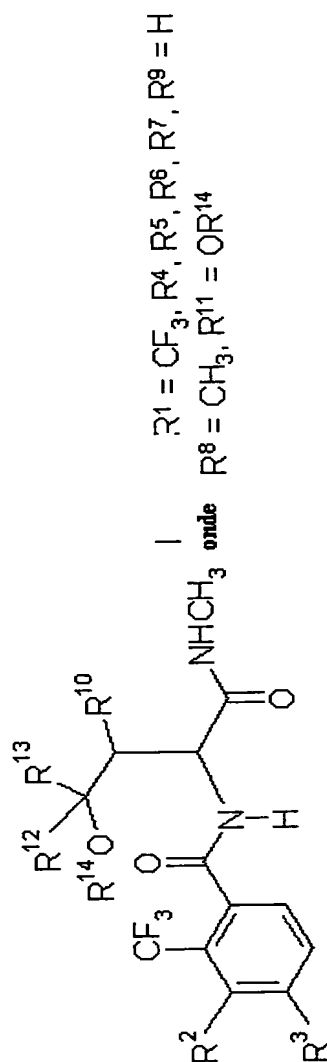


Tabela 3

No.	R ²	R ³	R ¹⁰	R ¹²	R ¹³	R ¹⁴	Relação diastereomérica	Quirali- dade	p.f. [°C]	M ⁺ +H (m/z)
3.1.	H	F	H	CH ₃	H	H	-	rac.	149	
3.2.	H	F	H	CH ₃	H	(CO)N(CH ₃) ₂	-	rac.	140	
3.3.	H	F	H	CH ₃	H	(CO)CH ₃	-	rac.	157	
3.4.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	H	1:1:1:1	rac.		413
3.5.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	(CO)N(CH ₃) ₂	1:1:1:1	rac.		484
3.6.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	(CO)CH ₃	1:1:1:1	rac.		455
3.7.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	(CO)CH ₂ CH ₂ CH ₂ (CO)OCH ₃	1:1:1:1	rac.		555
3.8.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	(CO)CH ₂ CH ₂ CH ₂ (CO)OCH ₃	1:1:1:1	rac.		541
3.9.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	(CO)CH ₂ CH ₂ (CO)OCH ₃	1:1:1:1	rac.		527
3.10.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	(CO)CH ₂ (CO)OCH ₃	1:1:1:1	rac.		513
3.11.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)C(CH ₃) ₃	1:1:1:1	rac.		497
3.12.	H	F	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	H	1:0:0:0	rac.	217	
3.13.	H	F	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	(CO)NHCH ₃	1:1:1:1	rac.		484
3.14.	H	F	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	(CO)N(CH ₃) ₂	1:0:0:0	rac.		498
3.15.	H	F	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	(CO)CH ₃	1:0:0:0	rac.		469
3.16.	H	F	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	H	(CO)C(CH ₃) ₃	1:0:0:0	rac.		511

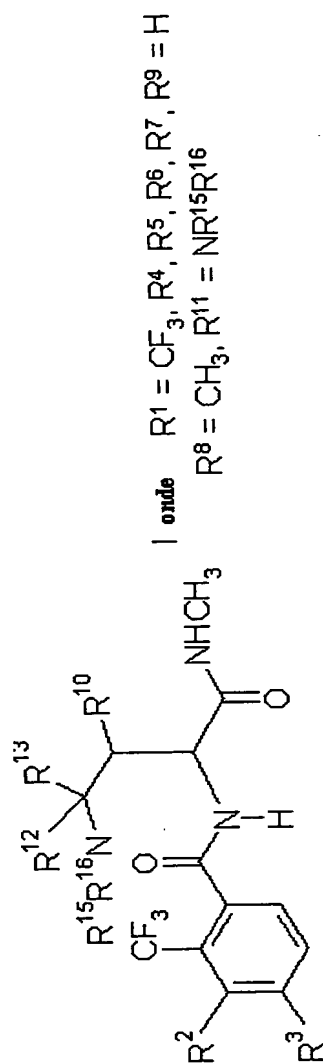


Tabela 4

No.	R ²	R ³	R ¹⁰	R ¹²	R ¹³	R ¹⁵	R ¹⁶	Relação diastereomérica	Quirali- dade	p.f. [°C]
4.1.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	H	H	> 5:1	rac.	188
4.2.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	H	9:1	rac.	118
4.3.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₂ C ₆ H ₅	1:0	rac.	188
4.4.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(SO ₂)CH ₃	H	5:1	rac.	180
4.5.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(SO ₂)CH ₂ Cl	H	1:0	rac.	225
4.6.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(SO ₂)CH ₂ CH ₃	H	1:0	rac.	243
4.7.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(SO ₂)CF ₃	H	5:1	rac.	234
4.8.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CS)NHCH ₃	H	1:0	rac.	191
4.9.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)OCH ₃	H	1:0	rac.	171
4.10.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)NHCH ₃	H	1:0	rac.	231
4.11.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)NH(SO ₂)(4-CH ₃ - C ₆ H ₄)	H	9:1	rac.	250
4.12.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)N(CH ₃) ₂	H	1:0	rac.	91
4.13.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)N(CH ₃) ₂	H	1:1	rac.	112
4.14.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)H	H	1:0	rac.	223

No.	R ²	R ³	R ¹⁰	R ¹²	R ¹³	R ¹⁵	R ¹⁶	Relação diastereomérica	Quirali- dade	p.f. [°C]
4.15.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CHF ₂	H	1:0	rac.	191
4.16.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₃	H	1:0	rac.	199
4.17.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₂ F	H	1:0	rac.	178
4.18.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₂ Cl	H	1:0	rac.	198
4.19.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₂ (CO)OH	H	1:0	rac.	116
4.20.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CH ₂ (CO)OCH ₃	H	1:0	rac.	171
4.21.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CF ₃	H	1:0	rac.	202
4.22.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)CCl ₃	H	1:0	rac.	169
4.23.	H	F	C ₆ H ₅	H	H	(CO)C(CH ₃) ₃	H	1:0	rac.	169
4.24.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	H	H	1:0:0:0	rac.	205
4.25.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	H	H	0:1:0:0	rac.	82
4.26.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	(SO ₂)CH ₃	H	1:0:0:0	rac.	205
4.27.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	(CO)N(CH ₃) ₂	H	1:0:0:0	rac.	100
4.28.	H	F	C ₆ H ₅	CH ₃	H	(CO)CH ₃	H	1:0:0:0	rac.	207
4.29.	H	F	3-F-C ₆ H ₄	H	H	(CO)CH ₃	H	0:1	rac.	257
4.30.	H	F	3-F-C ₆ H ₄	H	H	(CO)CH ₃	H	9:1	rac.	203
4.31.	H	F	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	H	H	H	9:1	rac.	183
4.32.	H	F	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	H	(SO ₂)CH ₃	H	9:1	rac.	218
4.33.	H	F	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	H	(CO)N(CH ₃) ₂	H	9:1	rac.	118
4.34.	H	F	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	H	(CO)CH ₃	H	9:1	rac.	119
4.35.	H	F	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₃	H	H	(CO)N(CH ₃) ₂	H	5:1	rac.	93
4.36.	H	F	2-CH ₃ -3-F-C ₆ H ₃	H	H	(CO)CH ₃	H	5:1	rac.	212

Atividade biológica

As alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I e seus sais
 agriculturalmente utilizáveis são apropriadas tanto na forma de misturas de
 isômeros como na forma de isômeros puros, como herbicidas. As
 5 composições herbicidas compreendendo compostos da fórmula I controlam a
 vegetação em áreas de não colheita muito eficientemente, especialmente em
 altas taxas de aplicação. Elas atuam contra ervas daninhas de folhas largas e
 ervas daninhas gramíneas em colheitas como trigo, arroz, milho, soja,
 algodão, sem causar qualquer dano significativo para as plantas de colheita.
 10 Este efeito é principalmente observado em baixas taxas de aplicação.

Dependendo do método de aplicação em questão, os
 compostos da fórmula I, ou composições herbicidas compreendendo os
 mesmos, podem ser adicionalmente empregados em um outro número de
 plantas de colheita para eliminar as plantas indesejáveis. Exemplos de
 15 colheitas apropriadas são os seguintes:

Alium cepa, *Ananas comosus*, *Arachis hypogaea*, *Asparagus*
officinalis, *Beta vulgaris* spec. *altissima*, *Beta vulgaris* spec. *rapa*, *Brassica*
napus var. *napus*, *Brassica napus* var. *napobrassica*, *Brassica rapa* var.
silvestris, *Camellia sinensis*, *Carthamus tinctorius*, *Carya illinoensis*, *Citrus*
 20 *limon*, *Citrus sinensis*, *Coffea arabica* (*Coffea canefora*, *Coffea liberica*),
Cucumis sativus, *Cynodon dactylon*, *Daucus carota*, *Elaeis guineensis*,
Fragaria vesca, *Glicina max*, *Gossypium hirsutum*, (*Gossypium arboreum*,
Gossypium herbaceum, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus*, *Hevea*
brasiliensis, *Hordeum vulgare*, *Humulus lupulus*, *Ipomoea batatas*, *Juglans*
 25 *regia*, *Lens culinaris*, *Linum usitatissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*,
Malus spec., *Manihot esculenta*, *Medicago sativa*, *Musa spec.*, *Nicotiana*
tabacum (*N.rustica*), *Olea europaea*, *Oryza sativa*, *Phaseolus lunatus*,
Phaseolus vulgaris, *Picea abies*, *Pinus spec.*, *Pisum sativum*, *Prunus avium*,
Prunus persica, *Pirus communis*, *Ribes sylvestre*, *Ricinus communis*,

Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera e Zea mays.

5 Além disso, os compostos da fórmula I também podem ser usados em colheitas que toleram a ação dos herbicidas devido à criação, incluindo métodos de engenharia genética..

Além disso, os compostos da fórmula I também podem ser usados em colheitas que toleram o ataque por fungos ou insetos devido à criação, incluindo métodos de engenharia genética.

10 Os compostos da fórmula I, ou as composições herbicidas compreendendo os mesmos, podem ser usados por exemplo na forma de soluções aquosas prontas para pulverizar, pós, suspensões, e também suspensões aquosas, oleosas ou altamente concentradas, ou outras, ou outras dispersões, emulsões, dispersões de óleo, pastas, produtos polvilháveis, 15 materiais para difusão, ou grânulos, por meio de pulverização, atomização, polvilhamento, espalhamento ou aguada. As formas de uso dependem dos fins pretendidos: em cada caso, elas devem assegurar a mais fina distribuição possível dos compostos ativos de acordo com a invenção.

20 As composições herbicidas compreendem uma quantidade herbicidamente eficaz de pelo menos um composto da fórmula I ou um sal agriculturalmente utilizável de I, e auxiliares que são comuns para a formulação dos agentes de proteção de colheita.

Os apropriados como auxiliares inertes são essencialmente os seguintes:

25 Frações de óleo mineral de ponto de ebulição médio a alto, como querosene e óleo diesel, além disso óleos de alcatrão de carvão de origem vegetal ou animal, hidrocarbonetos alifáticos cíclicos e aromáticos, por exemplo parafinas, tetraidronaftaleno, naftalenos alquilados e seus derivados, benzenos alquilados e seus derivados, álcoois como metanol,

etanol, propanol, butanol e ciclo-hexanol, cetonas como ciclo-hexanona, solventes fortemente polares, por exemplo aminas como N-metilpirrolidona, e água.

5 As formas de uso aquosas podem ser preparados a partir de concentrados de emulsão, suspensões, pastas, pós umectáveis, ou grânulos dispersíveis em água, por adição de água. Para preparar emulsões, pastas ou dispersões de óleo, os substratos, ou como tal ou dissolvidos em um óleo ou solvente, podem ser homogeneizados em água por meio de um agente umectante, agente promotor de pegajosidade, dispersante ou emulsificador.

10 Alternativamente, é também possível preparar concentrados compreendendo substância ativa, agente umectante, agente promotor da pegajosidade, dispersante ou emulsificador e, se desejado, solvente ou óleo, que são apropriados para diluição com água.

Os tensoativos apropriados (adjuvantes) são os sais de metal

15 alcalino, sais de metal alcalino-terroso e sais de amônio de ácidos sulfônicos aromáticos, por exemplo ácido ligno-, fenol-, naftaleno- e dibutilnaftalenossulfônico e de ácidos graxos, alquil- e alquilarilsulfonatos, sulfatos de alquila, lauril éter sulfatos e sulfatos de álcool graxo, e sais de hexa-, hepta- e octadecanóis sulfatados, e também glicol éteres de álcool

20 graxo, condensados de naftaleno sulfonado e seus derivados com formaldeído, condensados de naftaleno ou dos ácidos naftalenossulfônicos, com fenol e formaldeído, éter octilfenol de polioxietileno, isooctil-, octil- ou nonilfenol etoxilado, poliglicol éter de alquilfenila ou tributilfenila, álcoois de alquilaril polieter, álcool de isotridecila, álcool graxo / condensados de óxido

25 de etileno, óleo de rícino etoxilado, éteres de polioxietileno alquila ou éteres de polioxipropileno alquila, acetato de éter poliglicol de álcool laurílico, ésteres de sorbitol, licores de refugo de lignossulfito, ou metilcellulose.

Os pós, materiais para difusão e produtos polvilháveis podem ser preparados por misturação ou trituração concomitante das substâncias

ativas junto com um veículo sólido.

Os grânulos por exemplo grânulos revestidos, grânulos impregnados e grânulos homogêneos, podem ser preparados por ligação do componente ativo com veículos sólidos. Os veículos sólidos são terras
5 minerais, como sílicas, sílica géis, silicatos, talco, caulim, calcário, cal, giz, troncos de árvores, loesses, argila, dolomita, terra diatomácea, sulfato de cálcio, sulfato de magnésio, óxido de magnésio, materiais sintéticos triturados, fertilizantes, como sulfato de amônio, fosfato de amônio, nitrato de amônio, e uréias, e produtos de origem vegetal, como farinha de cereais,
10 farinha de casca de árvore, farinha de madeira, e farinha de cascas de nozes, pós de celulose, ou outros veículos sólidos.

As concentrações dos compostos da fórmula I nas preparações prontas para uso podem ser variadas em amplas faixas. Em geral, as formulações compreendem aproximadamente de 0,001 a 98% em peso,
15 preferivelmente 0,01 a 95% em peso de pelo menos um composto ativo. Os compostos ativos são empregadas em uma pureza de 90% a 100%, preferivelmente 95% a 100% (de acordo com o espectro de RMN).

Os exemplos de formulação abaixo ilustram a preparação destas preparações:

20 I. 20 partes em peso de um composto ativo da fórmula I são dissolvidas em uma mistura composta de 80 partes em peso de benzeno alquilado, 10 partes em peso dos aduto de 8 a 10 mol de óxido de etileno a 1 mol de N-monoetanolamida de ácido oleico, 5 partes em peso de dodecilbenzenossulfonato de cálcio de e 5 partes em peso do aduto de 40 mol
25 de óxido de etileno a 1 mol de óleo de ricino. Despejar a solução em 100 000 partes em peso de água e finamente distribuindo a mesma ai dá uma dispersão aquosa que compreende 0,02% em peso do composto ativo de fórmula I.

II. 20 partes em peso de um composto ativo da fórmula I são dissolvidas em uma mistura composta de 40 partes em peso de ciclo-

hexanona, 30 partes em peso de isobutanol, 20 partes em peso do aduto de 7 mol de óxido de etileno a 1 mol de isooctilfenol e 10 partes em peso dos aduto de 40 mol de óxido de etileno a 1 mol de óleo de rícino. Despejar a solução em 100 000 partes em peso de água e finamente distribuindo a mesma ai dá uma dispersão aquosa que compreende 0,02% em peso do composto ativo de fórmula I.

III. 20 partes em peso de um composto ativo da fórmula I são dissolvidas em uma mistura composta de 25 partes em peso de ciclohexanona, 65 partes em peso de uma fração de óleo mineral de ponto de ebulição de 210 a 280°C e 10 partes em peso do aduto de 40 mol de óxido de etileno a 1 mol de óleo de rícino. Despejar a solução em 100 000 partes em peso de água e finamente distribuindo a mesma ai dá uma dispersão aquosa que compreende 0,02% em peso do composto ativo de fórmula I.

IV. 20 partes em peso de um composto ativo da fórmula I são misturadas completamente com 3 partes em peso de diisobutilnaftalenosulfonato de sódio, 17 partes em peso do sal de sódio de ácido lignossulfônico de um licor de refugo de sulfito e 60 partes em peso de sílica gel pulverulenta e a mistura é triturada em um moinho de martelo. Distribuir finamente a mistura em 20 000 partes em peso de água dá uma mistura de pulverização que compreende 0,1% em peso do composto ativo de fórmula I.

V. 3 partes em peso de um composto ativo da fórmula I são misturadas com 97 partes em peso de caulim finamente dividido. Isto dá um produto polvilhável que compreende 3% em peso do composto ativo de fórmula I.

VI. 20 partes em peso de um composto ativo da fórmula I são misturadas intimamente com 2 partes em peso de dodecilbenzenossulfonato de cálcio, 8 partes em peso de éter de poliglicol de álcool graxo, 2 partes em peso do sal de sódio de um condensado de fenol/uréia/formaldeído e 68 partes

em peso de um óleo mineral parafínico. Isto dá uma dispersão oleosa estável.

VII. 1 parte em peso de um composto ativo da fórmula I é dissolvida em uma mistura composta de 70 partes em peso de ciclo-hexanona, 20 partes em peso de isooctilfenol etoxilado e 10 partes em peso de óleo de
5 rícino etoxilado. Isto dá um concentrado em emulsão estável.

VIII. 1 parte em peso de um composto ativo da fórmula I é dissolvida em uma mistura composta de 80 partes em peso de ciclo-hexanona e 20 partes em peso de Wettol[®] EM 31 (= emulsificador não iônico com base em óleo de rícino etoxilado). Isto dá um concentrado em emulsão estável. Os
10 compostos da fórmula I ou as composições herbicidas podem ser aplicados pré- ou pós -emergência. Se o composto ativo for bem menos tolerado por algumas plantas de colheita, as técnicas de aplicação podem ser usadas em que as composições herbicidas são pulverizadas com a ajuda dos equipamentos de pulverização, em tal modo que é bem possível que elas não
15 entrem em contato com as folhas das plantas de colheita sensíveis, enquanto os compostos ativos alcançam as folhas de plantas indesejáveis crescendo abaixo das mesmas, ou a superfície do solo nu (pós-dirigido, depositado).

As taxas de aplicação dos composto da fórmula I são de 0,001 a 3,0, preferivelmente 0,01 a 1,0, kg/ha de substância ativa (s.a.) dependendo
20 do alvo de controle, a estão, as plantas alvo e o estágio de crescimento.

Para ampliar o espectro de ação e para obter efeitos sinérgicos, as serina amidas substituídas por benzoila da fórmula I podem ser misturadas com um grande número de representativos de outros grupos de compostos herbicidas ou reguladores do crescimento, e então aplicados
25 concomitantemente. Os apropriados componentes para misturas são, por exemplo, 1,2,4-tiadiazóis, 1,3,4-tiadiazóis, amidas, ácido aminofosfórico e seus derivados, aminotriazóis, anilidas, ácidos (het)ariloxialcanóidos e seus derivados, ácido benzóico e seus derivados, benzotiadiazinonas, 2-(het)aril-1,3-ciclo-hexanodionas, hetaril aril cetonas, benzilisoxazolidinonas,

derivados de meta-CF₃-fenila, carbamatos, ácido quinolinacarboxílico e seus derivados, cloroacetanilidas, derivados de ciclo-hexenona oxima éter, diazinas, ácido dicloropropiônico e seus derivados, diidrobenzofuranos, diidrofuran-3-onas, dinitroanilinas, dinitrofenóis, éteres de difenila, 5 dipiridilas, ácidos halocarboxílicos e seus derivados, uréias, 3-feniluracilas, imidazóis, imidazolinonas, N-fenil-3,4,5,6-tetraidroftalimidas, oxadiazóis, oxiranos, fenóis, ésteres de ariloxi- e hetariloxifenoxipropiônicos, ácido fenilacético, e seus derivados, ácido 2-fenilpropionico e seus derivados, pirazóis, fenilpirazóis, piridazinas, ácido piridinacarboxílico e seus derivados, 10 éteres de pirimidila, sulfonamidas, sulfoniluréias, triazinas, triazinonas, triazolinonas, triazolecarboxamidas e uracilas.

Pode ser ainda benéfico aplicar os compostos da fórmula I sozinhos ou em combinação com outro herbicidas, ou na forma de uma mistura com outros agentes de proteção de colheita, por exemplo junto com 15 agentes para controlar pragas ou fungos fitopatogênicos ou bactérias. Também é de interesse a miscibilidade com soluções de sal mineral, que são empregadas para o tratamento de deficiências de elementos nutricionais e de traço. Os óleos não fitotóxicos e concentrados de óleos também podem ser adicionados.

20 **Exemplos de uso.**

A atividade herbicida das alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I foi demonstrada pelas seguintes experiências em estufa:

Os recipientes de colheita usados foram vasos para flores de plástico contendo areia argilosa com aproximadamente 3,0% de húmus como 25 o substrato. As sementes das plantas de teste foram semeadas separadamente para cada espécie.

Para o tratamento de pré-emergência, os compostos ativos, que foram colocados em suspensão ou emulsificados em água, foram aplicados diretamente após semear por meio de bocais de distribuição fina. Os

recipientes foram irrigados suavemente para promover a germinação e crescimento e subsequentemente cobertos com coifas de plástico transparentes até as plantas terem criado raízes. Esta cobertura causa uma germinação uniforme das plantas de teste, a não ser que seja prejudicada por compostos ativos.

Para o tratamento de pós- emergência, as plantas de teste foram primeiro cultivadas em uma altura de 3 a 15 cm, dependendo do habitat da planta, e somente então tratadas com os compostos ativos que tinham sido colocados em suspensão ou emulsificados em água. Para este fim, as plantas de teste foram ou semeadas diretamente e cultivadas nos mesmos recipientes, ou elas foram primeiro cultivadas em separado como mudas e transplantadas nos recipientes de teste alguns dias antes para o tratamento. A taxa de aplicação para o tratamento de pós- emergência foi de 1,0 kg/ha de s.a. (substância ativa).

Dependendo da espécie, as plantas foram mantidas a 10 – 25°C ou 20 – 35°C. O período de teste se estende em 2 a 4 semanas. Durante este tempo, as plantas foram cuidadas, e sua resposta ao tratamento individual foi avaliada.. A avaliação foi realizada usando uma escala de 0 a 100. 100 significa sem emergência das plantas, ou completa destruição de pelo menos as partes aéreas, e 0 significa sem dano, ou curso normal de crescimento.

As plantas usadas nas experiências de estufa pertenciam às seguintes espécies:

Nome científico	Nome comum
<i>Amaranthus retroflexus</i>	amaranto
<i>Chenopodium album</i>	quenopódio
<i>Galium aparine</i>	aparinas
<i>Setaria viridis</i>	rabo-de-raposa

Em taxas de aplicação de 1 kg/ha, os compostos 4.4, 4.12, 4.16, 4.21, 4.22, 4.33, 4.34 e 4.36 (Tabela 4) mostraram uma atividade de pós- emergência muito boa contra as plantas indesejadas *Amaranthus retroflexus*, *Chenopodium album* e *Setaria viridis*.

Além disso, em taxas de aplicação de 0,5 kg/ha, os compostos 3.12 (Tabela 3) e 5.2 (Tabela 5) mostraram uma atividade de pós emergência muito boa contra as plantas indesejadas *Amaranthus retroflexus*, *Chenopodium album* e *Galium aparine*.

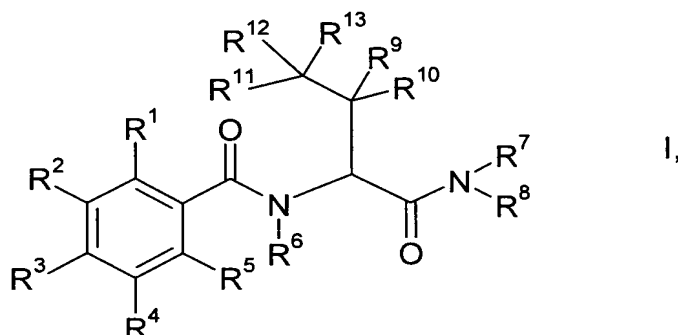
- 5 Em taxas de aplicação de 0,5 kg/ha, o composto 5.1 (Tabela 5) mostrou atividade pós- emergência muito boa contra a planta indesejada *Amaranthus retroflexus* e boa atividade contra as plantas indesejadas *Chenopodium album* e *Galium aparine*.

- 10 Em taxas de aplicação de 1,0 kg/ha, o composto 5.3 (Tabela 5) mostrou atividade pós- emergência muito boa contra a planta indesejada *Amaranthus retroflexus* e boa atividade contra a planta indesejada *Chenopodium album*.

- 15 Além disso, em taxas de aplicação de 1,0 kg/ha, o composto 5.4 (Tabela 5) mostrou atividade pós- emergência muito boa contra as plantas indesejadas *Amaranthus retroflexus* e *Chenopodium album*.

REIVINDICAÇÕES

1. Composto sendo alanina substituída por benzoíla, caracterizado pelo fato de ser da fórmula I



em que as variáveis são como definidas abaixo:

- 5 R^1 é halogênio, ciano, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -haloalquila ou C_1 - C_6 -haloalcóxi;
- R^2 , R^3 , R^4 , R^5 são hidrogênio, halogênio, ciano, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -haloalquila, C_1 - C_6 -alcóxi ou C_1 - C_6 -haloalcóxi;
- R^6 , R^7 são hidrogênio, hidroxila ou C_1 - C_6 -alcóxi;
- 10 R^8 é C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_4 -cianoalquila ou C_1 - C_6 -haloalquila;
- R^9 é hidrogênio ou C_1 - C_6 -alquila;
- R^{10} é hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_2 - C_6 -alquenila, C_2 - C_6 -alquinila, C_1 - C_6 -haloalquila, C_2 - C_6 -haloalquenila, C_2 - C_6 -haloalquinila, C_1 - C_6 -cianoalquila, C_2 - C_6 -cianoalquenila, C_2 - C_6 -cianoalquinila, C_1 - C_6 -hidroxialquila, C_2 - C_6 -hidroxialquenila, C_2 - C_6 -hidroxialquinila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_3 - C_6 -cicloalquenila, heterociclila de 3 a 6 membros,
- 15 onde os radicais cicloalquila, cicloalquenila ou heterociclila de 3 a 6 membros acima mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três radicais dentre o grupo
- 20 consistindo de oxo, ciano, nitro, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -haloalquila, hidroxila, C_1 - C_6 -alcóxi, C_1 - C_6 -haloalcóxi, hidroxicarbonila, C_1 - C_6 -alcoxicarbonila, hidroxicarbonil- C_1 - C_6 -alcóxi, C_1 - C_6 -alcoxicarbonil- C_1 - C_6 -alcóxi, amino, C_1 - C_6 -alquilamino, di(C_1 - C_6 -alquil)amino, C_1 - C_6 -alquilsulfonilamino, C_1 - C_6 -haloalquilsulfonilamino, aminocarbonilamino, (C_1 - C_6 -

alquilamino)carbonilamino, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino, arila e aril(C₁-C₆-alquila);

C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alqueniloxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alquiniłoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-haloalqueniloxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-haloalquiniłoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquiltio-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alqueniltio-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alquiniłtio-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalquil-C₁-C₄-tioalquila, C₂-C₆-haloalquenil-C₁-C₄-tioalquila, C₂-C₆-haloalquinił-C₁-C₄-tioalquila, C₁-C₆-alquilsulfinil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalquilsulfinil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalquilsulfonil-C₁-C₄-alquila, amino-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquilsulfonil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilsulfonil-(C₁-C₆-alquil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarbonila, hidroxicarbonila, C₁-C₆-alcoxicarbonila, aminocarbonila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, formilamino-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alcoxicarbonil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarbonil-C₁-C₆-alquila, hidroxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalcoxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarboniloxi-C₁-C₄-alquila, aminocarbonil-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonil-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonil-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquilcarbonil)amino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarbonil(C₁-C₆-alquilamino)C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)aminocarboniloxi-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarboniloxi-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino-C₁-C₄-alquila;

fenila, fenil-C₁-C₄-alquila, fenil-C₂-C₄-alquenila, fenil-C₂-C₄-alquiniłila, fenil-C₁-C₄-haloalquila, fenil-C₂-C₄-haloalquenila, fenil-C₂-C₄-haloalquiniłila, fenil-C₁-C₄-hidroxialquila, fenil-C₂-C₄-hidroxialquenila, fenil-C₂-C₄-hidroxialquiniłila, fenilcarbonil-C₁-C₄-alquila, fenilcarboniloxi-C₁-C₄-

alquila, feniloxycarbonil-C₁-C₄-alquila, feniloxi-C₁-C₄-alquila, feniltio-C₁-C₄-alquila, fenilsulfinil-C₁-C₄-alquila, fenilsulfonil-C₁-C₄-alquila,

heteroarila, heteroaril-C₁-C₄-alquila, heteroaril-C₂-C₄-alquenila, heteroaril-C₂-C₄-alquinila, heteroaril-C₁-C₄-haloalquila, heteroaril-C₂-C₄-haloalquenila, heteroaril-C₂-C₄-haloalquinila, heteroaril-C₁-C₄-hidroxialquila, heteroaril-C₂-C₄-hidroxialquenila, heteroaril-C₂-C₄-hidroxialquinila, heteroarilcarbonil-C₁-C₄-alquila, heteroarilcarboniloxi-C₁-C₄-alquila, heteroariloxycarbonil-C₁-C₄-alquila, heteroariloxi-C₁-C₄-alquila, heteroariltio-C₁-C₄-alquila, heteroarilsulfinil-C₁-C₄-alquila, heteroarilsulfonil-C₁-C₄-alquila,

onde os radicais fenila e heteroarila acima mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três radicais dentre o grupo consistindo de ciano, nitro, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-haloalquila, hidroxila, C₁-C₆-hidroxialquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-haloalcóxi, hidroxycarbonila, C₁-C₆-alcoxycarbonila, hidroxycarbonil-C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-alcoxycarbonil-C₁-C₆-alcóxi, amino, C₁-C₆-alquilamino, di(C₁-C₆-alquil)amino, C₁-C₆-alquilsulfonilamino, C₁-C₆-haloalquilsulfonilamino, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino, arila e aril(C₁-C₆-alquila);

R¹¹ é OR¹⁴, NR¹⁵R¹⁶ ou NO₂;

R¹² é hidrogênio, C₁-C₆-alquila ou C₁-C₆-haloalquila;

R¹³ é hidrogênio, C₁-C₆-alquila ou C₁-C₆-haloalquila;

R¹⁴, R¹⁵ são hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₃-C₆-alquenila, C₃-C₆-alquinila, C₃-C₆-haloalquenila, C₃-C₆-haloalquinila, formila, C₁-C₆-alquilcarbonila, C₁-C₆-alquiltiocarbonila, C₃-C₆-cicloalquilcarbonila, C₂-C₆-alquenilcarbonila, C₂-C₆-alquinilcarbonila, C₁-C₆-alcoxycarbonila, C₃-C₆-alqueniloxycarbonila, C₃-C₆-alquiniloxycarbonila, aminocarbonila, C₁-C₆-alquilaminocarbonila, C₃-C₆-alquenilaminocarbonila, C₃-C₆-alquinilaminocarbonila, C₁-C₆-alquilsulfonilaminocarbonila, di(C₁-C₆-

alquil)aminocarbonila, N-(C₃-C₆-alquenil)-N-(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila,
 N-(C₃-C₆-alquinil)-N-(C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, N-(C₁-C₆-alcoxi)-N-(C₁-
 C₆-alquil)aminocarbonila, N-(C₃-C₆-alquenil)-N-(C₁-C₆-
 alcoxi)aminocarbonila, N-(C₃-C₆-alquinil)-N-(C₁-C₆-alcoxi)aminocarbonila,
 5 [(C₁-C₆-alquil)aminocarbonil-(C₁-C₆-alquil)amino]carbonila, (C₁-C₆-
 alquil)aminotiocarbonila, di(C₁-C₆-alquil)aminotiocarbonila, (C₁-C₆-
 alquil)cianoimino, (amino)cianoimino, (C₁-C₆-alquil)aminocianoimino, di(C₁-
 C₆-alquil)aminocianoimino, C₁-C₆-alquilcarbonil-C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-
 alcoxiimino-C₁-C₆-alquila, N-(C₁-C₆-alquilamino)imino-C₁-C₆-alquila, N-(di-
 10 C₁-C₆-alquilamino)imino-C₁-C₆-alquila ou tri-C₁-C₄-alquilsilila,

onde os radicais alquila, cicloalquila e alcóxi mencionados
 podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a
 três dos seguintes grupos: ciano, hidroxila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-alcoxi-
 C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-
 15 alquiltio, di(C₁-C₄-alquil)amino, C₁-C₄-alquil-C₁-C₆-alcoxicarbonilamino, C₁-
 C₄-alquilcarbonila, hidroxicarbonila, C₁-C₄-alcoxicarbonila, aminocarbonila,
 C₁-C₄-alquilaminocarbonila, di(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila ou C₁-C₄-
 alquilcarboniloxi;

fenila, fenil-C₁-C₆-alquila, fenilcarbonil-C₁-C₆-alquila,
 20 fenoxicarbonila, fenilaminocarbonila, fenilsulfonilaminocarbonila, N-(C₁-C₆-
 alquil)-N-(fenil)aminocarbonila, fenil-C₁-C₆-alquilcarbonila,

onde um radical fenila pode ser parcialmente ou totalmente
 halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: nitro, ciano,
 C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₄-haloalcóxi; ou

25 SO₂R¹⁷;

R¹⁶ é hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₃-C₆-
 alquenila, C₃-C₆-alquinila, C₃-C₆-haloalquenila, C₃-C₆-haloalquinila, hidroxila
 ou C₁-C₆-alcóxi;

R¹⁷ é C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-haloalquila, di(C₁-C₆-alquil)amino

ou fenila,

onde um radical fenila pode ser parcialmente ou totalmente halogenado e/ou pode carregar um a três dos seguintes grupos: C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-haloalquila ou C₁-C₆-alcóxi;

5 ou um sal agriculturalmente utilizável da mesma.

2. Composto sendo alanina substituída por benzoíla da fórmula I de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que R¹ é halogênio ou C₁-C₆-haloalquila.

3. Composto sendo alanina substituída por benzoíla da fórmula I de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizado pelo fato de que R² e R³, independentemente um do outro, são hidrogênio, halogênio ou C₁-C₆-haloalquila.

4. Composto sendo alanina substituída por benzoíla da fórmula I de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 3, caracterizado pelo fato de que R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹² e R¹³ são hidrogênio.

5. Composto sendo alanina substituída por benzoíla da fórmula I de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 4, caracterizado pelo fato de que R¹⁰ é hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₁-C₆-cianoalquila, C₁-C₆-hidroxialquila, C₂-C₆-hidroxialquenila, C₂-C₆-hidroxialquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₃-C₆-cicloalquenila ou heterociclila de 3 a 6 membros,

onde os radicais cicloalquila, cicloalquenila ou heterociclila de 3 a 6 membros acima mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três radicais dentre o grupo consistindo de oxo, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-haloalquila, hidroxicarbonila e C₁-C₆-alcoxicarbonila;

C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquiltio-C₁-C₄-alquila, C₁-

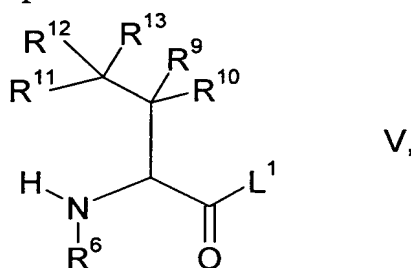
C₆-alquilsulfonilamino-C₁-C₄-alquila, hidroxicarbonila, C₁-C₆-alcoxicarbonila, aminocarbonila, hidroxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alcoxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-haloalcoxicarbonil-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarboniloxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₆-alquilcarbonilamino-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarbonilamino-C₁-C₄-alquila, di(C₁-C₆-alquil)aminocarboniloxi-C₁-C₄-alquila, formilamino-C₁-C₄-alquila;

fenila, fenil-C₁-C₄-alquila, fenil-C₂-C₄-alquenila, fenil-C₂-C₄-alquinila, fenil-C₁-C₄-haloalquila, fenil-C₂-C₄-haloalquenila, fenil-C₁-C₄-hidroxialquila, feniloxi-C₁-C₄-alquila, feniltio-C₁-C₄-alquila, fenilsulfinil-C₁-C₄-alquila, fenilsulfonil-C₁-C₄-alquila;

heteroarila, heteroaril-C₁-C₄-alquila, heteroaril-C₁-C₄-hidroxialquila, heteroariloxi-C₁-C₄-alquila, heteroariltio-C₁-C₄-alquila, heteroarilsulfinil-C₁-C₄-alquila ou heteroarilsulfonil-C₁-C₄-alquila,

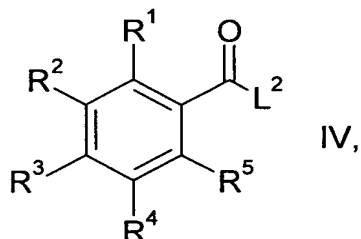
onde os radicais fenila e heteroarila acima mencionados podem ser parcialmente ou totalmente halogenados e/ou podem carregar um a três radicais dentre o grupo consistindo de ciano, nitro, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-haloalquila, hidroxila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-haloalcóxi, hidroxicarbonila, C₁-C₆-alcoxicarbonila, hidroxicarbonil-C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-alquilsulfonilamino e C₁-C₆-haloalquilsulfonilamino.

6. Processo para preparar compostos sendo alaninas substituídas por benzoíla da fórmula I como definidos na reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que um derivado de alanina da fórmula V



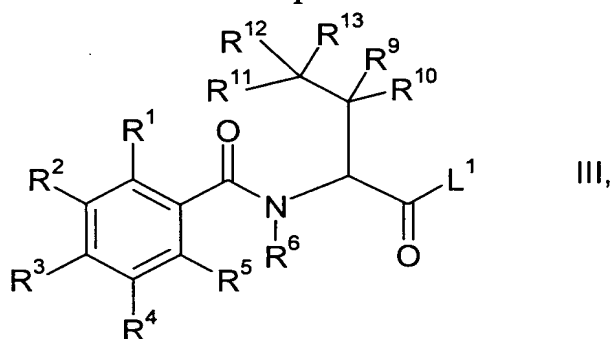
onde R⁶, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹² e R¹³ são como definidos na reivindicação 1 e L¹ é hidróxi ou C₁-C₆-alcóxi,

é reagido com um ácido benzóico ou derivado de ácido benzóico da fórmula IV



onde R^1 a R^5 são como definidos na reivindicação 1 e L^2 é hidróxi, halogênio, C_1 - C_6 -alquilcarbonila, C_1 - C_6 -alcoxicarbonila, C_1 - C_4 -alquilsulfonila, fosforila ou isoureíla,

para dar o derivado de benzoila correspondente da fórmula III



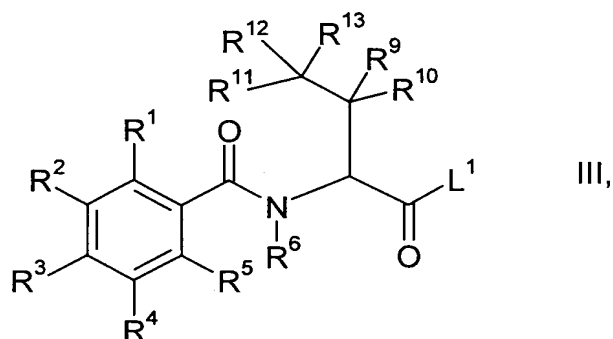
onde R^1 a R^6 , R^9 a R^{13} são como definidos na reivindicação 1 e L^1 é hidroxila ou C_1 - C_6 -alcóxi,

e o derivado de benzoíla resultante da fórmula III é então reagido com uma amina da fórmula II



onde R^7 e R^8 são como definidos na reivindicação 1.

7. Composto sendo derivado de benzoila, caracterizado pelo fato de ser da fórmula III



onde R¹ a R⁶ e R⁹ a R¹³ são como definidos na reivindicação 1 e L¹ é hidroxila ou C₁-C₆-alcóxi.

5 8. Composição, caracterizada pelo fato de compreender uma quantidade herbicidamente eficaz de pelo uma alanina substituída por benzoíla da fórmula I ou um sal agriculturalmente utilizável de I como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 5 e auxiliares comuns para a formulação de agentes de proteção de colheitas.

10 9. Processo para preparar composições como definidas na reivindicação 9, caracterizado pelo fato de que uma quantidade herbicidamente eficaz de pelo menos uma alanina substituída por benzoíla da fórmula I ou um sal agriculturalmente utilizável de I como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 5 e auxiliares comuns para a formulação de agentes de proteção de colheita são misturados.

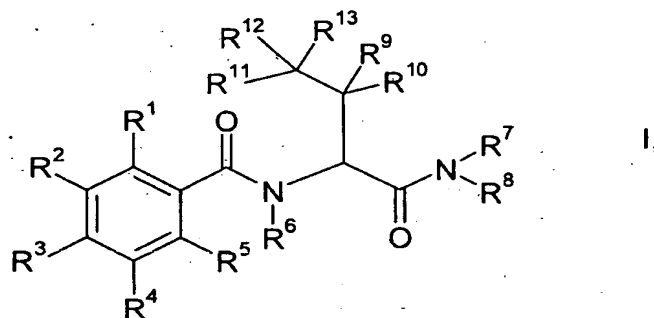
15 10. Processo para combater vegetação indesejada, caracterizado pelo fato de que uma quantidade herbicidamente eficaz de pelo menos uma alanina substituída por benzoíla da fórmula I ou um sal agriculturalmente utilizável de I como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 5 é deixado atuar em plantas, seu habitat e/ou em sementes.

20 11. Uso do composto sendo alanina substituída por benzoíla da fórmula I ou um sal agriculturalmente utilizável do mesmo, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 5, caracterizado pelo fato de ser como um herbicida.

RESUMO

“COMPOSTO, PROCESSO PARA PREPARAR COMPOSTOS,
COMPOSIÇÃO, PROCESSO PARA PREPARAR COMPOSIÇÕES,
PROCESSO PARA COMBATER VEGETAÇÃO INDESEJADA, E, USO
5 DO COMPOSTO”

A invenção refere-se a alaninas substituídas por benzoíla de
fórmula (I),



em que as variáveis R^1 a R^{13} são definidas como citado na descrição, e a seus
sais agriculturalmente utilizáveis. A invenção também refere-se a processos e
10 intermediários para a produção de referidos compostos, ao uso de referidos
compostos ou a agentes contendo os últimos para combater plantas
indesejáveis.