



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

(21) **PI 0714459-8 A2**

(22) Data de Depósito: 16/07/2007
(43) Data da Publicação: 07/05/2013
(RPI 2209)



(51) *Int.Cl.:*
C07D 471/04
A01N 43/60

(54) **Título:** MÉTODO PARA CONTROLAR PLANTAS, COMPOSTO, PROCESSO PARA PREPARAR UM COMPOSTO, E, COMPOSIÇÃO HERBICIDA

(30) **Prioridade Unionista:** 20/07/2006 GB 0614471.1

(73) **Titular(es):** Syngenta Limited

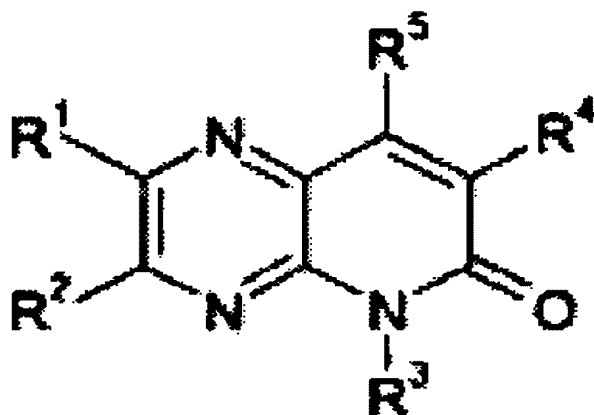
(72) **Inventor(es):** Matthew Robert Cordingley, Michael Drysdale
Turnbull, Neil Brian Carter, Patrick Jelf Crowley

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

(86) **Pedido Internacional:** PCT GB2007002668 de
16/07/2007

(87) **Publicação Internacional:** WO 2008/009908 de
24/01/2008

(57) **Resumo:** MÉTODO PARA CONTROLAR PLANTAS, COMPOSTO, PROCESSO PARA PREPARAR UM COMPOSTO, E, COMPOSIÇÃO HERBICIDA. A presente invenção se refere a um método de controle de plantas ou de inibição do crescimento vegetal, o qual compreende a aplicação às plantas ou aos seus locais de uma quantidade herbicidamente eficaz de um composto de fórmula (I), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são conforme é definido na reivindicação 1; ou sais ou N-óxidos dos mesmos. Além disso, a presente invenção se refere aos processos para preparar compostos de fórmula (I), aos compostos herbicidas compreendendo os compostos de fórmula (I) e a certas novas pirido[2,3-b]pirazinas.



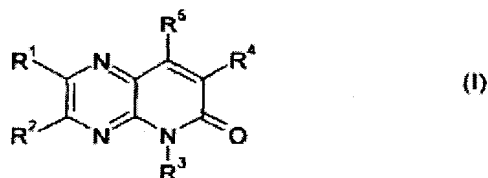
“MÉTODO PARA CONTROLAR PLANTAS, COMPOSTO, PROCESSO PARA PREPARAR UM COMPOSTO, E, COMPOSIÇÃO HERBICIDA”

A presente invenção se refere a novas pirido[2,3-b]pirazinas herbicidas, aos processos para as suas preparações, às composições compreendendo aqueles compostos, e aos seus usos no controle de plantas ou inibição do crescimento vegetal.

Pirido[2,3-b]pirazinas foram reveladas como intermediárias na síntese de compostos fungicidas, por exemplo, em WO 04/056825, WO 05/123698 e em WO 05/123733. Pirido[2,3-b]pirazinas foram reveladas como compostos fungicidas em WO 05/010000.

Foi surpreendentemente descoberto agora que certas pirido[2,3-b]pirazinas apresentam excelentes propriedades herbicidas e inibitórias do crescimento.

A presente invenção, conseqüentemente, proporciona um método de controle de plantas o qual compreende a aplicação às plantas ou aos seus locais de uma quantidade herbicidamente eficaz de um composto de fórmula (I)



em que

R¹ e R² são independentemente hidrogênio, alquil C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄, halo, ciano, hidróxi, alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, aril ou aril substituído por de um a cinco R⁶, o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heteroaril ou heteroaril substituído por de uma cinco R⁶, o qual pode ser o mesmo ou diferente;

R³ é hidrogênio, alquil C₁-C₁₀, alquenil C₂-C₁₀, alquinil C₂-C₁₀, cicloalquil C₃-C₁₀, cicloalquil C₃-C₁₀-alquil C₁-C₆-, alcóxi C₁-C₁₀-alquil C₁-C₆-, cianoalquil C₁-C₁₀, alcoxicarbonil C₁-C₁₀-alquil C₁-C₆-, N-alquil C₁-C₃-

aminocarbonilalquil C₁-C₆-, N,N-di-(alquil C₁-C₃)-aminocarbonilalquil C₁-C₆-, arilalquil C₁-C₆- ou arilalquil C₁-C₆-, em que a porção aril é substituída por de um a três R⁷, o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heterociclilalquil C₁-C₆ ou heterociclilalquil C₁-C₆-, em que a porção heterociclil é substituída por de um a três R⁷, o qual pode ser o mesmo ou diferente;

R⁴ é aril ou aril substituído por de um a cinco R⁸, os quais podem ser os mesmos ou diferentes, ou heteroaril ou heteroaril substituído por de um a quatro R⁸, os quais podem ser os mesmos ou diferentes;

R⁵ é hidróxi, R⁹-óxi-, R¹⁰-carbonilóxi-, tri-R¹¹-sililóxi- ou R¹²-sulfonilóxi-, cada R⁶, R⁷ e R⁸ sendo independentemente halo, ciano, nitro, alquil C₁-C₁₀, haloalquil C₁-C₄, alquenil C₂-C₁₀, alquinil C₂-C₁₀, hidróxi, alcóxi C₁-C₁₀, haloalcóxi C₁-C₄, alcóxi C₁-C₁₀- alquil C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₇, cicloalcóxi C₃-C₇, cicloalquil C₃-C₇-alquil C₁-C₄-, cicloalquil C₃-C₇-alcóxi C₁-C₄-, alquilcarbonil C₁-C₆-, formil, alcoxicarbonil C₁-C₄-, alquilcarbonilóxi C₁-C₄-, alquiltio C₁-C₁₀-, haloalquiltio C₁-C₄-, alquilsulfinil C₁-C₁₀-, haloalquilsulfinil C₁-C₄-, alquilsulfonil C₁-C₁₀-, haloalquilsulfonil C₁-C₄-, amino, alquilamino C₁-C₁₀-, dialquilamino C₁-C₁₀-, alquilcarbonilamino C₁-C₁₀-, aril ou aril substituído por de um a três R¹³, os quais podem ser os mesmos ou diferentes, heteroaril ou heteroaril substituído por de um a três R¹³, os quais podem ser os mesmos ou diferentes, arilalquil C₁-C₄ ou arilalquil C₁-C₄-, em que a porção aril é substituída por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente, heteroarilalquil C₁-C₄ ou heteroarilalquil C₁-C₄-, em que a porção heteroaril é substituída por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente, arilóxi- ou arilóxi- substituído por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente, heteroarilóxi- ou heteroarilóxi- substituído por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente, ariltio- ou ariltio- substituído por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente ou heteroariltio- ou heteroariltio- substituído por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente;

R⁹ é alquil C₁-C₁₀, alquenil C₂-C₁₀, alquinil C₂-C₁₀ ou arilalquil

C₁-C₄- ou arilalquil C₁-C₄-, em que a porção aril é substituída por de um a cinco substituintes independentemente selecionados de halo, ciano, nitro, alquil C₁-C₆, haloalquil C₁-C₆ ou alcóxi C₁-C₆;

R¹⁰ é alquil C₁-C₁₀, cicloalquil C₃-C₁₀, cicloalquil C₃-C₁₀-alquil C₁-C₁₀-, haloalquil C₁-C₁₀, alquenil C₂-C₁₀, alquinil C₂-C₁₀, alcóxi C₁-C₄-alquil C₁-C₁₀-, alquiltio C₁-C₄-alquil C₁-C₄-, alcóxi C₁-C₁₀, alquenilóxi C₂-C₁₀, alquinilóxi C₂-C₁₀, alquiltio C₁-C₁₀-, N-alquilamino C₁-C₄-, N,N-di-(alquil C₁-C₄)-amino-, aril ou aril substituído por de um a três R¹⁴, o qual pode ser o mesmo ou diferente, heteroaril ou heteroaril substituído por de um a três R¹⁴, o qual pode ser o mesmo ou diferente, arilalquil C₁-C₄ ou arilalquil C₁-C₄-, em que a porção heteroaril é substituída por de um a três R¹⁴, o qual pode ser o mesmo ou diferente, arilóxi- ou arilóxi- substituído por de um a três R¹⁴, o qual pode ser o mesmo ou diferente, heteroarilóxi- ou heteroarilóxi- substituído por de um a três R¹⁴, o qual pode ser o mesmo ou diferente, ariltio- ou ariltio- substituído por de um a três R¹⁴, o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heteroariltio- ou heteroariltio- substituído por de um a três R¹⁴, o qual pode ser o mesmo ou diferente;

cada R¹¹ é independentemente alquil C₁-C₁₀ ou fenil ou fenil substituído por de um a cinco substituintes independentemente selecionados de halo, ciano, nitro, alquil C₁-C₆, haloalquil C₁-C₆ ou alcóxi C₁-C₆;

R¹² é alquil C₁-C₁₀ ou fenil ou fenil substituído por de um a cinco substituintes independentemente selecionados de halo, ciano, nitro, alquil C₁-C₆, haloalquil C₁-C₆ ou alcóxi C₁-C₆;

cada R¹³ é independentemente halo, ciano, nitro, alquil C₁-C₆, haloalquil C₁-C₆ ou alcóxi C₁-C₆;

e

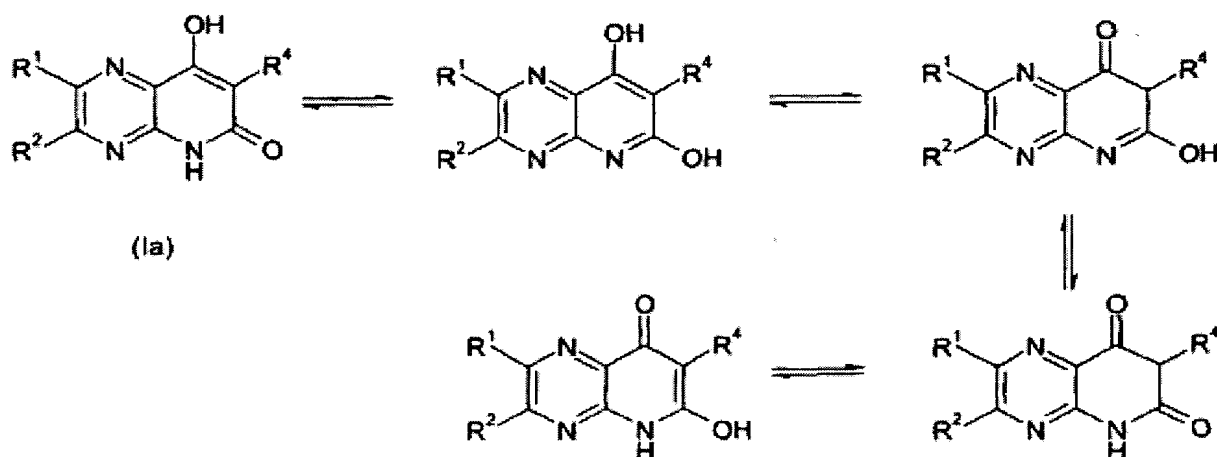
cada R¹⁴ é halo, ciano, nitro, alquil C₁-C₁₀, haloalquil C₁-C₄, alcóxi C₁-C₁₀, alcoxycarbonil C₁-C₄-, haloalcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₁₀,

haloalquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinil C_1-C_{10} , haloalquilsulfinil C_1-C_4 , alquilsulfonil C_1-C_{10} , haloalquilsulfonil C_1-C_4 , aril ou aril substituído por de um a cinco substituintes selecionados independentemente de halo, ciano, nitro, alquil C_1-C_6 , haloalquil C_1-C_6 ou alcóxi C_1-C_6 , ou heteroaril ou heteroaril substituído por de um a quatro substituintes independentemente selecionados de halo, ciano, nitro, alquil C_1-C_6 , haloalquil C_1-C_6 ou alcóxi C_1-C_6 ;

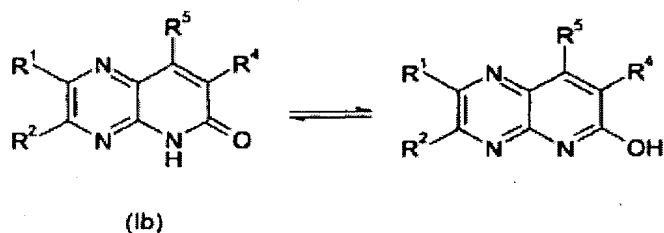
ou sais ou N-óxidos dos mesmos.

Os compostos de fórmula (I) podem existir em diferentes formas de isômeros geométricos ou óticos ou tautoméricas. Essa invenção cobre todos os tais isômeros e tautômeros e suas misturas em todas as proporções, assim como as formas isotópicas, tais como os compostos deuterados.

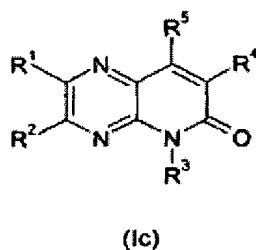
Por exemplo, um composto de fórmula (Ia), isto é, um composto de fórmula (I) em que R^3 é hidrogênio e R^5 é hidróxi, pode ser desenhado em pelo menos cinco formas tautoméricas.



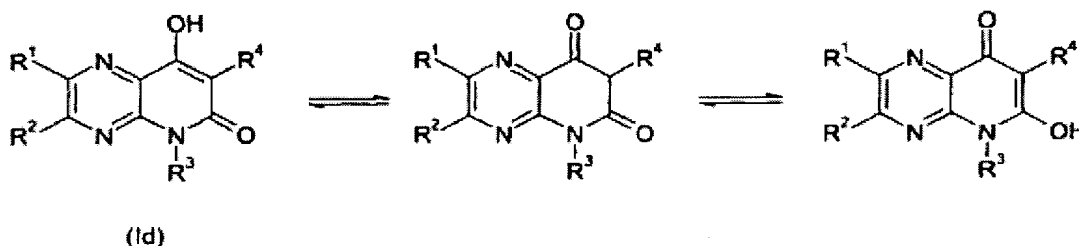
Por exemplo, um composto de fórmula (Ib), isto é, um composto de fórmula (I), em que R^3 é hidrogênio e R^5 é conforme definido para os compostos de fórmula (I) diferente de hidróxi, pode ser desenhado em pelo menos duas formas tautoméricas.



Um composto de fórmula (Ic), isto é, um composto de fórmula (I), em que R^3 é conforme definido para os compostos de fórmula (I) diferente de hidrogênio e R^5 é conforme definido para os compostos de fórmula (I) diferente de hidróxi, pode ser desenhado em somente uma forma tautomérica.



Um composto de fórmula (Id), isto é, um composto de fórmula (I), em que R^3 é conforme definido para os compostos de fórmula (I) diferente de hidrogênio e R^5 é hidróxi, pode ser desenhado em três formas tautoméricas.



Cada porção alquil (seja sozinha ou como parte de um grupo maior, tal como alcóxi, alcóxicarbonil, alquilcarbonil, alquilaminocarbonil, dialquilaminocarbonil) é uma cadeia linear ou ramificada e é, por exemplo, metil, etil, n-propil, n-butil, n-pentil, n-hexil, isopropil, n-butil, sec-butil, isobutil, terc-butil ou neopentil. Os grupos alquil são preferivelmente grupos alquil de C_1 a C_6 , mais preferivelmente C_1 - C_4 e mais preferivelmente grupos alquil C_1 - C_3 .

Porções alquenil e alquinil (seja sozinhas ou como parte de um

grupo maior, tal como alquenilóxi ou alquinilóxi) podem estar na forma de cadeias lineares ou ramificadas, e as porções alquenil, onde apropriado, podem ser de configuração (E)- ou (Z)-. São exemplos vinil, alil e propargil. Os grupos alquenil e alquinil são preferivelmente grupos alquenil ou alquinil C₂ a C₆, mais preferivelmente C₂-C₄ e mais preferivelmente grupos alquenil ou alquinil C₂ a C₃.

Halogênio é flúor, cloro, bromo ou iodo.

Grupos haloalquil (seja sozinhos ou como parte de um grupo maior), tais como haloalcóxi ou haloalquiltio) são grupos alquil os quais são substituídos com um ou mais do mesmo ou de diferentes átomos de halogênio e são, por exemplo, -CF₃, -CF₂Cl, -CH₂CF₃ ou -CH₂CHF₂. Grupos haloalquenil e haloalquinil (seja sozinhos ou como parte de um grupo maior, tal como haloalquenilóxi ou haloalquinilóxi) são grupos alquenil e alquinil, respectivamente, os quais são substituídos com um ou mais dos mesmos ou de diferentes átomos de halogênio e são, por exemplo, -CH=CF₂, -CCl=CClF ou -C≡CCl.

Grupos cianoalquil são grupos alquil os quais são substituídos com um ou mais grupos ciano, por exemplo, cianometil ou 1,3-dicianopropil.

Grupos cicloalquil podem estar na forma mono- ou bicíclica e podem ser opcionalmente substituídos por um ou mais grupos metil. Os grupos cicloalquil contêm preferivelmente de 3 a 8 átomos de carbono, mais preferivelmente de 3 a 6 átomos de carbono. Exemplos de grupos cicloalquil monocíclicos são ciclopropil, 1-metilciclopropil, 2-metilciclopropil, ciclobutil, ciclopentil e cicloexil.

No contexto da presente especificação, o termo “aril” se refere a um sistema de anel o qual pode ser mono-, bi- ou tricíclico. Exemplos de tais anéis incluem fenil, naftalenil, antracenil, indenil ou fenantrenil. Um grupo aril preferido é fenil.

O termo “heteroaril” se refere a um sistema de anel aromático contendo pelo menos um heteroátomo e consistindo ou de um anel individual

ou de dois ou mais anéis fundidos.

Preferivelmente, anéis individuais irão conter até três e sistemas bicíclicos de até quatro heteroátomos, os quais foram preferivelmente escolhidos dentre nitrogênio, oxigênio e enxofre. Exemplos de tais grupos incluem piridil, piridazinil, pirimidinil, pirazinil, triazinil, furanil, tiofenil, oxazolil, isoxazolil, oxadiazolil, tiazolil, isotiazolil, tiadiazolil, pirrolil, pirazolil, imidazolil, triazolil e tetrazolil. Um grupo heteroaril preferido é piridina. Exemplos de grupos bicíclicos são benzotiofenil, benzimidazolil, benzotiadiazolil, quinolinil, cinolinil, quinoxalinil e pirazolo[1,5-a]pirimidinil.

O termo “heterociclil” é definido para incluir heteroaril e, além disso, seus análogos insaturados ou parcialmente insaturados tais como 4,5,6,7-tetraidrobenzotiofenil, cromen-4-onil, 9H-fluorenil, 3,4-diidro-2H-benzo-1,4-dioxepinil, 2,3-diidrobenzofuranil, piperidinil, 1,3-dioxolanil, 1,3-dioxanil, 4,5-diidroisoxazolil, tetraidrofuranil e morfolinil.

O termo “herbicida”, conforme aqui utilizado, significa um composto que controla ou modifica o crescimento de plantas. O termo “quantidade herbicidamente eficaz” significa a quantidade de tal composto ou combinação de tais compostos que são capazes de produzir um efeito controlador ou modificador no crescimento das plantas. O controle ou modificação dos efeitos incluem todos os desvios do desenvolvimento natural, por exemplo: morte, retardamento, queima de folhas, albinismo, nanismo e semelhantes. O termo “plantas” se refere a todas as partes físicas de uma planta, incluindo sementes, mudas, rebentos, raízes, tubérculos, talos, hastes, folhagem e frutas. O termo “local” é tencionado a incluir solo, sementes e mudas, assim como vegetação estabelecida.

Os valores preferidos de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} e R^{14} são, em qualquer combinação, conforme estabelecido abaixo.

Preferivelmente R^1 é hidrogênio, alquil C_1 - C_4 , haloalquil C_1 -

C₄, halo, ciano, hidróxi ou alcóxi C₁-C₄.

Mais preferivelmente R¹ é hidrogênio, alquil C₁-C₄, halo, ciano ou hidróxi.

5 Ainda mais preferivelmente R¹ é hidrogênio, metil, cloro ou bromo.

Ainda mais preferivelmente R¹ é hidrogênio ou cloro.

Mais preferivelmente R¹ é hidrogênio.

Preferivelmente R² é hidrogênio, alquil C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄, halo, ciano, hidróxi ou alcóxi C₁-C₄.

10 Mais preferivelmente R² é hidrogênio, alquil C₁-C₄, halo, ciano ou hidróxi.

Ainda mais preferivelmente R² é hidrogênio, metil, cloro ou bromo.

Ainda mais preferivelmente R² é hidrogênio ou cloro.

15 Mais preferivelmente R² é hidrogênio.

Preferivelmente R³ é hidrogênio, alquil C₁-C₁₀, alquenil C₂-C₁₀, alquinil C₂-C₁₀, cicloalquil C₃-C₁₀, cicloalquil C₃-C₁₀-alquil C₁-C₆-, alcóxi C₁-C₁₀-alquil C₁-C₆-, cianoalquil C₁-C₁₀, alcoxicarbonil C₁-C₁₀-alquil C₁-C₆-, N-alquilaminocarbonil C₁-C₃-alquil C₁-C₆-, N,N-di-(alquil C₁-C₃)-aminocarbonilalquil C₁-C₆-, benzil ou benzil em que a porção fenil é substituída por de um a três R⁷, o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou fenetil- ou fenetil-, em que a porção fenil é substituída por de um a três R⁷, o qual pode ser o mesmo ou diferente.

25 Mais preferivelmente R³ é hidrogênio, alquil C₁-C₄, alquenil C₂-C₄, alquinil C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquil C₁-C₂-, alcóxi C₁-C₃-alquil C₁-C₂-, cianoalquil C₁-C₄, alcoxicarbonil C₁-C₃-alquil C₁-C₂-, N-alquilaminocarbonil C₁-C₃-alquil C₁-C₂-, N,N-di-(alquil C₁-C₃)-aminocarbonilalquil C₁-C₂-, benzil ou benzil substituído por de um a três R⁷, o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou fenetil- ou fenetil- substituído por
30 de um a três R⁷, o qual pode ser o mesmo ou diferente. Exemplos de tais

grupos preferidos para R^3 são hidrogênio, metil, etil, n-propil, isopropil, n-butil, 2-metilpropil, alil, but-3-en-1-il, propargil, ciclopropil, ciclobutil, ciclopropilmetil-, ciclobutilmetil-, metoximetil-, etoximetil-, 2-metoxietil-, cianometil- ou benzil.

5 Ainda mais preferivelmente R^3 é hidrogênio, alquil C_1-C_4 , alquenil C_2-C_4 ou alquinil C_2-C_4 . Exemplos de tais grupos mais preferidos para R^3 são hidrogênio, metil, etil, n-propil, isopropil, n-butil, 2-metilpropil, allil, but-3-en-1-il ou propargil.

Mais preferivelmente R^3 é hidrogênio ou alquil C_1-C_2 .
10 Exemplos de tais grupos mais preferidos para R^3 são hidrogênio, metil ou etil.

Preferivelmente R^4 é aril ou aril substituído por de um a cinco R^8 , os quais podem ser os mesmos ou diferentes. Exemplos de tais grupos para R^4 são 3-bromo-2-cloro-6-fluorfenil, 2-bromo-4-fluorfenil, 2-bromofenil, 2-bromo-4-trifluormetilfenil, 2-cloro-3,6-difluor-5-nitrofenil, 2-cloro-3,6-
15 difluorfenil, 2-cloro-4,5-difluorfenil, 2-cloro-6-fluor-3-metilfenil, 2-cloro-6-fluor-5-metilfenil, 2-cloro-6-fluor-3-nitrofenil, 2-cloro-4-fluorfenil, 2-cloro-5-fluorfenil, 2-cloro-6-fluorfenil, 2-clorofenil, 3-clorofenil, 4-clorofenil, 2-cloro-3-trifluormetilfenil, 2-cloro-5-trifluormetilfenil, 5-cloro-2-trifluormetilfenil, 6-cloro-2-trifluormetilfenil, 2,3-dicloro-6-fluorfenil, 2,4-
20 dicloro-5-fluorfenil, 3,5-dicloro-2-metoxifenil, 2,3-diclorofenil, 2,4-diclorofenil, 2,5-diclorofenil, 2,6-diclorofenil, 3,4-diclorofenil, 2,6-dicloro-4-trifluormetoxifenil, 2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil, 2,6-dietil-4-metilfenil, 2-difluormetoxifenil, 2,3-dimetoxifenil, 2,4-dimetoxifenil, 2,5-dimetilfenil, 3,5-di(trifluormetil)-fenil, 2-fluorfenil, 4-fluor-2-trifluormetilfenil, 6-fluor-2-
25 trifluormetilfenil, 2-iodofenil, 2-metoxifenil, 2-metóxi-5-trifluormetoxifenil, 6-metil-2-nitrofenil, 2-metilfenil, naft-2-il, naft-3-il, fenil, 2-nitro-4-trifluormetilfenil, 2,3,5-triclorofenil, 2,3,6-triclorofenil, 2-trifluormetoxifenil, 2-trifluormetilfenil, 2,3,6-trifluorfenil e 2,4,6-trimetilfenil.

Mais preferivelmente R^4 é aril substituído por um a quatro R^8 ,
30 o qual pode ser o mesmo ou diferente. Exemplos de tais grupos para R^4 são 3-

bromo-2-cloro-6-fluorfenil, 2-cloro-3,6-difluorfenil, 2-cloro-6-flúor-3-metilfenil, 2-cloro-6-flúor-5-metilfenil, 2-cloro-4-fluorfenil, 2-cloro-5-fluorfenil, 2-clorofenil, 2-cloro-3-trifluormetilfenil, 2-cloro-5-trifluormetilfenil, 6-cloro-2-trifluormetilfenil, 2,3-dicloro-6-fluorfenil, 2,4-dicloro-5-fluorfenil, 3,5-dicloro-2-metoxifenil, 2,3-diclorofenil, 2,4-diclorofenil, 2,5-diclorofenil, 2,6-diclorofenil, 2,6-dicloro-4-trifluormetoxifenil, 2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil, 2,6-dietil-4-metilfenil, 2,3-dimetoxifenil, 2-fluorfenil, 2-metoxifenil, 2-metóxi-5-trifluormetoxifenil, 2-metilfenil, 2-trifluormetoxifenil, 2-trifluormetilfenil e 2,4,6-trimetilfenil.

10 Mais preferivelmente R^4 é aril substituído por um a três R^8 , os quais podem ser os mesmos ou diferentes. Exemplos de tais grupos para R^4 são 3-bromo-2-cloro-6-fluorfenil, 2-cloro-3,6-difluorfenil, 2,4-diclorofenil, 2,6-diclorofenil e 2,6-dicloro-4-trifluormetoxifenil.

Preferivelmente R^5 é hidróxi, R^9 -óxi ou R^{10} -carbonilóxi.

15 Mais preferivelmente R^5 é hidróxi, alcóxi C_1 - C_4 , alquilcarbonilóxi C_1 - C_4 , cicloalquilcarbonilóxi C_1 - C_6 , cicloalquil C_3 - C_{10} -alquilcarbonilóxi C_1 - C_{10} , haloalquilcarbonilóxi C_1 - C_4 , alquenilcarbonilóxi C_2 - C_4 , alquinilcarbonilóxi C_2 - C_4 , alcóxi C_1 - C_4 -alquilcarbonilóxi C_1 - C_4 , alquiltio C_1 - C_4 -alquilcarbonilóxi C_1 - C_4 , alcoxicarbonilóxi C_1 - C_4 ,
 20 alqueniloxicarbonilóxi C_2 - C_4 , alquiniloxicarbonilóxi C_2 - C_4 , alquiltiocarbonilóxi C_1 - C_4 , N-alquilaminocarbonilóxi C_1 - C_4 , N,N-di-(alquil C_1 - C_4)-aminocarbonilóxi-, arilcarbonilóxi- ou arilcarbonilóxi- substituído por um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente, heteroarilcarbonilóxi- ou heteroarilcarbonilóxi- substituído por um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo
 25 ou diferente, arilalquilcarbonilóxi C_1 - C_4 ou arilalquilcarbonilóxi C_1 - C_4 , em que a porção aril é substituída por um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente, heteroarilalquilcarbonilóxi C_1 - C_4 ou heteroarilalquilcarbonilóxi C_1 - C_4 , em que a porção heteroaril é substituída por um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ariloxicarbonilóxi ou ariloxicarbonilóxi substituído por
 30 de um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente,

heteroariloxicarbonilóxi ou heteroariloxicarbonilóxi substituído por de um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ariltiocarbonilóxi ou ariltiocarbonilóxi substituído por de um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heteroariltiocarbonilóxi ou heteroariltiocarbonilóxi substituído por de um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente. Exemplos de grupos preferidos para R^5 são hidróxi, metóxi, etóxi, metilcarbonilóxi-, etilcarbonilóxi-, isopropilcarbonilóxi-, n-propilcarbonilóxi-, but-2-ilcarbonilóxi-, 2-metilpropilcarbonilóxi-, terc-butilcarbonilóxi-, ciclopropilcarbonilóxi-, ciclopentilmetilcarbonilóxi-, clorometilcarbonilóxi-, trifluormetilcarbonilóxi-, alilcarbonilóxi-, (E)-prop-1-en-1-ilcarbonilóxi-, 2-metilprop-1-en-1-ilcarbonilóxi-, metoximetilcarbonilóxi-, etoxicarbonilóxi-, terc-butoxicarbonilóxi-, but-2-in-1-iloxicarbonilóxi-, N,N-dietilaminocarbonilóxi-, fenilcarbonilóxi-, 3-metoxifenilcarbonilóxi-, 4-nitrofenilcarbonilóxi-, benzilcarbonilóxi-, furan-2-ilcarbonilóxi-, 2,5-dimetilfuran-3-ilcarbonilóxi-, tiofen-2-ilcarbonilóxi-, 3,5-dimetilisoxazol-4-ilcarbonilóxi- e 1-fenil-prop-1-ilcarbonilóxi-.

Mais preferivelmente R^5 é hidróxi, alquilcarbonilóxi C_1-C_4 , cicloalquilcarbonilóxi C_3-C_6 , alquenilcarbonilóxi C_2-C_4 , alquinilcarbonilóxi C_2-C_4 , alcoxicarbonilóxi C_1-C_4 , alqueniloxicarbonilóxi C_2-C_4 ou alquiniloxicarbonilóxi C_2-C_4 .

Exemplos de grupos mais preferidos para R^5 são hidróxi, metilcarbonilóxi-, etilcarbonilóxi-, isopropilcarbonilóxi-, n-propilcarbonilóxi-, but-2-ilcarbonilóxi-, 2-metil-propilcarbonilóxi-, terc-butilcarbonilóxi-, ciclopropilcarbonilóxi-, alilcarbonilóxi-, (E)-prop-1-en-1-ilcarbonilóxi-, 2-metilprop-1-en-1-ilcarbonilóxi-, etoxicarbonilóxi-, terc-butoxicarbonilóxi- ou but-2-in-1-iloxicarbonilóxi-.

Mais preferivelmente R^5 é hidróxi, alquilcarbonilóxi C_1-C_4 ou alcoxicarbonilóxi C_1-C_4 . Exemplos dos grupos mais preferidos para R^5 são hidróxi, metilcarbonilóxi-, etilcarbonilóxi-, isopropilcarbonilóxi-, n-propilcarbonilóxi-, but-2-ilcarbonilóxi-, 2-metilpropilcarbonilóxi-, terc-

butilcarbonilóxi-, etoxycarbonilóxi- ou terc-butoxicarbonilóxi-.

Preferivelmente R^5 é alquilsulfonilóxi C_1-C_4 . Exemplos de grupos preferidos para R^5 são metilsulfonilóxi e isopropilsulfonilóxi.

Preferivelmente R^5 é tri-(alquil C_1-C_4)-sililóxi. Um exemplo de grupos preferidos para R^5 é dimetilerc-butilsililóxi.

Preferivelmente cada R^6 é independentemente halo, alquil C_1-C_4 , haloalquil C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 ou haloalcóxi C_1-C_4 . Exemplos de tais grupos preferidos para R^6 são cloro, flúor, metil, etil, trifluormetil, metóxi ou trifluormetóxi.

Preferivelmente cada R^7 é independentemente halo, alquil C_1-C_4 , haloalquil C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 ou haloalcóxi C_1-C_4 . Exemplos de tais grupos preferidos para R^7 são cloro, flúor, metil, etil, trifluormetil, metóxi e trifluormetóxi.

Mais preferivelmente cada R^7 é independentemente halo, alquil C_1-C_4 , haloalquil C_1-C_4 ou alcóxi C_1-C_4 . Exemplos de tais grupos preferidos para R^7 são cloro, flúor, metil, etil, trifluormetil e metóxi.

Preferivelmente, cada R^8 é independentemente halo, ciano, nitro, alquil C_1-C_{10} , haloalquil C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_{10} , alcoxicarbonil C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_{10} -, haloalquiltio C_1-C_4 -, alquilsulfinil C_1-C_{10} -, haloalquilsulfinil C_1-C_4 -, alquilsulfonil C_1-C_{10} - ou haloalquilsulfonil C_1-C_4 -.

Mais preferivelmente cada R^8 é independentemente halo, ciano, nitro, alquil C_1-C_{10} , haloalquil C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_{10} , alcoxicarbonil C_1-C_4 ou haloalcóxi C_1-C_4 ,

Mais preferivelmente, cada R^8 é independentemente halo, alquil C_1-C_{10} , haloalquil C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_{10} ou haloalcóxi C_1-C_4 , Exemplo de tais grupos preferidos para R^8 são flúor, cloro, metil, etil, trifluormetil, metóxi ou trifluormetóxi.

Preferivelmente R^9 é alquil C_1-C_{10} .

Mais preferivelmente R^9 é alquil C_1-C_4 .

Ainda mais preferivelmente R^9 é metil ou etil.

Mais preferivelmente, R^9 é metil.

Preferivelmente R^{10} é alquil C_1-C_{10} , cicloalquil C_3-C_{10} , haloalquil C_1-C_{10} , alquenil C_2-C_{10} ,

alquinil C_2-C_{10} , alcóxi C_1-C_4 -alquil C_1-C_{10} , alquiltio C_1-C_4 -
 5 alquil C_1-C_4 -, alcóxi C_1-C_{10} , alquiltio C_1-C_{10} , N-alquilamino C_1-C_4 , N,N-di-
 (alquil C_1-C_4)-amino, fenil ou fenil substituído por de um a três R^{14} , o qual
 pode ser o mesmo ou diferente, benzil ou benzil em que a porção fenil é
 substituída por de um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente, tienil
 ou tienil substituído por de um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou
 10 diferente, piridil ou piridil substituído por de um a três R^{14} , o qual pode ser o
 mesmo ou diferente, fenóxi ou fenóxi substituído por de um a três R^{14} , o qual
 pode ser o mesmo ou diferente, ou feniltio ou feniltio substituído por de um a
 três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente,

Preferivelmente, cada R^{11} é independentemente alquil C_1-C_4 .

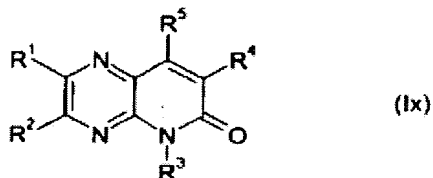
15 Preferivelmente R^{12} é alquil C_1-C_4 .

Preferivelmente cada R^{13} é independentemente halo, nitro, alquil C_1-C_4 , haloalquil C_1-C_4 ou alcóxi C_1-C_4 . Exemplos de tais grupos preferidos são cloro, flúor, nitro, metil, etil, trifluormetil e metóxi.

Preferivelmente cada R^{14} é halo, nitro, alquil C_1-C_4 , haloalquil
 20 C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_4 ou haloalcóxi C_1-C_4 . Exemplos de tais grupos preferidos
 são cloro, flúor, nitro, metil, etil, trifluormetil, metóxi e trifluormetóxi.

Numa modalidade, a invenção proporciona um método para controlar plantas, o qual compreende a aplicação às plantas ou ao local das plantas de uma quantidade herbicidamente eficaz de um composto de Fórmula

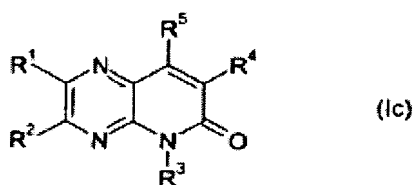
25 (Ix)



em que R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são conforme é definido para os

compostos de fórmula (I) e R^3 é alquil C_1-C_{10} , alquenil C_2-C_{10} , alquinil C_2-C_{10} , cicloalquil C_3-C_{10} , cicloalquil C_3-C_{10} -alquil C_1-C_6 -, alcóxi C_1-C_{10} -alquil C_1-C_6 -, cianoalquil C_1-C_{10} , alcóxicarbonil C_1-C_{10} -alquil C_1-C_6 -, N-alquil C_1-C_3 -aminocarbonilalquil C_1-C_6 -, N,N-di-(alquil C_1-C_3)-aminocarbonilalquil C_1-C_6 -, arilalquil C_1-C_6 - ou arilalquil C_1-C_6 -, em que a porção aril é substituída por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heterociclilalquil C_1-C_6 ou heterociclilalquil C_1-C_6 , em que a porção heterociclil é substituída por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente; ou sais ou N-óxidos dos mesmos. As preferências por R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} e R^{14} são as mesmas que as preferências estabelecidas pra os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I). As preferências por R^3 são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I), exceto que R^3 não pode ser hidrogênio.

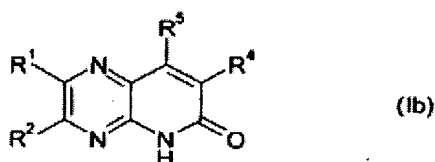
Em outra modalidade, a invenção proporciona um método para controlar plantas, o qual compreende a aplicação nas plantas ou aos seus locais de uma quantidade herbicidamente eficaz de um composto de fórmula (Ic)



em que R^1 , R^2 e R^4 são conforme é definido para os compostos de fórmula (I) e R^3 é alquil C_1-C_{10} , alquenil C_2-C_{10} , alquinil C_2-C_{10} , cicloalquil C_3-C_{10} , cicloalquil C_3-C_{10} -alquil C_1-C_6 -, alcóxi C_1-C_{10} -alquil C_1-C_6 -, cianoalquil C_1-C_{10} , alcóxicarbonil C_1-C_{10} -alquil C_1-C_6 -, N-alquil C_1-C_3 -aminocarbonilalquil C_1-C_6 -, N,N-di-(alquil C_1-C_3)-aminocarbonilalquil C_1-C_6 -, arilalquil C_1-C_6 - ou arilalquil C_1-C_6 -, em que a porção aril é substituída por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heterociclilalquil C_1-C_6 ou heterociclilalquil C_1-C_6 , em que a porção heterociclil é substituída

por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente; e R^5 é R^9 -óxi, R^{10} -carbonilóxi, tri- R^{11} -sililóxi- ou R^{12} -sulfonilóxi; ou sais ou N-óxidos dos mesmos. As preferências por R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} e R^{14} são as mesmas que as preferências estabelecidas pra os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I). As preferências para R^3 são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I), exceto que R^3 não pode ser hidrogênio. As preferências para R^5 são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I), exceto que R^5 não pode ser hidróxi.

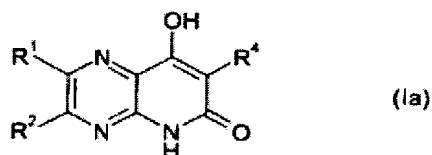
Em outra modalidade, a invenção proporciona um método para controlar plantas, o qual compreende a aplicação nas plantas ou aos seus locais de uma quantidade herbicidamente eficaz de um composto de fórmula (Id)



em que R^1 , R^2 e R^4 são conforme é definido para os compostos de fórmula (I) e R^3 é alquil C_1 - C_{10} , alquenil C_2 - C_{10} , alquinil C_2 - C_{10} , cicloalquil C_3 - C_{10} , cicloalquil C_3 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, alcóxi C_1 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, cianoalquil C_1 - C_{10} , alcóxicarbonil C_1 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, N-alquil C_1 - C_3 -aminocarbonilalquil C_1 - C_6 -, N,N-di-(alquil C_1 - C_3)-aminocarbonilalquil C_1 - C_6 -, arilalquil C_1 - C_6 - ou arilalquil C_1 - C_6 -, em que a porção aril é substituída por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heterociclilalquil C_1 - C_6 ou heterociclilalquil C_1 - C_6 , em que a porção heterociclil é substituída por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente; ou sais ou N-óxidos dos mesmos. As preferências por R^1 , R^2 , R^4 , R^6 , R^7 , R^8 e R^{13} são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I). As preferências para R^3 são as

mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I), exceto que R^3 não pode ser hidrogênio.

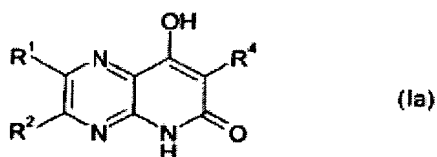
5 Certos compostos de fórmula (I) são novos e, como tais, formam outro aspecto da invenção. Um grupo de novos compostos são os compostos de fórmula (Ia)



em que R^1 , R^2 e R^4 são conforme é definido para os compostos de fórmula (I); ou sais ou N-óxidos dos mesmos, com a condição de que se R^1 e R^2 são hidrogênio, R^4 não é 4-bromo-2,6-
 10 difluorfenil, 2-bromofenil, 2-cloro-4-fluorfenil, 2-cloro-6-fluorfenil, 4-cloro-2-fluorfenil, 4-cloro-2-metilfenil, 2-clorofenil, 5-cloro-2-trifluormetilfenil, 4-ciano-2,6-difluorfenil, 2,4-diclorofenil, 2,6-diclorofenil, 2,6-diflúor-4-metoxicarbonilfenil, 2,6-diflúor-4-metoxifenil, 2,6-diflúor-4-metilfenil, 2,3-difluorfenil, 2,4-difluorfenil, 2,5-difluorfenil,
 15 2,6-difluorfenil, 2,4-dimetilfenil, 2,6-dimetilfenil, 6-flúor-2-metoxifenil, 2-flúor-4-metilfenil, 6-flúor-2-metilfenil, 4-flúor-2-metilfenil, 2-fluorfenil, 4-flúor-2-trifluormetilfenil, 5-flúor-2-trifluormetilfenil, 2,3,4,5,6-pentafluorfenil, 2,3,5,6-tetrafluorfenil, 2,3,4-trifluorfenil, 2,4,6-trifluorfenil, 2,5,6- trifluorfenil ou 2,4,6-trimetilfenil. As preferências por
 20 R^1 , R^2 , R^4 , R^6 , R^8 e R^{13} são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I). Alguns desses compostos exibem uma boa atividade herbicida.

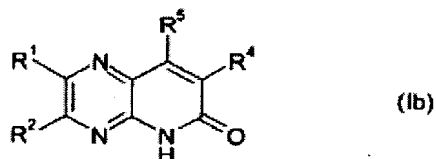
Adicionalmente, esses compostos podem ser usados como intermediários para a síntese dos compostos de fórmula (Ib), (Ic) e (Id).

25 Outro grupo de compostos novos são os compostos de fórmula (Ia)



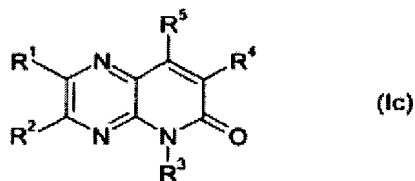
em que R^1 , R^2 e R^4 são conforme é definido para os compostos de fórmula (I); ou sais ou N-óxidos dos mesmos, com a condição de que se R^1 e R^2 são hidrogênio, R^4 não é 2-bromo-4,6-difluorfenil, 4-bromo-2,6-difluorfenil, 2-bromo-6-fluorfenil, 2-bromofenil, 2-cloro-4,6- difluorfenil, 2-cloro-4-fluorfenil, 2-cloro-6-fluorfenil, 4-cloro-2-fluorfenil, 6-cloro-2-metilfenil, 4-cloro-2-metilfenil, 2-clorofenil, 6-cloro-2-trifluormetilfenil, 5-cloro-2-trifluormetilfenil, 4-ciano-2,6-difluorfenil, 2,4-dicloro-6-fluorfenil, 2,6-dicloro-4-fluorfenil, 2,4-diclorofenil, 2,6-diclorofenil, 2,6-difluór-4-metoxycarbonilfenil, 4,6-difluór-2-metoxifenil, 2,6-difluór-4-metoxifenil, 4,6-difluór-2-metilfenil, 2,6-difluór-4-metilfenil, 2,3-difluorfenil, 2,4-difluorfenil, 2,5-difluorfenil, 2,6- difluorfenil, 4,6-difluór-2-trifluormetilfenil, 2,6-dimetoxifenil, 2,4-dimetilfenil, 2,6-dimetilfenil, 2,6-di(trifluormetil)-fenil, 6-fluór-2-metoxifenil, 2-fluór-4-metilfenil, 6-fluór-2-metilfenil, 4-fluór-2-metilfenil, 2-fluorfenil, 6-fluór-2-trifluormetilfenil, 4-fluór-2-trifluormetilfenil, 5-fluór-2-trifluormetilfenil, 2-metoxifenil, 2,3,4,5,6-pentaclorofenil, 2,3,4,5,6-pentafluorfenil, 2,3,5,6-tetrafluorfenil, 2,3,6-triclorofenil, 2,4,6-triclorofenil, 2-trifluormetilfenil, 2,3,4-trifluorfenil, 2,4,6-trifluorfenil, 2,5,6-trifluorfenil ou 2,4,6-trimetilfenil. As preferências por R^1 , R^2 , R^4 , R^6 , R^8 e R^{13} são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I). Alguns desses compostos exibem uma boa atividade herbicida. Adicionalmente, esses compostos podem ser usados como intermediários para a síntese dos compostos de fórmula (Ib), (Ic) e (Id).

Outro grupo de compostos novos são os compostos de fórmula (Ib)



em que R^1 , R^2 e R^4 são conforme é definido para os compostos de fórmula (I) e R^5 é R^9 -óxi, R^{10} -carbonilóxi, tri- R^{11} -sililóxi- ou R^{12} -sulfonilóxi; ou sais ou N-óxidos dos mesmos. As preferências por R^1 , R^2 , R^4 , R^6 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} e R^{14} são as mesmas que as preferências estabelecidas pra os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I). As preferências para R^3 são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I), exceto que R^5 não pode ser hidróxi. Alguns desses compostos exibem uma boa atividade herbicida. Adicionalmente, esses compostos podem ser usados como intermediários para a síntese dos compostos de fórmula (Ia), (Ic) e (Id).

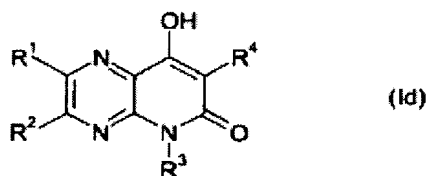
Outro grupo de novos compostos são os compostos de fórmula (Ic)



em que R^1 , R^2 e R^4 são conforme é definido para os compostos de fórmula (I) e R^3 é alquil C_1 - C_{10} , alquenil C_2 - C_{10} , alquinil C_2 - C_{10} , cicloalquil C_3 - C_{10} , cicloalquil C_3 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, alcóxi C_1 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, cianoalquil C_1 - C_{10} , alcoxicarbonil C_1 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, N-alquil C_1 - C_3 -aminocarbonilalquil C_1 - C_6 -, N,N-di-(alquil C_1 - C_3)-aminocarbonilalquil C_1 - C_6 -, arilalquil C_1 - C_6 - ou arilalquil C_1 - C_6 -, em que a porção aril é substituída por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heterociclilalquil C_1 - C_6 ou heterociclilalquil C_1 - C_6 , em que a porção heterociclil é substituída por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente; e R^5 é R^9 -óxi, R^{10} -carbonilóxi, tri- R^{11} -sililóxi- ou R^{12} -sulfonilóxi; ou sais ou N-óxidos dos mesmos. As preferências por R^1 , R^2 , R^4 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} e R^{14}

são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I). As preferências para R^3 são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I), exceto que R^3 não pode ser hidrogênio. As preferências para R^5 são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I), exceto que R^5 não pode ser hidróxi. A maioria desses compostos exibem uma excelente atividade herbicida. Adicionalmente, esses compostos podem ser usados como intermediários para a síntese dos compostos de fórmula (Ia), (Ic) e (Id).

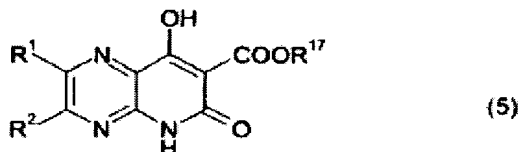
Outro grupo de novos compostos são os compostos de fórmula (Id)



em que R^1 , R^2 e R^4 são conforme é definido para os compostos de fórmula (I) e R^3 é alquil C_1 - C_{10} , alquenil C_2 - C_{10} , alquinil C_2 - C_{10} , cicloalquil C_3 - C_{10} , cicloalquil C_3 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, alcóxi C_1 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, cianoalquil C_1 - C_{10} , alcoxicarbonil C_1 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, N-alquil C_1 - C_3 -aminocarbonilalquil C_1 - C_6 -, N,N-di-(alquil C_1 - C_3)-aminocarbonilalquil C_1 - C_6 -, arilalquil C_1 - C_6 - ou arilalquil C_1 - C_6 -, em que a porção aril é substituída por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heterociclilalquil C_1 - C_6 ou heterociclilalquil C_1 - C_6 , em que a porção heterociclil é substituída por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente; ou sais ou N-óxidos dos mesmos. As preferências por R^1 , R^2 , R^4 , R^6 , R^7 , R^8 , e R^{13} são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I). As preferências para R^3 são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I), exceto que R^3 não pode ser

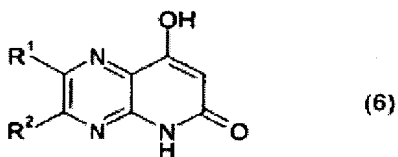
hidrogênio. A maioria desses compostos exibe uma boa atividade herbicida. Adicionalmente, esses compostos podem ser usados como intermediários para a síntese dos compostos de fórmula (Ia), (Ib) e (Ic).

5 Certos intermediários são novos e, como tais, formam outro aspecto da invenção. Um grupo de intermediários novos são os compostos de fórmula (5)



em que R¹ e R² são conforme é definido para os compostos de fórmula (I) e R¹⁷ é alquilC₁-C₆; ou sais ou N-óxidos dos mesmos. As preferências por R¹ e R² são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I). R¹⁷ é preferivelmente alquil C₁-C₄, mais preferivelmente metil ou etil, mais preferivelmente metil.

Outro grupo de novos intermediários são os compostos de fórmula (6)



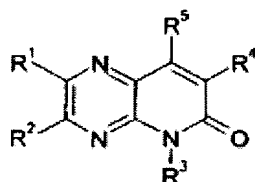
15 em que R¹ e R² são conforme é definido para os compostos de fórmula (I); ou sais ou N-óxidos dos mesmos. As preferências por R¹ e R² são as mesmas que as preferências estabelecidas para os substituintes correspondentes dos compostos de fórmula (I).

20 Os compostos nas Tabelas 1 a 28 abaixo ilustram os compostos da invenção.

Tabela 1:

Tabela 1 fornece 140 compostos de fórmula (I), onde R¹ e R² são ambos hidrogênio, R⁴ é 2-cloro -3,6-difluorfenil e R³ e R⁵ tem os valores

listados na Tabela 1.



(I)

Número do Composto	R ³	R ⁵
1.001	H	-OH
1.002	H	-OCH ₃
1.003	H	-OCOCH ₃
1.004	H	-OCOCH ₂ CH ₃
1.005	H	-OCOCH(CH ₃) ₂
1.006	H	-OCOC(C H ₃) ₃
1.007	H	-OCO-Ciclo-C ₃ H ₅
1.008	H	-OCO-C ₆ H ₅
1.009	H	-OCOCH ₂ C ₆ H ₅
1.010	H	-OCOCH ₂ Cl
1.011	H	-OCOCF ₃
1.012	H	-OCOCH ₂ OCH ₃
1.013	H	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂
1.014	H	-O(CO)OCH ₂ CH ₃
1.015	-CH ₃	-OH
1.016	-CH ₃	-OCH ₃
1.017	-CH ₃	-OCOCH ₃
1.018	-CH ₃	-OCOCH ₂ CH ₃
1.019	-CH ₃	-OCOCH(CH ₃) ₂
1.020	-CH ₃	-OCOC(C H ₃) ₃
1.021	-CH ₃	-OCO-Ciclo-C ₃ H ₅
1.022	-CH ₃	-OCO-C ₆ H ₅

Número do Composto	R ³	R ⁵
1.023	-CH ₃	-OCOCH ₂ C ₆ H ₅
1.024	-CH ₃	-OCOCH ₂ Cl
1.025	-CH ₃	-OCOCF ₃
1.026	-CH ₃	-OCOCH ₂ OCH ₃
1.027	-CH ₃	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂
1.028	-CH ₃	-O(CO)OCH ₂ CH ₃
1.029	-CH ₂ CH ₃	-OH
1.030	-CH ₂ CH ₃	-OCH ₃
1.031	-CH ₂ CH ₃	-OCOCH ₃
1.032	-CH ₂ CH ₃	-OCOCH ₂ CH ₃
1.033	-CH ₂ CH ₃	-OCOCH(CH ₃) ₂
1.034	-CH ₂ CH ₃	-OCOC(C H ₃) ₃
1.035	-CH ₂ CH ₃	-OCO-Ciclo-C ₃ H ₅
1.036	-CH ₂ CH ₃	-OCO-C ₆ H ₅
1.037	-CH ₂ CH ₃	-OCOCH ₂ C ₆ H ₅
1.038	-CH ₂ CH ₃	-OCOCH ₂ Cl
1.039	-CH ₂ CH ₃	-OCOCF ₃
1.040	-CH ₂ CH ₃	-OCOCH ₂ OCH ₃
1.041	-CH ₂ CH ₃	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂
1.042	-CH ₂ CH ₃	-O(CO)OCH ₂ CH ₃
1.043	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OH
1.044	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCH ₃

Número do Composto	R ³	R ³
1.045	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCOCH ₃
1.046	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCOCH ₂ CH ₃
1.047	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCOCH(CH ₃) ₂
1.048	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCOC(C H ₃) ₃
1.049	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCO- Ciclo- C ₃ H ₅
1.050	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCO- C ₆ H ₅
1.051	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCOCH ₂ C ₆ H ₅
1.052	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCOCH ₂ Cl
1.053	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCOCF ₃
1.054	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCOCH ₂ OCH ₃
1.055	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂
1.056	-CH ₂ CH ₂ C H ₃	-O(CO)O CH ₂ CH ₃
1.057	-CH(CH ₃) ₂	-OH
1.058	-CH(CH ₃) ₂	-OCH ₃
1.059	-CH(CH ₃) ₂	-OCOCH ₃
1.060	-CH(CH ₃) ₂	-OCOCH ₂ CH ₃
1.061	-CH(CH ₃) ₂	-OCOCH(CH ₃) ₂
1.062	-CH(CH ₃) ₂	-OCOC(C H ₃) ₃
1.063	-CH(CH ₃) ₂	-OCO- Ciclo- C ₃ H ₅
1.064	-CH(CH ₃) ₂	-OCO- C ₆ H ₅
1.065	-CH(CH ₃) ₂	-OCOCH ₂ C ₆ H ₅
1.066	-CH(CH ₃) ₂	-OCOCH ₂ Cl
1.067	-CH(CH ₃) ₂	-OCOCF ₃
1.068	-CH(CH ₃) ₂	-OCOCH ₂ OCH ₃

Número do Composto	R ³	R ³
1.069	-CH(CH ₃) ₂	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂
1.070	-CH(CH ₃) ₂	-O(CO)O CH ₂ CH ₃
1.071	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OH
1.072	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCH ₃
1.073	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCOCH ₃
1.074	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCOCH ₂ CH ₃
1.075	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCOCH(CH ₃) ₂
1.076	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCOC(C H ₃) ₃
1.077	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCO- Ciclo- C ₃ H ₅
1.078	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCO- C ₆ H ₅
1.079	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCOCH ₂ C ₆ H ₅
1.080	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCOCH ₂ Cl
1.081	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCOCF ₃
1.082	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCOCH ₂ OCH ₃
1.083	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂
1.084	-CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	-O(CO)O CH ₂ CH ₃
1.085	-CH ₂ CH=C H ₂	-OH
1.086	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCH ₃
1.087	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCOCH ₃
1.088	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCOCH ₂ CH ₃
1.089	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCOCH(CH ₃) ₂
1.090	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCOC(C H ₃) ₃

Número do Composto	R ³	R ⁵
1.091	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCO- cyclo- C ₃ H ₅
1.092	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCO- C ₆ H ₅
1.093	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCOCH ₂ C ₆ H ₅
1.094	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCOCH ₂ Cl
1.095	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCOCF ₃
1.096	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCOCH ₂ OCH ₃
1.097	-CH ₂ CH=C H ₂	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂
1.098	-CH ₂ CH=C H ₂	-O(CO)O CH ₂ CH ₃
1.099	-CH ₂ C≡CH	-OH
1.100	-CH ₂ C≡CH	-OCH ₃
1.101	-CH ₂ C≡CH	-OCOCH ₃
1.102	-CH ₂ C≡CH	-OCOCH ₂ CH ₃
1.103	-CH ₂ C≡CH	-OCOCH(C H ₃) ₂
1.104	-CH ₂ C≡CH	-OCOC(C H ₃) ₃
1.105	-CH ₂ C≡CH	-OCO- Ciclo - C ₃ H ₅
1.106	-CH ₂ C≡CH	-OCO- C ₆ H ₅
1.107	-CH ₂ C≡CH	-OCOCH ₂ C ₆ H ₅
1.108	-CH ₂ C≡CH	-OCOCH ₂ Cl
1.109	-CH ₂ C≡CH	-OCOCF ₃
1.110	-CH ₂ C≡CH	-OCOCH ₂ OCH ₃
1.111	-CH ₂ C≡CH	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂
1.112	-CH ₂ C≡CH	-O(CO)O CH ₂ CH ₃
1.113	-CH ₂ CN	-OH
1.114	-CH ₂ CN	-OCH ₃
1.115	-CH ₂ CN	-OCOCH ₃

Número do Composto	R ³	R ⁵
1.116	-CH ₂ CN	-OCOCH ₂ CH ₃
1.117	-CH ₂ CN	-OCOCH(C H ₃) ₂
1.118	-CH ₂ CN	-OCOC(C H ₃) ₃
1.119	-CH ₂ CN	-OCO- Ciclo - C ₃ H ₅
1.120	-CH ₂ CN	-OCO- C ₆ H ₅
1.121	-CH ₂ CN	-OCOCH ₂ C ₆ H ₅
1.122	-CH ₂ CN	-OCOCH ₂ Cl
1.123	-CH ₂ CN	-OCOCF ₃
1.124	-CH ₂ CN	-OCOCH ₂ OCH ₃
1.125	-CH ₂ CN	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂
1.126	-CH ₂ CN	-O(CO)O CH ₂ CH ₃
1.127	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OH
1.128	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCH ₃
1.129	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCOCH ₃
1.130	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCOCH ₂ CH ₃
1.131	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCOCH(C H ₃) ₂
1.132	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCOC(C H ₃) ₃
1.133	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCO- Ciclo - C ₃ H ₅
1.134	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCO- C ₆ H ₅
1.135	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCOCH ₂ C ₆ H ₅
1.136	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCOCH ₂ Cl
1.137	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCOCF ₃
1.138	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCOCH ₂ OCH ₃
1.139	-CH ₂ C ₆ H ₅	-OCON(C H ₃ CH ₂) ₂

Número do Composto	R ³	R ⁵
1.140	-CH ₂ C ₆ H ₅	-O(CO)O CH ₂ CH ₃

Tabela 2:

Tabela 2 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-cloro-4-fluorfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

5 Tabela 3:

Tabela 3 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-clorofenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 4:

10 Tabela 4 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 3,5-dicloro-2-metoxifenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 5:

15 Tabela 5 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2,3-diclorofenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 6:

20 Tabela 6 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2,4-diclorofenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 7:

Tabela 7 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2,5-diclorofenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

25 Tabela 8:

Tabela 8 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2,6-diclorofenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 9:

Tabela 9 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2,6-dicloro-4-trifluormetilfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

5 Tabela 10:

Tabela 10 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2,6-dietil-4-metilfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 11:

10 Tabela 11 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-fluorfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 12:

15 Tabela 12 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-metoxifenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 13:

20 Tabela 13 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-metilfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 14:

Tabela 14 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-trifluormetoxifenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

25 Tabela 15:

Tabela 15 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-trifluormetilfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 16:

30 Tabela 16 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2

são ambos hidrogênio, R^4 é 3-bromo-6-fluorfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 17:

5 Tabela 17 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2,3-dicloro-6-fluorfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 18:

10 Tabela 18 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-cloro-6-flúor-3-metilfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 19:

Tabela 19 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2,6-dicloro-4-trifluormetoxifenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

15 Tabela 20:

Tabela 20 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 6-cloro-2-trifluormetilfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 21:

20 Tabela 21 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-cloro-5-trifluormetilfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 22:

25 Tabela 22 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-cloro-5-fluorfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 23:

30 Tabela 23 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2,4-dicloro-5-fluorfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 24:

Tabela 24 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-metóxi-5-trifluormetoxifenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

5 Tabela 25:

Tabela 25 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2,3-dimetoxifenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 26:

10 Tabela 26 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-cloro-3-trifluormetilfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 27:

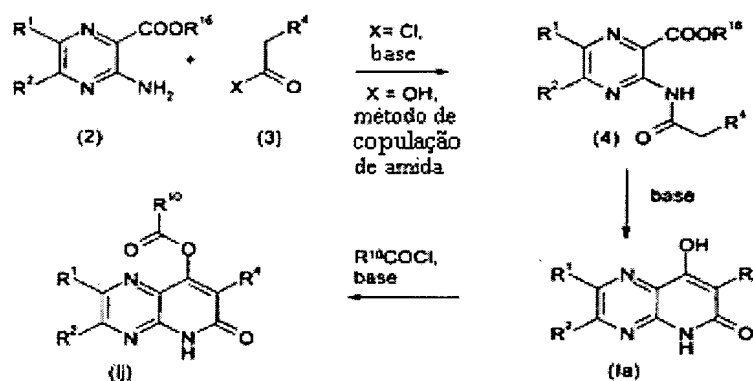
15 Tabela 27 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2-cloro-6-flúor-5-metilfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Tabela 28:

20 Tabela 28 fornece 140 compostos de Fórmula (I), onde R^1 e R^2 são ambos hidrogênio, R^4 é 2,4,6-trimetilfenil e R^3 e R^5 têm os valores listados na Tabela 1.

Os compostos da invenção podem ser feitos por uma variedade de métodos, por exemplo, pelos métodos descritos nos Esquemas 1 a 12.

Esquema 1



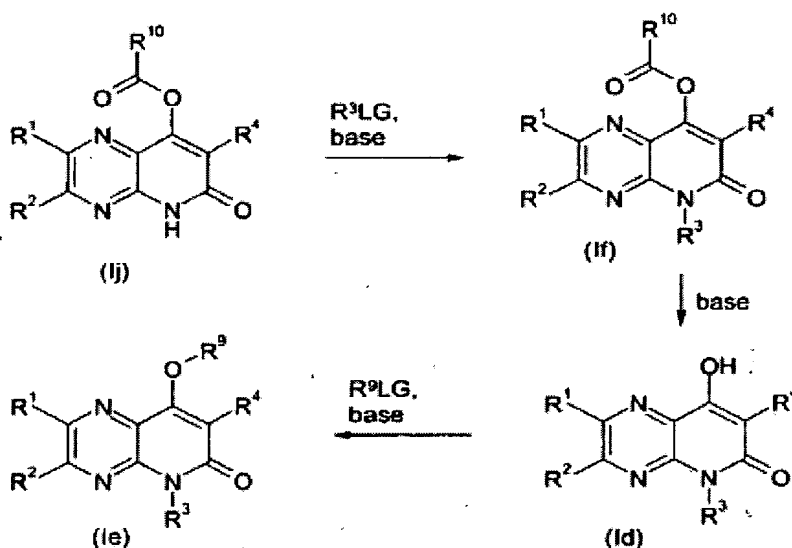
1) Compostos de fórmula (4), em que R^1 , R^2 e R^4 são conforme definido para os compostos de Fórmula (I), e R^{16} é alquil C_1 - C_6 , podem ser feitos pela reação de um éster aminopirazina de fórmula (2), em que R^1 e R^2 são conforme definido para os compostos de fórmula (I) e R^{16} é alquil C_1 - C_6 , com um derivado de ácido de fórmula (3), em que R^4 é conforme definido para os compostos de fórmula (I) e X é halogênio ou hidroxila, conforme demonstrado no Esquema 1. Por exemplo, se (3) for um cloreto de ácido (isto é, onde X é cloro), a reação pode ser convenientemente executada opcionalmente na presença de uma base, tal como trietilamina ou piridina, num solvente adequado, tal como acetonitrila ou diclorometano, opcionalmente usando aquecimento por microondas. Alternativamente, se (3) for um ácido carboxílico (isto é, onde X é hidróxi), a reação pode ser convenientemente executada usando um método de copulação de amida, por exemplo, pela reação com um agente de copulação, tal como cloreto bis(2-oxo-3-oxazolidinil(fosfínico)), na presença de uma base, tal como tiretilamina, num solvente adequado, tal como diclorometano, ou outros métodos de copulação de amida os quais tenham sido revistos em Tetrahedron (2005), 61 (46), 10827 – 10852.

2) Compostos de Fórmula (Ia), isto é, um composto de Fórmula (I), em que R^3 é hidrogênio e R^5 é hidroxila, podem ser preparados pelo tratamento de um composto de fórmula (4) conforme definido em 1) com uma base, tal como carbonato de potássio num solvente adequado, tal como

dimetilformamida, opcionalmente usando aquecimento por microondas, ou hexametildissilazida de lítio num solvente adequado, tal como tetraidrofurano.

3) Compostos de fórmula (Ij), isto é, um composto de Fórmula (I) em que R^3 é hidrogênio e R^5 é $-O-CO-R^{10}$, podem ser preparados pela reação de um composto de Fórmula (Ia) conforme definido em 2) com um cloreto de ácido de fórmula $R^{10}COCl$ ou um anidrido ácido de fórmula $(R^{10}CO)_2O$, em que R^{10} é conforme definido para os compostos de Fórmula (I), opcionalmente na presença de uma base, tal como trietilamina, opcionalmente num solvente adequado, tal como diclorometano.

Esquema 2



4) Compostos de Fórmula (If), isto é, um composto de fórmula (I), em que R^3 é conforme definido para o composto de Fórmula (I) diferente de hidrogênio e R^5 é $-O-CO-R^{10}$, podendo ser preparados a partir de um composto de Fórmula (Ij), conforme definido em 3) pela reação com um composto de fórmula R^3LG , em que R^3 é conforme definido para os compostos de fórmula (I) e LG é um grupo de saída, tal como um haleto, por exemplo, brometo ou iodeto, ou tosilato, mesilato ou triflato, na presença de uma base, tal como carbonato de potássio, num solvente adequado, tal como acetonitrila ou dimetilformamida, usando opcionalmente aquecimento por microondas, conforme mostrado no Esquema 2.

5) Compostos de Fórmula (Id), isto é, um composto de Fórmula (I) em que R^3 é conforme definido para os compostos de Fórmula (I) diferente de hidrogênio e R^5 é hidróxi, podendo ser preparados pelo tratamento de um composto de Fórmula (IF) conforme definido em 4) com uma base, tal como hidróxido de sódio ou carbonato de potássio, num solvente adequado, tal como metanol aquoso.

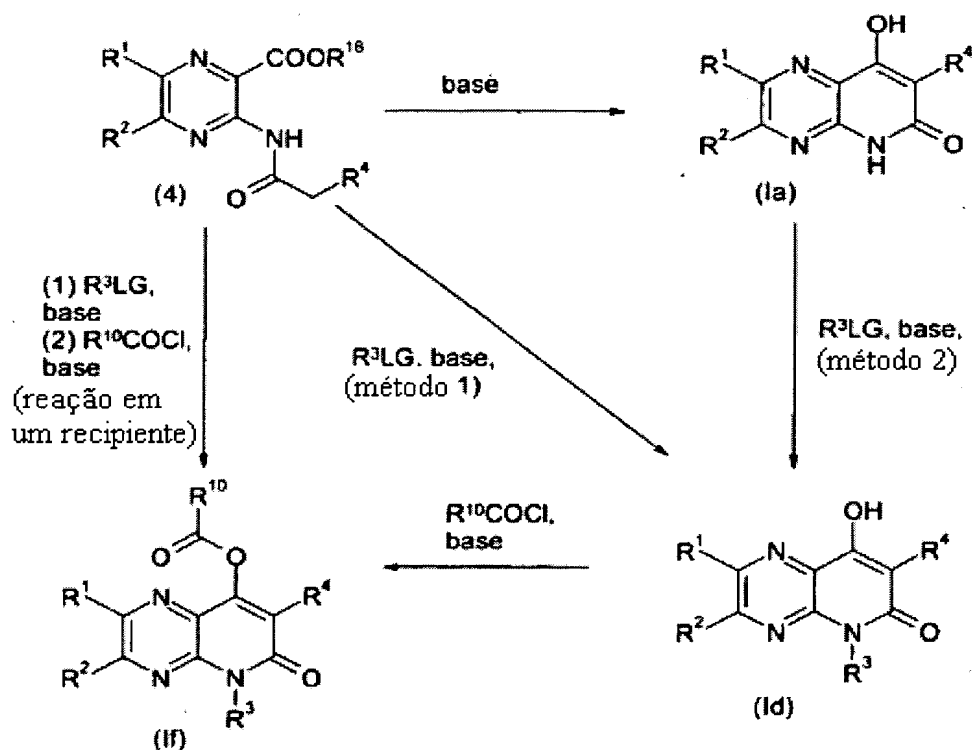
6) Compostos de Fórmula (Ie), isto é, compostos de Fórmula (I) em que R^3 é conforme definido para o composto de Fórmula (I) diferente de hidrogênio e R^5 é $-O-R^9$, podendo ser preparados a partir de um composto de Fórmula (Id) conforme definido em 5) pela reação com um composto de fórmula R^9LG , em que R^9 é conforme definido para os compostos de Fórmula (I) e LG é um grupo de saída tal como haleto, por exemplo, brometo ou iodeto, ou tosilato, mesilato ou triflato, na presença de uma base, tal como carbonato de potássio, num solvente adequado, tal como dimetilformamida.

Esquema 3



7) Onde ocorre de R^3 e R^9 serem idênticos, por exemplo, ambos são grupos alquil simples, compostos de Fórmula (Ie) conforme definido em 6) também podem ser formados pela reação de um composto de fórmula (Ia) conforme definido em 2) com pelo menos dois equivalentes de um composto de Fórmula R^3LG , conforme definido em 4), na presença de uma base, tal como carbonato de potássio, num solvente adequado, tal como dimetilformamida, conforme apresentado No Esquema 3.

Esquema 4



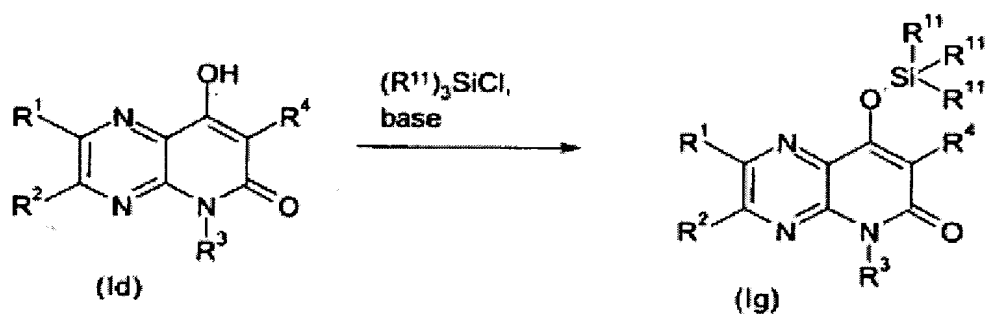
8) Compostos de Fórmula (IF), conforme definido em 4), podem ser adicionalmente preparados numa via encurtada diretamente a partir de um composto de Fórmula (4) conforme definido em 1) pela reação com um composto de Fórmula R^3LG conforme definido em 4), na presença de uma base, tal como hexametildissilazida de sódio ou potássio, num solvente adequado, tal como tetraidrofurano, opcionalmente usando aquecimento por microondas, seguido pela reação com um cloreto de ácido de fórmula R^{10}COCl ou um anidrido de ácido de Fórmula $(\text{R}^{10}\text{CO})_2\text{O}$ conforme definido em 3), opcionalmente na presença de uma base, tal como trietilamina, no mesmo recipiente reacional, conforme demonstrado no Esquema 4.

9) Alternativamente, compostos de Fórmula (IF), conforme definido em (4), podem ser feitos a partir dos compostos de Fórmula (Id) conforme definido em 5), pela reação com um cloreto de ácido de fórmula R^{10}COCl ou um anidrido ácido de Fórmula $(\text{R}^{10}\text{CO})_2\text{O}$, conforme definido em 3), opcionalmente na presença de uma base, tal como trietilamina.

10) Compostos de Fórmula (Id), conforme definido em 5), podem ser feitos pela reação de um composto de Fórmula (4) conforme definido em 1) com um composto de Fórmula R^3LG conforme definido em 4), na presença de uma base, tal como hexametildissilazida de potássio, num solvente adequado, tal como tetraidrofurano, opcionalmente usando aquecimento por microondas (Método 1).

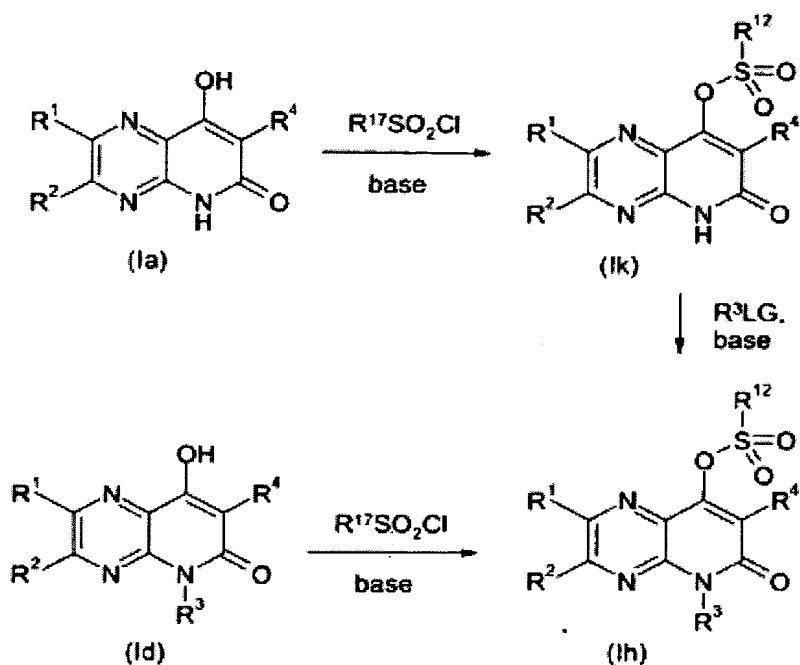
11) Compostos de Fórmula (Id), conforme definido em 5), podem também ser feitos a partir de um composto de Fórmula (Ia), conforme definido em 2), pela reação com um composto de Fórmula R^3LG , conforme definido em 4), na presença de uma base, tal como hexametildissilazida de potássio, num solvente adequado, tal como tetraidrofurano, opcionalmente usando aquecimento por microondas (Método 2). A síntese dos compostos de Fórmula (Ia) foi descrita em 2).

Esquema 5



12) Compostos silila de Fórmula (Ig), isto é, um composto de Fórmula (I), em que R^3 é conforme definido para o composto de Fórmula (I) diferente de hidrogênio e R^5 é $-\text{O}-\text{Si}(\text{R}^{11})_3$, pode ser feito a partir de um composto de Fórmula (Id), conforme definido em 5), pela reação com um cloreto de trialquilsilila de Fórmula $(\text{R}^{11})_3\text{SiCl}$, num solvente adequado, tal como tetraidrofurano ou acetonitrila, na presença de uma base, tal como trietilamina, conforme demonstrado no Esquema 5.

Esquema 6



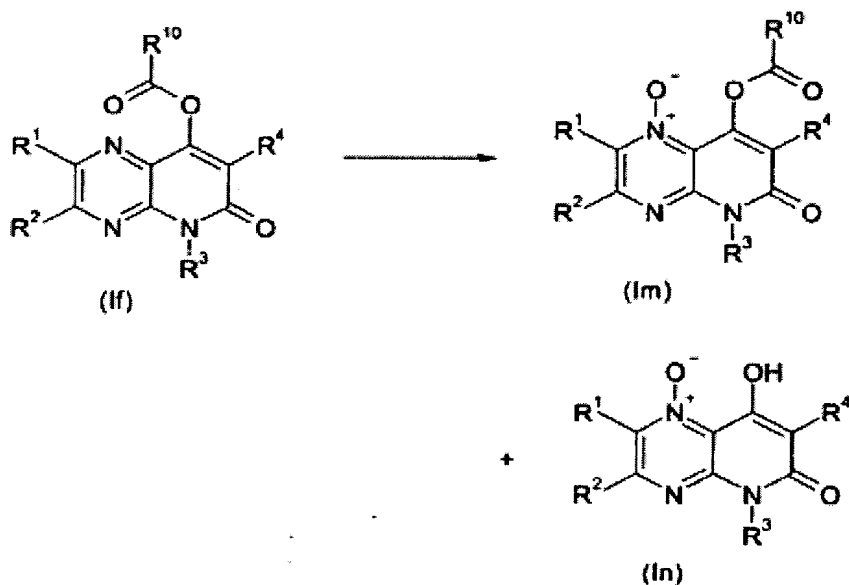
13) Compostos sulfonila de Fórmula (Ik), isto é, um composto de Fórmula (I), em que R³ é hidrogênio e R⁵ é -O-SO₂-R¹², podem ser feitos a partir de um composto de Fórmula (Ia) conforme definido em 2) pela reação com um composto de Fórmula R¹²SO₂Cl, em que R¹² é conforme definido para os compostos de Fórmula (I), na presença de uma base, tal como trietilamina, num solvente adequado, tal como tetraidrofurano ou diclorometano, conforme mostrado no Esquema 6.

14) Compostos sulfonila de Fórmula (Ih), isto é, um composto de Fórmula (I) em que R³ é conforme definido para os compostos de Fórmula (I) diferentes de hidrogênio e R⁵ é -O-SO₂-R¹², podem ser feitos pela reação de um composto de Fórmula (Ik) conforme definido em 13), com um composto de Fórmula R³LG conforme definido em 4), na presença de uma base, tal como hexametildissilazida de sódio ou potássio, num solvente adequado, tal como tetraidrofurano, opcionalmente usando aquecimento por microondas.

15) Alternativamente, compostos de Fórmula (Ih) conforme

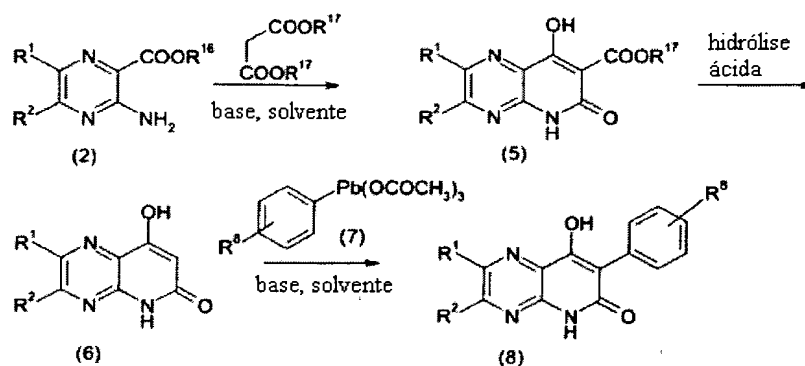
definido em 14) podem ser feitos pela reação de um composto de Fórmula (Id) conforme definido em 5) com um composto de Fórmula $R_{12}SO_2Cl$, conforme definido em 13), na presença de uma base, tal como trietilamina, num solvente adequado, tal como tetraidrofurano ou diclorometano.

5 Esquema 7



16) Uma mistura de N-óxidos de Fórmula (Im), isto é, compostos de Fórmula (I), em que o 5-nitrogênio é oxidado, R^3 é conforme definido para os compostos de Fórmula (I) diferentes de hidrogênio e R^5 é $-O-CO-R^{10}$, e N-óxidos de Fórmula (In), isto é, compostos de Fórmula (I) em que o 5-nitrogênio é oxidado, R^3 é conforme definido para os compostos de Fórmula (I) diferentes de hidrogênio e R^5 é hidróxi, podem ser feitos pela reação de um composto de Fórmula (If) conforme definido em 4), com um perácido, tal como ácido pertrifluoracético, gerado in situ, por exemplo, por anidrido trifluoracético e peróxido de hidrogênio em pelotas de uréia, num solvente adequado, tal como diclorometano, conforme mostrado no Esquema 7.

Esquema 8



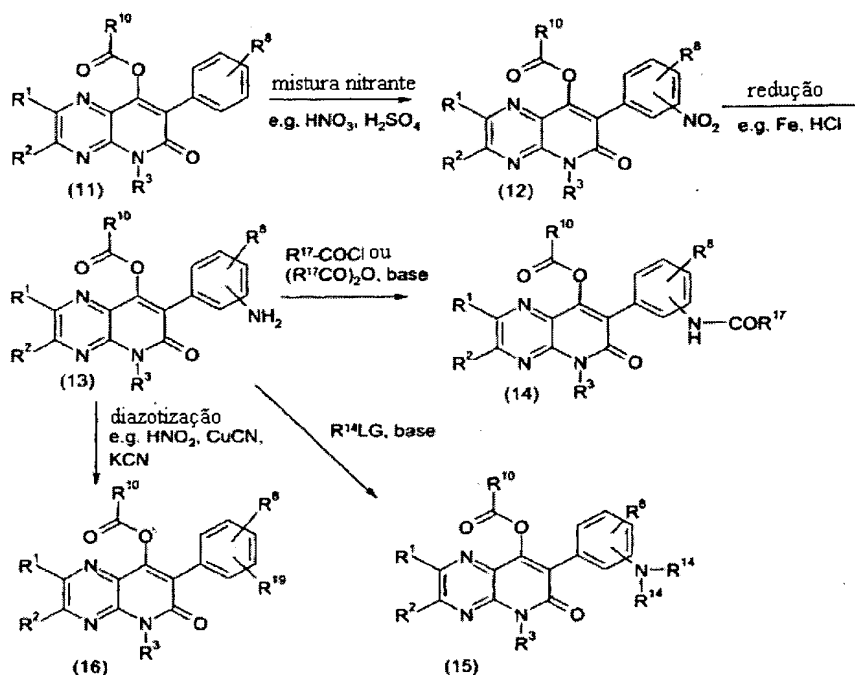
17) Compostos de Fórmula (5), em que R^1 e R^2 são conforme definido para os compostos de fórmula (I) e R^{17} é alquil C_1C_6 podem ser feitos pela reação de um éster de aminopirazina de fórmula (2) conforme definido em 1) com um malonato de dialquila de fórmula $CH_2(CO_2R^{17})_2$, em que R^{17} é alquil C_1-C_6 na presença de uma base, tal como metóxido de sódio, num solvente adequado, tal como metanol, numa temperatura de 25 °C até o refluxo, preferivelmente em refluxo, conforme mostrado no Esquema 8.

18) Compostos de Fórmula (6), em que R^1 e R^2 são conforme definido para os compostos de Fórmula (I), podem ser feitos pela hidrólise e descarboxilação de um composto de fórmula (5) conforme definido em 17) pelo tratamento com ácido aquoso forte, por exemplo, ácido clorídrico concentrado, ou alternativamente pelo tratamento com ácido aquoso diluído, por exemplo, ácido clorídrico aquoso, num solvente adequado, tal como etanol, opcionalmente num reator de microondas.

19) Compostos de Fórmula (8), em que R^1 , R^2 e R^8 são conforme definido para os compostos de Fórmula (I), podem ser feitos pela reação de um composto de Fórmula (6) conforme definido em 18) com um composto precedente de Fórmula (7), em que R^8 é conforme definido para os compostos de Fórmula (I), na presença de uma base, tal como 4-dimetilaminopiridina, e num solvente adequado, tal como dimetilsulfóxido. Compostos precedentes (7) são conhecidos na literatura e podem ser feitos pelos métodos de J. T. Pinhey, B. A. Rowe, Aust. J. Chem., 1979, 32, 1561-6;

J. Morgan, J. T. Pinhey, J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 ; 1990, 3, 715-20).

Esquema 9



20) Compostos nitro de Fórmula (12), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^8 e R^{10} são conforme definido para os compostos de Fórmula (I), podem ser feitos pela nitração de um composto de Fórmula (11), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^8 e R^{10} são conforme definido para os compostos de Fórmula (I), com uma mistura de nitração, por exemplo, usando ácido nítrico fumegante e ácido sulfúrico concentrado, conforme demonstrado no Esquema 9.

21) Amino compostos de Fórmula (13), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^8 e R^{10} são conforme definido para os compostos de Fórmula (I), podem ser feitos pela redução de um composto de Fórmula (12), conforme definido em 20), usando condições de redução padrões, por exemplo, fragmentos de ferro em ácido clorídrico aquoso.

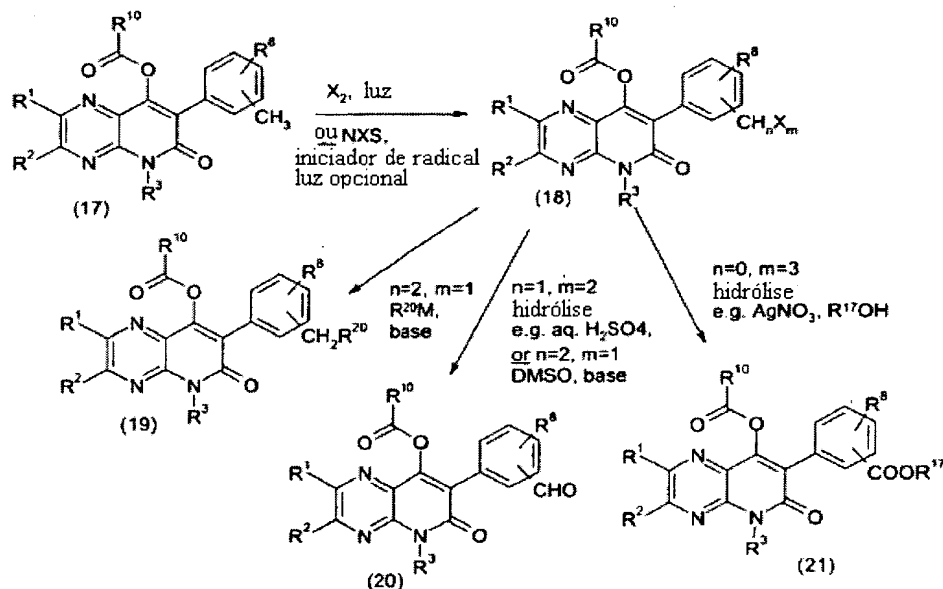
22) Compostos acilados de Fórmula (14), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^8 e R^{10} são conforme definido para os compostos de Fórmula (I) e R^{17} - é conforme definido em 17), podem ser feitos pela acilação e um composto de Fórmula (13), conforme definido em 21), por exemplo, pela reação com um

cloreto de ácido de Fórmula $R^{17}COCl$ ou um anidrido ácido $(R^{17}CO)_2O$, em que R^{17} é conforme definido em 21), na presença de uma base, tal como trietilamina, num solvente adequado, tal como diclorometano.

23) Compostos alquilados de Fórmula (15), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^8 e R^{10} são conforme definido para os compostos de Fórmula (I) e R^{14} é alquil C_1-C_6 , podem, ser feitos pela alquilação de um composto de Fórmula (13) conforme definido em 21), por exemplo, pela reação com um composto de Fórmula $R^{14}LG$, em que R^{14} é alquil C_1-C_6 e LG é um grupo de saída tal como brometo ou mesilato, opcionalmente na presença de uma base, tal como carbonato de potássio, num solvente adequado, tal como etanol ou tolueno.

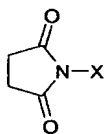
24) Compostos de Fórmula (16), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^8 e R^{10} são conforme definido para os compostos de Fórmula (I) e R^{19} é ciano, alquiltio C_1-C_4 , halo ou hidróxi, podem ser feitos pela reação de um composto de Fórmula (13), conforme definido em 21), pela diazotização, por exemplo, pela reação com um nitrito de alquila, na presença de um nucleófilo adequado, por exemplo, cianeto de potássio, na presença de um sal de cobre, por exemplo, cianeto cuproso, num solvente adequado, tal como acetonitrila.

Esquema 10



25) Compostos de haloalquila, de fórmula (18), em que R^1 , R^2 ,

R^3 , R^8 e R^{10} são conforme definido para os compostos de Fórmula (I), X é um halogênio e $n + m = 3$, podem ser feitos pela reação dos compostos de Fórmula (17) com um agente de halogenação, tal como o halogênio de Fórmula X_2 , em que X é cloro ou bromo, na presença de luz, ou uma N-halossuccinimida de fórmula



em que X é cloro, bromo ou iodo, na presença de um iniciador de radical, tal como peróxido de benzoíla, num solvente adequado, tal como tetracloreto de carbono, e opcionalmente na presença de uma fonte de luz, tal como uma lâmpada de tungstênio-halogênio de 500 watt, em refluxo conforme mostrado no Esquema 10.

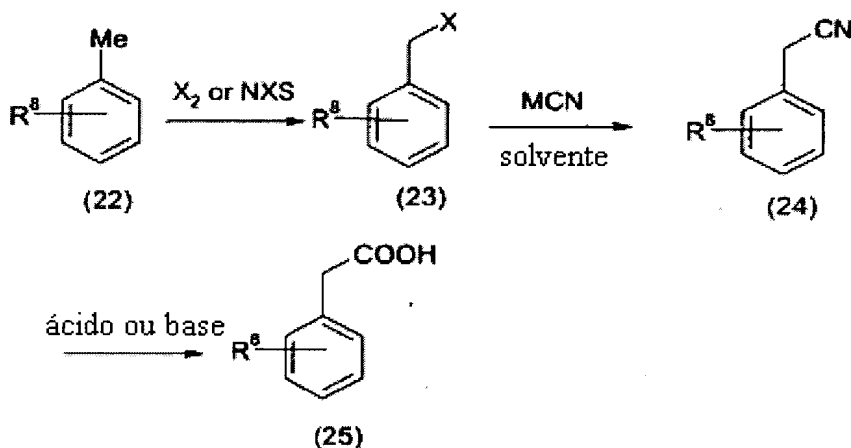
26) Compostos de fórmula (19), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^8 e R^{10} são conforme definido para os compostos de Fórmula (I), e R^{20} é alcóxi C_1-C_8 , tioalcóxi C_1-C_8 , fenóxi opcionalmente substituído, tiofenóxi opcionalmente substituído, ciano, hidróxi, alquilamino C_1-C_4 ou di(alquil C_1-C_4)amino, podem ser feitos pela reação de um composto de Fórmula (18) conforme definido em 25), em que $n = 2$ e $m = 1$, com um composto de Fórmula $R^{20}H$, em que R^{20} é alcóxi C_1-C_8 , tioalcóxi C_1-C_8 , fenóxi opcionalmente substituído, tiofenóxi opcionalmente substituído, uma mono-(alquil C_1-C_4)amina ou uma di(alquil C_1-C_4)amina, na presença de uma base, tal como carbonato de potássio ou hidreto de sódio, num solvente adequado tal como etanol ou dimetilformamida, ou com um composto de Fórmula $R^{20}M$, em que R^{20} é ciano e M é um metal, tal como cianeto de sódio, ou em que R^{20} é hidróxi e M é um metal, tal como hidróxido de sódio num solvente adequado, tal como etanol ou dimetilformamida.

27) Compostos de Fórmula (20), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^8 e R^{10} são conforme definido para os compostos de Fórmula (I), podem ser feitos a

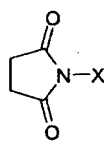
partir de um composto de Fórmula (18) conforme definido em 25), em que $n = 1$ e $m = 2$, por hidrólise com um ácido, por exemplo, ácido sulfúrico aquoso, ou a partir dos compostos de Fórmula (20), onde $n = 2$ e $m = 1$, pela reação com dimetilsulfóxido na presença de uma base, tal como carbonato de potássio.

28) Compostos de Fórmula (21), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^8 e R^{10} são conforme definido para os compostos de Fórmula (I), e R^{17} é conforme definido em 17), podem ser feitos a partir de um composto de fórmula (18) conforme definido em 25), onde $n = 0$ e $m = 3$, por hidrólise com um álcool de fórmula $R^{17}OH$, em que R^{17} é conforme definido em 17), opcionalmente na presença de um sal de prata, tal como nitrato de prata.

Esquema 11



29) Em certos casos onde ácidos arilacéticos não são comercialmente disponíveis, é necessário fazê-los. Uma síntese típica é mostrada no Esquema 11. Haletos de benzila de fórmula (23), em que R^8 é conforme definido para os compostos de fórmula (I) e X é halogênio, podem ser feitos a partir de um tolueno substituído de fórmula (22), em que R^8 é conforme definido para os compostos de fórmula (I), com um agente de halogenação, tal como o halogênio de fórmula X_2 , em que X é cloro ou bromo, na presença de luz, ou uma halossuccinimida de fórmula



em que X é cloro, bromo ou iodo, na presença de um iniciador de radical, tal como peróxido de benzoíla, num solvente adequado, tal como tetracloreto de carbono, e opcionalmente na presença de uma fonte de luz, tal como uma lâmpada tungstênio-halogênio de 500 watt, sob refluxo.

5 30) Cianetos de benzila de fórmula (24), em que R^8 é conforme definido para os compostos de fórmula (I), podem ser feitos pela reação de um composto de fórmula (23) conforme definido em 29) com um cianeto metálico, tal como cianeto de potássio, num solvente adequado, tal como etanol, sob refluxo.

10 31) Ácidos fenilacéticos de fórmula (25), em que R^8 é conforme definido para os compostos de fórmula (I), podem ser feitos pela reação de um composto de fórmula (24), conforme definido em 30) por hidrólise usando ácido ou álcali aquoso, porém preferivelmente ácido aquoso, tal como ácido sulfúrico aquoso, em refluxo.

15 Os compostos de fórmula (I) de acordo com a invenção podem ser usados como herbicidas na forma não-modificada, conforme obtidos na síntese, porém eles são geralmente formulados em composições herbicidas de várias formas usando adjuvantes de formulação, tais como veículos, solventes e substâncias ativas de superfície. As formulações podem estar em várias
20 formas físicas, por exemplo, na forma de pós para a pele, géis, pós umedecíveis, grânulos dispersáveis em água, comprimidos dispersáveis em água, pelotas efervescentes, concentrados emulsificáveis, concentrados microemulsificáveis, emulsões óleo-em-água, substâncias que fluem em óleo, dispersões aquosas, dispersões oleosas, suspoemulsões, suspensões em
25 cápsula, grânulos emulsificáveis, líquidos solúveis, concentrados solúveis em água (com água ou um solvente orgânico miscível em água como veículo), filmes de polímero impregnados ou em outras formas conhecidas, por

exemplo, do Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5ª Edição, 1999. Tais formulações podem ou ser usadas diretamente ou elas são diluídas antes do uso. As diluições podem, por exemplo, ser feitas com água, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, óleo ou solventes.

As formulações podem ser preparadas, por exemplo, pela mistura do ingrediente ativo com os adjuvantes de formulação para obter composições na forma de sólidos finamente divididos, grânulos, soluções, dispersões ou emulsões. Os ingredientes ativos também podem ser formulados com outros adjuvantes, tais como sólidos finamente divididos, óleos minerais, óleos de origem vegetal ou animal, óleos modificados de origem vegetal ou animal, solventes orgânicos, água, substâncias ativas de superfície ou suas combinações. Os ingredientes ativos também podem estar contidos em microcápsulas muito finas consistindo de um polímero. Microcápsulas contêm os ingredientes ativos num carreador poroso. Isso permite que os ingredientes ativos sejam liberados no ambiente em quantidades controladas (por exemplo, de lenta liberação). Microcápsulas geralmente têm um diâmetro de 0,1 a 500 microns. Elas contêm ingredientes ativos numa quantidade de cerca de 25 a 95% em peso do peso da cápsula. Os ingredientes ativos podem estar na forma de um sólido monolítico, na forma de partículas finas na dispersão sólida ou líquida ou na forma de uma solução adequada. As membranas encapsulantes compreendem, por exemplo, borrachas naturais ou sintéticas, celulose, copolímeros de estireno/butadieno, poliacrilonitrila, poliacrilato, poliésteres, poliamidas, poliuréias, poliuretano ou polímeros quimicamente modificados e xantatos de amido ou outros polímeros que são conhecidos pela pessoa versada na técnica em relação a isto. Alternativamente, microcápsulas muito finas podem ser formadas, nas quais o ingrediente ativo está contido na forma de partículas finamente divididas numa matriz sólida da substância de base, porém as microcápsulas não são por si só encapsuladas.

Os adjuvantes de formulação que são adequados para a preparação das composições de acordo com a invenção são conhecidos per se. Como carreadores líquidos, podem ser usados: água, tolueno, xileno, éter de petróleo, óleos vegetais, acetona, metiletilcetona, cicloexanona, anidridos de

5 ácido, acetonitrila, acetofenona, acetato de amila, 2-butanona, carbonato de butileno, clorobenzeno, cicloexano, cicloexanol, ésteres de alquila do ácido acético, álcool diacetona, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, p-dietilbenzeno, dietileno glicol, dietileno glicol abietato, éter butílico de dietilenoglicol, éter

10 etílico de dietilenoglicol, éter metílico de dietilenoglicol, N,N-dimetilformamida, sulfóxido de dimetila, 1,4-dioxano, dipropilenoglicol, éter metílico de dipropilenoglicol, dibenzoato de dipropilenoglicol, diproxitol, alquilpirrolidona, acetato de etila, 2-etilexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-tricloroetano, 2-heptanona, alfa-pineno, d-limoneno, lactato de etila,

15 etilenoglicol, éter butílico de etilenoglicol, éter metílico de etilenoglicol, gama-butirolactona, glicerol, acetato de glicerol, diacetato de glicerol, triacetato de glicerol, hexadecano, hexilenoglicol, acetato de isoamila, acetato de isobonila, isoctano, isoforona, isopropilbenzeno, miristato de isopropila, ácido láctico, laurilamina, óxido de mesitila, metoxipropanol, metilisoamilcetona, metilisobutilcetona, laurato de metila, octanoato de

20 metila, oleato de metila, cloreto de metileno, m-xileno, n-hexano, n-octilamina, ácido octadecanóico, acetato de octilamina, ácido oléico, oleilamina, o-xileno, fenol, polietilenoglicol (PEG400), ácido propiônico, lactato de propila, carbonato de propileno, propilenoglicol, éter metílico de propilenoglicol, p-xileno, tolueno, trietilfosfato, trietilenoglicol, ácido

25 xilenossulfônico, parafina, óleo mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etila, acetato de amila, acetato de butila, éter metílico de propilenoglicol, éter metílico de dietilenoglicol, metanol, etanol, isopropanol, e alcoóis de peso molecular superior, tais como álcool amílico, álcool tetraidrofurfurílico, hexanol, octanol, etilenoglicol, propilenoglicol, glicerol,

30 N-metil-2-pirrolidona e semelhantes. Água é geralmente o veículo de escolha

para diluir os concentrados. Veículos sólidos adequados são, por exemplo, talco, dióxido de titânio, barro de pirofilita, sílica, barro de atapulgita, kieselguhr, calcário, carbonato de cálcio, bentonita, montmorilonita de cálcio, cascas de semente de algodão, farinha de trigo, farinha de soja, pedra-pomes, pó fino de madeira, cascas de noz trituradas, lignina e substâncias similares, conforme descrito, por exemplo, em CFR 180.1001. (c) & (d).

Uma grande quantidade de substâncias de superfície ativa pode ser vantajosamente usada tanto em formulações sólidas quanto em formulações líquidas, especialmente naquelas formulações as quais possam ser diluídas com um veículo antes do uso. Substâncias ativas de superfície podem ser aniônicas, catiônicas, não-iônicas ou poliméricas e elas podem ser usadas como emulsificantes, agentes umidificantes ou agentes suspensores ou para outros propósitos. Substâncias ativas de superfície típicas incluem, por exemplo, sais de sulfatos de alquila, tais como laurilsulfato de dietanolamônio; sais de alquilarilsulfonatos, tais como dodecilbenzenossulfonato de cálcio; produtos de adição de alquilfenol/óxido de alquilenos, tal como nonilfenol etoxilado; produtos de adição de álcool/óxido de alquilenos, tais como álcool tridecílico etoxilado; sabões, tal como estearato de sódio; sais de alquilnaftalenossulfonatos, tal como butilnaftalenossulfonato de sódio; ésteres dialquílicos de sais de sulfossuccinato, tal como di(2-etilexil)sulfossuccinato de sódio; ésteres de sorbitol, tal como oleato de sorbitol; aminas quaternárias, tal como cloreto de lauriltrimetilamônio, ésteres de polietilenoglicol de ácidos graxos, tal como estearato de polietilenoglicol; copolímeros em bloco de óxido de etileno e óxido de propileno; e sais de ésteres de mono- e dialquifosfato; e também outras substâncias descritas, por exemplo, em "McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp., Ridgewood, Nova Jérsei, 1981.

Outros adjuvantes que podem ser geralmente usados em formulações pesticidas incluem inibidores de cristalização, modificadores de viscosidade, agentes suspensores, corantes, antioxidantes, agentes

espumantes, absorvedores de luz, adjuvantes de mistura, antiespumantes, agentes complexantes, substâncias neutralizantes ou modificadoras de pH e tampões, inibidores de corrosão, fragrâncias, agentes umidificantes, intensificadores de absorção, micronutrientes, pastificantes, deslizantes, lubrificantes, dispersantes, espessantes, anticongelantes, microbicidas e também fertilizantes líquidos e sólidos.

As composições de acordo com a invenção podem incluir adicionalmente um aditivo compreendendo um óleo de origem vegetal ou animal, um óleo mineral, ésteres alquílicos de tais óleos ou misturas de tais óleos e derivados de óleo. A quantidade de aditivo de óleo na composição de acordo com a invenção é geralmente de 0,01 a 10%, baseando-se na mistura de borrifo. Por exemplo, o aditivo de óleo pode ser adicionado ao tanque de pulverização na concentração desejada depois da mistura de borrifo ter sido preparada. Aditivos de óleo preferidos compreendem óleos minerais ou um óleo de origem vegetal, por exemplo, óleo de semente de colza, óleo de oliva ou óleo de girassol, óleo vegetal emulsificado, tal com AMIGO® (Rhône-Poulenc Canada Inc.), ésteres alquílicos de óleos de origem vegetal, por exemplo, os metil derivados, ou um óleo de origem animal, tal como óleo de peixe ou sebo de boi. Um aditivo preferido contém, por exemplo, como componentes ativos, essencialmente 80% em peso de ésteres alquílicos de óleos de peixe e 15% em peso de óleo de semente de colza metilado, e também 5% em peso de emulsificantes habituais e modificadores de pH. Aditivos oleosos especialmente preferidos compreendem ésteres alquílicos de ácidos graxos C₈-C₂₂, especialmente os derivados metílicos de ácidos graxos C₁₂-C₁₈, por exemplo, os ésteres metílicos do ácido láurico, ácido palmítico e ácido oléico, sendo de importância. Aqueles ésteres são conhecidos como laurato de metila (CAS-11-82-0), palmitato de metila (CAS-112-39-0) e oleato de metila (CAS-112-62-9). Um derivado de éster metílico do ácido graxo preferido é Emery® 2230 e

2231 (Cognis GmbH). Aqueles e outros derivados de óleo também são conhecidos a partir do Compendium of Herbicide Adjuvants, 5ª Edição, Southern Illinois University, 2000.

5 A aplicação e ação dos aditivos oleosos podem ser ainda
melhorados pela combinação com substâncias ativas de superfície, tais como
tensoativos não-iônicos, aniônicos ou catiônicos. Exemplos de tensoativos
aniônicos, não-iônicos e catiônicos estão listados nas páginas 7 e 8 de WO
97/34485. Substâncias ativas de superfície preferidas são tensoativos
aniônicos do tipo dodecilbenzilsulfonato, especialmente os seus sais de cálcio,
10 e também tensoativos não-iônicos do tipo álcool graxo etoxilado. Preferência
especial é dada aos alcoóis graxos C₁₂-C₂₂ etoxilados com um grau de
etoxilação de 5 a 40. Exemplos de tensoativos comercialmente disponíveis
são os tios Genapol (Clariant AG). Também são preferidos os tensoativos de
silicone, especialmente heptametiltriloxanos modificados com óxido de
15 polialquila, os quais são comercialmente disponíveis, por exemplo, como
Silwet L-77®, e também tensoativos perfluorados. A concentração de
substâncias ativas de superfície em relação ao aditivo total é geralmente de 1
a 30% em peso. Exemplos de aditivos oleosos consistindo de misturas de óleo
ou de óleos minerais ou seus derivados com tensoativos são Edenor ME SU®,
20 Turbocharge® (Syngenta AG, CH) ou ActipronC (BP Oil UK Limited, Grã-
Bretanha).

Caso desejado, também é possível para as substâncias ativas de superfície mencionadas serem usadas nas formulações por si só, em outras palavras, sem aditivos oleosos.

25 Além disso, a adição de um solvente orgânico à mistura
aditivo oleoso/tensoativo pode contribuir para uma intensificação de ação
adicional. Solventes adequados são, por exemplo, Solvesso® (ESSO) ou
Aromatic Solvent® (Exxon Corporation). A concentração de tais solventes
pode ser de 10 a 80% em peso do peso total. Aditivos oleosos que estão
30 presentes em mistura com solventes estão descritos, por exemplo, em US-A-

4.834.908. Um aditivo oleoso comercialmente disponível ali revelado é conhecido pelo nome MERGE® (BASF Corporation). Um outro aditivo oleoso que é preferido de acordo com a invenção é SCORE® (Syngenta Crop Protection Canada).

5 Além dos aditivos oleosos listados acima, para o propósito de intensificar a ação das composições de acordo com a invenção, também é possível para as formulações de alquilpirrolidonas (por exemplo, Agrimax®) a serem adicionadas à mistura de borriço. Formulações de treliças sintéticas, por exemplo, poliacrilamida, 10 compostos polivinílicos de poli-1-p-menteno (por exemplo, Bond®, Courier® ou Emerald®) também podem ser usadas. Também é possível para as soluções que contêm ácido propiônico, por exemplo, Eurogkem Pen-e-trate®, serem adicionadas à mistura de borriço como agente intensificador de ação.

15 As composições herbicidas geralmente compreendem de 0,1 a 99% em peso, especialmente de 0,1 a 95% em peso de compostos de fórmula (I) e de 1 a 99,9% em peso de uma formulação adjuvante a qual inclui preferivelmente de 0 a 25% em peso de uma substância ativa de superfície. Enquanto produtos comerciais serão preferivelmente 20 formulados como concentrados, o usuário final irá normalmente empregar formulações diluídas.

 As taxas de aplicação dos compostos de fórmula (I) podem variar dentro de amplos limites e depender da natureza do solo, do método de aplicação (pré- ou pós-aparecimento; adubo de semente; aplicação do sulco da semente; sem 25 aplicação para agricultura, etc.), da planta da safra, do capim ou erva daninha a ser controlada, das condições climáticas prevaescentes e de outros fatores governados pelo método de aplicação, pelo tempo de aplicação e pela safra alvo. Os compostos de fórmula (I) de acordo com a invenção são geralmente aplicados numa taxa de 10 a 2000 g/ha, especialmente de 50 a 1000 g/ha.

Formulações preferidas têm especialmente as seguintes composições (% = porcentagem em peso):

Concentrados emulsificáveis:

	Ingrediente ativo:	1 a 95%, preferivelmente de 60 a 90%
5	Agente ativo de superfície:	1 a 30%, preferivelmente de 5 a 20%
	Veículo líquido:	1 a 80%, preferivelmente de 1 a 35%
	<u>Pós:</u>	
	Ingrediente ativo:	0,1 a 10%, preferivelmente de 0,1 a 5%
	Veículo sólido:	99,9 a 90%, preferivelmente de 99,9 a 99%

10 Concentrados de suspensão:

	Ingrediente ativo:	5 a 75%, preferivelmente 10 a 50%
	Água:	94 a 24%, preferivelmente 88 a 30%
	Agente ativo de superfície:	1 a 40%, preferivelmente 2 a 30%

Pós umedecíveis:

15	Ingrediente ativo:	0,5 a 90%, preferivelmente 1 a 80%
	Agente ativo de superfície:	0,5 a 20%, preferivelmente 1 a 15%
	Veículo sólido:	5 a 95%, preferivelmente 15 a 90%

Grânulos:

	Ingrediente ativo:	0,1 a 30%, preferivelmente 0,1 a 15%
20	Veículo sólido:	99,5 a 70%, preferivelmente 97 a 85%

Os exemplos a seguir ainda ilustram, porém não limitar, a invenção.

Exemplos de formulação para herbicidas de fórmula (I) (% = % em peso)

<u>F1. Concentrados emulsificáveis</u>	a)	b)	c)	d)
Ingrediente ativo	5%	10%	25%	50%
Dodecilbenzenossulfonato de cálcio	6%	8%	6%	8%
Éter poliglicólico de óleo de castóreo (36 mol de óxido de etileno)	4%	-	4%	4%
Éter poliglicólico de octilfenol (7 – 8 mol de óxido de etileno)	-	4%		2%
NMP	-	-	10%	20%
Mistura de hidrocarbonetos aromáticos C ₉ – C ₁₂				

Emulsões de qualquer concentração desejada podem ser

obtidas a partir de tais concentrados através de diluição com água.

<u>F2. Soluções</u>	a)	b)	c)	d)
Ingrediente ativo	5%	10%	50%	90%
1-metóxi-3-(3-metoxipropóxi)-propano	-	20%	20%	-
Polietilenoglicol PM 400	20%	10%	-	-
NMP	-	-	30%	10%
Mistura de hidrocarbonetos aromáticos C ₉ -C ₁₂	75%	60%	-	-

As soluções são adequadas para uso na forma de microgotículas.

<u>F3. Pós umedecíveis</u>	a)	b)	c)	d)
Ingrediente ativo	5%	25%	50%	80%
Lignossulfonato de sódio	4%	-	3%	-
Laurilsulfato de sódio	2%	3%	-	4%
Diisobutilnaftalenossulfonato de sódio	-	6%	5%	6%
Éter octilfenolpoliglicólico (7 – 8 mol de óxido de etileno)	-	1%	2%	-
Ácido silicílico altamente disperso	1%	3%	5%	10%
Caulim	88%	62%	35%	-

5 O ingrediente ativo é misturado completamente com os adjuvantes e a mistura é completamente moída num moinho adequado, produzindo pós umedecíveis os quais podem ser diluídos com água para proporcionar suspensões de qualquer concentração desejada.

<u>F4. Grânulos revestidos</u>	a)	b)	c)
Ingrediente ativo	0,1%	5%	15%
Ácido silícico altamente disperso	0,9%	2%	2%
Carreador inorgânico (diâmetro de 0,1 a 1 mm), por exemplo, CaCO ₃ ou SiO ₂	99,0%	93%	83%

10 O ingrediente ativo é dissolvido em cloreto de metileno e aplicado ao veículo por pulverização, e o solvente é, a seguir, removido por evaporação in vacuo.

<u>F5. Grânulos revestidos</u>	a)	b)	c)
Ingrediente ativo	0,1%	5%	15%
Polietilenoglicol PM 200	1,0%	2%	3%
Ácido silícico altamente disperso	0,9%	1%	2%
Veículo inorgânico (diâmetro 0,1 a 1 mm) por exemplo, CaCO ₃ ou SiO ₂	98,0%	92%	80%

O ingrediente ativo finamente moído é uniformemente aplicado num misturador, ao veículo umedecido com polietilenoglicol. Grânulos revestidos não-pulverulentos são obtidos dessa forma.

<u>F6. Grânulos do extrusor</u>	a)	b)	c)	d)
Ingrediente ativo	0,1%	3%	5%	15%
Lignossulfonato de sódio	1,5%	2%	3%	4%
Carboximetilcelulose	1,4%	2%	2%	2%
Caulim	97,0%	93%	90%	79%

O ingrediente ativo é misturado e moído com os adjuvantes, e

a mistura é umedecida com água. A mistura é extrusada e, a seguir, seca num jato de ar.

F7. Pós	a)	b)	c)
Ingrediente ativo	0,1%	1%	5%
Talco	39,9%	49%	35%
Caulim	60,0%	50%	60%

Pós prontos para usar são obtidos pela mistura do ingrediente ativo com os carreadores e moagem da mistura num moinho adequado.

F8. Concentrados de suspensão	a)	b)	c)	d)
Ingrediente ativo	3%	10%	25%	50%
Etilenoglicol	5%	5%	5%	5%
Éter nonilfenolpoliglicólico (15 mols de óxido de etileno)	-	1%	2%	-
Lignossulfonato de sódio	3%	3%	4%	5%
Carboximetilcelulose	1%	1%	1%	1%
Solução de formaldeído aquosa 37%	0,2%	0,2%	0,2%	0,2%
Emulsão oleosa de silicone	0,8%	0,8%	0,8%	0,8%
Água	87%	79%	62%	38%

5 O ingrediente ativo finamente moído é intimamente misturado com os adjuvantes, produzindo um concentrado de suspensão, a partir do qual as suspensões de qualquer concentração desejada podem ser obtidas por diluição com água.

10 A invenção também se refere a um método de inibição do crescimento vegetal, o qual compreende a aplicação às plantas ou aos seus locais de uma quantidade herbicidamente eficaz de um composto de fórmula (I).

15 A invenção também se refere a um método de controle seletivo de capins e ervas daninhas em safras de plantas úteis, o qual compreende a aplicação às plantas úteis ou aos seus locais ou à área de cultivo de uma quantidade herbicidamente eficaz de um composto de fórmula (I).

20 Safras de plantas úteis nas quais a composição de acordo com a invenção pode ser usada incluem safras perenes, tais como de frutas cítricas, de uvas, de nozes, de dendezeiras, de azeitonas, de plantas de fruta-pomo, de drupas e de borracha, safras anualmente aráveis, tais como de cereais, por exemplo, cevada e trigo, algodão, sementes oleaginosas de colza, milho, arroz, soja, de beterraba, de cana-de-açúcar, de girassóis, de plantas

ornamentais e vegetais, especialmente cereais e milho.

Os capins e ervas daninhas a serem controlados podem ser tanto espécies monocotiledôneas, por exemplo, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Avena*, *Bromus*, *Cyperus*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Lolium*, *Monochoria*, *Rottboellia*,
 5 *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria*, *Sida* e *Sorghum*, quanto espécies dicotiledôneas, por exemplo *Abutilon*, *Amaranthus*, *Chenopodium*, *Chrysanthemum*, *Galium*, *Ipomoea*, *Nasturtium*, *Sinapis*, *Solanum*, *Stellaria*, *Veronica*, *Viola* e *Xanthium*.

Safras são para serem entendidas tanto como incluindo aquelas
 10 safras as quais se tornaram tolerantes aos herbicidas ou classes de herbicidas (por exemplo, inibidores ALS-, GS-, EPSPS-, PPO- e HPPD-) por métodos convencionais de geração ou por engenharia genética. Um exemplo de uma safra que se tornou tolerante às imidazolinonas, por exemplo, imazamox, por métodos convencionais de geração é a colza de verão Clearfield® (canola).
 15 Exemplos de safras que se tornaram tolerantes aos herbicidas por métodos de engenharia genética incluem, por exemplo, variedades de milho resistente ao glifosato e glufosinato comercialmente disponíveis sob as marcas comerciais RoundupReady® e LibertyLink®.

Safras também são para serem entendidas como aquelas as
 20 quais se tornaram resistentes a insetos prejudiciais por métodos de engenharia genética, por exemplo, milho Bt (resistente ao tere dem do milho europeu), algodão Bt (resistente ao gorgulho da cápsula do algodão) e também batatas Bt (resistentes ao besouro do Colorado). Exemplos de milhos Bt são os híbridos do milho Bt de NK® (Syngenta Seeds). A toxina Bt é uma proteína
 25 que é formada naturalmente por bactérias do solo de *Bacillus thuringiensis*. Exemplos de toxinas, ou de plantas transgênicas capazes de sintetizar tais toxinas estão descritos em EP-A-451 878, EP-A-374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 e EP-A-427 529. Exemplos de plantas transgênicas compreendendo um ou mais genes que codificam uma resistência inseticida e
 30 expressam uma ou mais toxinas são KnockOut® (milho), Yield Gard®

(milho), NuCOTIN33B® (algodão), Bollgard® (algodão), NewLeaf® (batatas), NatureGard® e Protexcta®. Safras de plantas ou seus materiais de semente podem ser tanto resistentes a herbicidas e, ao mesmo tempo, resistentes à alimentação por insetos (eventos transgênicos “amontoados”).

- 5 Por exemplo, a semente pode ter a capacidade de expressar uma proteína Cry3 inseticida enquanto, ao mesmo tempo, é tolerante ao glifosato.

Safras também são para serem entendidas como sendo aquelas as quais são obtidas por métodos convencionais de geração ou engenharia genética e contêm as chamadas características de produção (por exemplo, 10 estabilidade à estocagem melhorada, maior valor nutricional e flavor melhorado).

Áreas sob cultivo incluem terra na qual as plantas de safra já estão crescendo e terras tencionadas para cultivo com aquelas plantas de safra.

- Os compostos de fórmula I de acordo com a invenção também 15 podem ser usados juntamente com um ou mais herbicidas adicionais. Particularmente, as seguintes misturas do composto de fórmula I são importantes:

Misturas de um composto de fórmula I com uma auxina sintética (por exemplo, composto de fórmula I + clopiralid (162), composto 20 de fórmula I + 2,4-D (211), composto de fórmula I + dicamba (228), composto de fórmula I + MCPA (499), composto de fórmula I + quinclorac (712), ou composto de fórmula I + aminopirialid (CAS RN 150114-71-9)).

Misturas de um composto de fórmula I com diflufenzopir (252).

- 25 Misturas de um composto de fórmula I com uma acetanilida (por exemplo, um composto de fórmula I + acetoclor (5), composto de fórmula I + dimetenamid (260), composto de fórmula I + metolaclor (548), composto de fórmula I + S-metolaclor (549) ou composto de fórmula I + pretilaclor (656)).

30 Misturas de um composto de fórmula I com flamprop-M

(355).

Misturas de um composto de fórmula I com flufenacet (BAY FOE 5043) (369).

5 Misturas de um composto de fórmula I com piroxassulfona (CAS RN 447399-55-5).

Misturas de um composto de fórmula I com triazina (por exemplo, um composto de fórmula I + atrazina (37), ou um composto de fórmula I + terbutilazina (775)).

10 Misturas de um composto de fórmula I com um inibidor HPPD (por exemplo, um composto de fórmula I + isoxaflutol (479), composto de fórmula I + mesotriona (515), composto de fórmula I + pirassulfotol (CAS RN 365400-11-9), composto de fórmula I + sulcotriona (747), composto de fórmula I + tembotriona (CAS RN 335104-84-2), composto de fórmula I + topramezona (CAS RN 210631-68-8), composto de fórmula I + 4-hidróxi-3-
15 [[2-[(2-metoxietóxi)metil]-6-(trifluormetil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona (CAS RN 352010-68-5), ou composto de fórmula I + 4-hidróxi-3-[[2-(3-metoxipropil)-6-(difluormetil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona).

20 Misturas de um composto de fórmula I com um inibidor HPPD e uma triazina.

Misturas de um composto de fórmula I com glifosato (419).

Misturas de um composto de fórmula I com glifosato e um inibidor HPPD (por exemplo, composto de fórmula I + glifosato + isoxaflutol, composto de fórmula I + glifosato + pirassulfotol (CAS RN 365400-11-9),
25 composto de fórmula I + glifosato + sulcotriona, composto de fórmula I + glifosato + tembotriona, composto de fórmula I + glifosato + topramezona, composto de fórmula I + glifosato + 4-hidróxi-3-[[2-[(2-metoxietóxi)metil]-6-(trifluormetil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona, ou composto de fórmula I + glifosato + 4-hidróxi-3-[[2-(3-metoxipropil)-6-(difluormetil)-
30 3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona).

Misturas de um composto de fórmula I com glufosinato-amônio (418).

Misturas de um composto de fórmula I com glufosinato-amônio e um inibidor HPPD (por exemplo, um composto de fórmula I + glufosinato-amônio + isoxaflutol, composto de fórmula I + glufosinato-amônio + mesotriona, composto de fórmula I + glufosinato-amônio + pirassulfotol (CAS RN 365400-11-9), composto de fórmula I + glufosinato-amônio + sulcotriona, composto de fórmula I + glufosinato-amônio + tembotriona, composto de fórmula I + glufosinato-amônio + topramezona, composto de fórmula I + glufosinato-amônio + 4-hidróxi-3-[[2-[(2-metoxietóxi)metil]-6-(trifluormetil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3,2,1]oct-3-en-2-ona ou composto de fórmula I + glufosinato-amônio + 4-hidróxi-3-[[2-(3-metoxipropil)-6-(difluormetil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona).

Misturas de um composto de fórmula I com um inibidor ALS ou AHAS (por exemplo, composto de fórmula I + bensulfuron-metil (64), composto de fórmula I + clorimuron-etil (135), composto de fórmula I + cloransulam-metil (164), composto de fórmula I + florassulam (359), composto de fórmula I + flucarbazona-sódio (364), composto de fórmula I + imazamox (451), composto de fórmula I + imazapir (453), composto de fórmula I + imazetapir (455), composto de fórmula I + iodossulfuron- metil-sódio (466), composto de fórmula I + mesossulfuron-metil (514), composto de fórmula I + nicossulfuron (577), composto de fórmula I + penoxsulam (622), composto de fórmula I + piroxsulam (triflossulam) (CAS RN 422556-08-9), composto de fórmula I + tifensulfuron-metil (tiameturon-metil) (795), composto de fórmula I + triassulfuron (817), composto de fórmula I + tribenuron-metil (822), composto de fórmula I + trifloxissulfuron-sódio (833), composto de fórmula I + ácido tiencarbazona (4- [(4,5-diidro-3-metóxi-4-metil-5-oxo- 1H-1,2,4-triazol-1-il)carbonilsulfamoil]-5- metiltiofeno-3-carboxílico, BAY636)) ou composto de fórmula I + tiencarbazona-metil

(metil 4-[(4,5-diidro-3-metóxi-4-metil-5-oxo- 1H- 1,2,4- triazol-1-il)carbonilsulfamoil]-5-metiltiofeno-3-carboxilato, CAS RN 317815-83-1, BAY636-metil)).

Misturas de um composto de fórmula I com um inibidor PPO
 5 (por exemplo, composto de fórmula I + butafenacil (101), composto de fórmula I + carfentrazona-etil (121), composto de fórmula I + cinidon-etil (152), composto de fórmula I + flumioxazin (376), composto de fórmula I + fomesafen (401) ou composto de fórmula I + éster etílico do ácido [3-[2-cloro-4-flúor-5-(1-metil-6-trifluormetil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetraidropirimidin-
 10 3-il)fenóxi]-2-piridilóxi]acético) (CAS RN 353292-31-6).

Misturas de um composto de fórmula I com um inibidor da ACCase (por exemplo, composto de fórmula I + butroxidim (106), composto de fórmula I + cletodim (155), composto de fórmula I + clodinafop-propargil (156), composto de fórmula I + cicloxidim (190), composto de fórmula I +
 15 cialofop-butil (195), composto de fórmula I + diclofop-metil (238), composto de fórmula I + fenoxaprop-P-etil (339), composto de fórmula I + fluazifop-butil (361), composto de fórmula I + fluazifop-P-butil (362), composto de fórmula I + haloxifop (427), composto de fórmula I + haloxifop-P (428), composto de fórmula I + propaquizafop (670), composto de fórmula I +
 20 quizalofop (717), composto de fórmula I + quizalofop-P (718), composto de fórmula I + setoxidim (726), composto de fórmula I + tepraloxidim (771), composto de fórmula I + tralcoxidim (811)) ou composto de fórmula I + pinoxaden (CAS RN 243973-20-8).

Misturas de um composto de fórmula I com prossulfocarb
 25 (683) ou de um composto de fórmula I com trialato (816).

Misturas de um composto de fórmula I com bromoxinil (95), de um composto de fórmula I com cloridazon (134), um composto de fórmula I com clorotoluron (143), um composto de fórmula I com diuron (281) ou de um composto de fórmula I com metribuzin (554).

30 Misturas de um composto de fórmula I com clomazona (159),

um composto de fórmula I com diflufenican (251), um composto de fórmula I com flurocloridona (389), ou um composto de fórmula I com flurtamona (392).

5 Misturas de um composto de fórmula I com pendimetalina (621) ou de um composto de fórmula I com trifluralina (836).

Misturas de um composto de fórmula I com metilsulfato de difenzoquat (248).

Misturas de um composto de fórmula I com dibrometo de diquat (276).

10 Misturas de um composto de fórmula I com dicloreto de paraquat (614).

Os parceiros de mistura do composto de fórmula I também podem estar na forma de ésteres ou sais, conforme mencionado, por exemplo, em The Pesticide Manual, 13^a Edição (BCPC), 2003. A referência ao
15 glufosinato-amônio também se aplica ao glufosinato, a referência ao cloransulam-metil também se aplica ao cloransulam, a referência ao dimetenamid também se aplica ao dimetenamid-P, a referência ao flamprop-M também se aplica ao flamprop e a referência ao piritiobac-sódio também se aplica ao piritiobac, etc.

20 A proporção de mistura do composto de fórmula I com o parceiro de mistura é preferivelmente de 1:100 até 1000:1.

As misturas podem ser vantajosamente usadas nas formulações acima mencionadas (em cujo caso “ingrediente ativo” se refere à mistura respectiva do composto de fórmula I com o parceiro de mistura).

25 Adicionalmente, um ou mais dos seguintes herbicidas podem ser usados juntamente com um composto de fórmula I de acordo com a invenção ou em combinação com uma mistura conforme descrita acima: acifluorfen-sódio (7), aclonifen (8), acroleína (10), alaclor (14), aloxidim (18), ametrin (20), amicarbazona (21), amidossulfurona (22), amitrol (aminotriazol)
30 (25), sulfamato de amônio (26), anilofos (31), asulam (36), aviglicina (39),

azafenidina (CAS RN 68049-83-2), azimsulfuron (43), BAS 800H (CAS RN 372137-35-4), beflubutamid (55), benazolina (57), bencarbazona (CAS RN 173980-17-1), benfluralina (59), benfuresato (61), bensulide (65), bentazona (67), benzfendizona (CAS RN 158755-95-4), benzobiciclon (69), benzofenap (70), bilanafos (bialafos) (77), bispiribac-sódio (82), bórax (86), bromacil (90), bromobutide (93), bromofenoxim (CAS RN 13181-17-4), butaclor (100), butamifos (102), butralina (105), butilato (108), cafenstrol (110), carbetamida (117), clorbromuron (CAS RN 13360-45-7), clorflurenol-metil (133), ácido cloroacético (138), clorprofam (144), clorsulfuron (147), clortal-dimetil (148), cinmetilina (153), cinossulfuron (154), clomeprop (160), cumiluron (180), cianamida (182), cianazina (183), ciclanilida (186), cicloato (187), ciclossulfamuron (189), daimuron (213), dalapon (214), dazomet (216), desmedifam (225), desmetrina (CAS RN 1014-69-3), diclobenil (229), diclorprop (234), diclorprop-P (235), diclosulam (241), dimefuron (256), dimepiperato (257), dimetaclor (258), dimetametrina (259), dimetipina (261), ácido dimetilar sínico (264), dinitramina (268), dinoterb (272), difenamid (274), dipropetrina (CAS RN 4147-51-7), ditiopir (280), DNOC (282), DSMA (CAS RN 144-21-8), endotal (295), EPTC (299), esprocarb (303), etalfluralina (305), etametsulfuron-metil (306), etefon (307), etofumesato (311), etoxifen (CAS RN 188634-90-4), etoxifen-etil (CAS RN 131086-42-5), etoxissulfuron (314), etobenzanid (318), fentrazamida (348), sulfato ferroso (353), flazassulfuron (356), fluazolato (isopropazol) (CAS RN 174514-07-9), flucetossulfuron (CAS RN 412928-75-7), flucloralina (365), flufenpir-etil (371), flumetralina (373), flumetsulam (374), flumiclorac-pentil (375), flumipropin (flumipropin) (CAS RN 84478-52-4), fluometuron (378), fluorglicofen-etil (380), flupoxam (CAS RN 119126-15-7), flupropacil (CAS RN 120890-70-2), flupropanato (383), flupirsulfuron-metil-sódio (384), flurenol (387), fluridona (388), fluoxipir (390), flutiacet-metil (395), foramsulfuron (402), fosamina (406), halossulfuron-metil (426), HC-252 (429), hexazinona (440), imazametabenz-metil (450), imazapic (452),

imazaquin (454), imazossulfuron (456), indanofan (462), ioxinil (467),
 isoproturon (475), isouron (476), isoxaben (477), isoxaclortol (CAS RN
 141112-06-3), isoxapirifop (CAS RN 87757-18-4), carbutilato (482), lactofen
 (486), lenacil (487), linuron (489), MCPA-tioetil (500), MCPB (501),
 5 mecoprop (503), mecoprop-P (504), mefenacet (505), mefluidide (507),
 metam (519), metamifop (mefluoxafop) (520), metamitron (521), metazaclor
 (524), metabenzthiazuron (526), metazol (CAS RN 20354-26-1), ácido
 metilarsônico (536), metildimron (539), isotiocianato de metila (543),
 metobenzuron (547), metobromuron (CAS RN 3060-89-7), metossulam
 10 (552), metoxuron (553), metsulfuron-metil (555), MK-616 (559), molinato
 (560), monolinuron (562), MSMA (CAS RN 2163-80-6), naproanilida (571),
 napropamida (572), naptalam (573), neburon (574), nipiraclofen (CAS RN
 99662-11-0), n-metil-glifosato, ácido nonanóico (583), norflurazon (584),
 ácido oléico (ácidos graxos) (593), orbencarb (595), ortossulfamuron (CAS
 15 RN 213464-77-8), orizalin (597), oxadiargil (599), oxadiazon (600),
 oxassulfuron (603), oxaziclomefona (604), oxifluorfen (610), pebulato (617),
 pentaclorofenol (623), pentanoclor (624), pentoxazona (625), petoxamid
 (627), óleos de petróleo (628), fenmedifam (629), picloram (645), picolinafen
 (646), piperofos (650), primissulfuron-metil (657), prodiamina (661),
 20 profluazol (CAS RN 190314-43-3), profoxidim (663), proexadiona cálcica
 (664), prometon (665), prometrina (666), propaclor (667), propanil (669),
 propazina (672), profam (674), propisoclor (667), propoxicarbazona sódica
 (procarbazona sódica) (679), propizamida (681), prossulfuron (684),
 piraclonil (pirazogil) (CAS RN 158353-15-2), piraflufen-etil (691),
 25 pirazolinato (692), pirazossulfuron-etil (694), pirazoxifen (695), piribenzoxim
 (697), piributicarb (698), piridafol (CAS RN 40020-01-7), piridato (702),
 piriftalid (704), piriminobac-metil (707), pirimissulfan (CAS RN 221205-90-
 9), piritiobac-sódio (709), quinmerac (713), quinoclamina (714), rimsulfuron
 (721), sequestreno, siduron (727), simazina (730), simetrina (732), clorato de
 30 sódio (734), sulfentrazona (749), sulfometuron-metil (751), sulfosato (CAS

RN 81591-81-3), sulfossulfuron (752), ácido sulfúrico (755), óleos de clcatrão (758), TCA-sódio (760), tebutam (CAS RN 35256-85-0), tebutiuron (765), tefuriltriona (CAS RN 473278-76-1), terbacil (772), terbumeton (774), terbutrina (776), tenilclor (789), tidiazimin (CAS RN 123249-43-4),
5 tiazafuron (CAS RN 25366-23-8), tiazopir (793), tiobencarb (797), tiocarbazil (807), triaziflam (819), triclopir (827), trietazina (831), triflusulfuron-metil (837), triidroxitriazina (CAS RN 108-80-5), trinexapac-
etil (CAS RN 95266-40-3) e tritosulfuron (843).

Os parceiros de mistura do composto de fórmula I também
10 podem estar na forma de ésteres ou de sais, conforme mencionado, por exemplo, em The Pesticide Manual, 13ª Edição (BCPC), 2003. A referência ao acifluorfeno-sódio também se aplica ao acifluorfeno, e a referência ao bensulfuron-metil também se aplica ao bensulfuron, etc.

A proporção de mistura do composto de fórmula I ao parceiro
15 de mistura é preferivelmente de 1:100 até 1000:1.

As misturas podem ser vantajosamente usadas nas formulações acima mencionadas (em cujo caso o “ingrediente ativo” se refere à mistura respectiva do composto de fórmula I com o parceiro de mistura).

Os compostos de fórmula I de acordo com a invenção também
20 podem ser usados juntamente com um ou mais agentes de segurança. Da mesma forma, misturas de um composto de fórmula I de acordo com a invenção com um ou mais outros herbicidas também podem ser usadas juntamente com um ou mais agentes de segurança. Os agentes de segurança podem ser benoxacor (63), cloquintocet-mexil (163), ciometrinil (CAS RN
25 78370-21-5), ciprossulfamida (CAS RN 221667-31-8), diclormid (231), diciclonon (CAS RN 79260-71-2), fenclorazol-etil (331), fenclorim (332), flurazol (386), fluxofenim (399), furilazol (413) e o isômero R correspondente, isoxadifen-etil (478), mefenpir-dietil (506), anidrido naftálico (CAS RN 81-84-5) e oxabetrinil (598). São particularmente preferidas as
30 misturas de um composto de fórmula I com benoxacor e um composto de

fórmula I com cloquintocet-mexil.

Os agentes de segurança do composto de fórmula I também podem estar na forma de ésteres ou de sais, conforme mencionado, por exemplo, em The Pesticide Manual, 13ª Edição (BCPC), 2003. A referência ao cloquintocet-mexil também se aplica ao cloquintocet, e a referência ao fenclorazol-etil também se aplica ao fenclorazol, etc.

Preferivelmente a proporção de mistura do composto de fórmula I em relação aos agentes de segurança é de 100:1 até 1:10, especialmente de 20:1 até 1:1.

As misturas podem ser vantajosamente usadas nas formulações acima mencionadas (em cujo caso “ingrediente ativo” se refere à mistura respectiva do composto de fórmula I com o agente de segurança). É possível que o agente de segurança e o composto de fórmula I e um ou mais herbicida(s) adicional(is), caso haja algum, sejam aplicados simultaneamente. Por exemplo, o agente de segurança, um composto de fórmula I e um ou mais herbicida(s) adicional(is), caso aja algum, deva ser aplicado ao local antes do aparecimento ou deva ser aplicado à safra depois do aparecimento. Também é possível que o agente de segurança e um composto de fórmula I e um ou mais herbicida(s) adicional(is), caso haja algum, sejam aplicados seqüencialmente. Por exemplo, o agente de segurança deve ser aplicado antes de semear as sementes como um tratamento de semente e um composto de fórmula I e um ou mais herbicidas adicionais, caso haja algum, deve ser aplicado ao local antes do aparecimento ou deva ser aplicado à safra após o aparecimento.

Misturas preferidas de um composto de fórmula I com outros herbicidas e agentes de segurança incluem:

Misturas de um composto de fórmula I com uma triazina e um agente de segurança.

Misturas de um composto de fórmula I com glifosato e um agente de segurança.

Misturas de um composto de fórmula I com glufosinato e um

agente de segurança.

Misturas de um composto de fórmula I com isoxaflutol e um agente de segurança.

5 Misturas de um composto de fórmula I com isoxaflutol e triazina e um agente de segurança.

Misturas de um composto de fórmula I com isoxaflutol e glifosato e um agente de segurança.

Misturas de um composto de fórmula I com isoxaflutol e glufosinato e um agente de segurança.

10 Misturas de um composto de fórmula I com mesotriona e um agente de segurança.

Misturas de um composto de fórmula I com mesotriona e uma triazina e um agente de segurança.

15 Misturas de um composto de fórmula I com mesotriona e glifosato e um agente de segurança.

Misturas de um composto de fórmula I com mesotriona e glufosinato e um agente de segurança.

Misturas de um composto de fórmula I com sulcotriona e um agente de segurança.

20 Misturas de um composto de fórmula I com sulcotriona e uma triazina e um agente de segurança.

Misturas de um composto de fórmula I com sulcotriona e glifosato e um agente de segurança.

25 Misturas de um composto de fórmula I com sulcotriona e glufosinato e um agente de segurança.

Os Exemplos a seguir adicionalmente ilustram, porém não limita, a invenção.

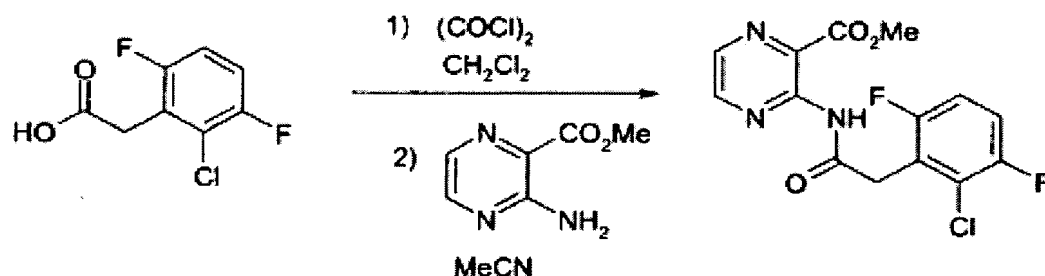
Exemplos de preparação

1. Reações as quais são englobadas pelo Esquema 1

30 Exemplo 1.1: Preparação de 7-(2-cloro-3,6-difluorofenil)-8-hidróxi-5H-

pirido[2,3-b]pirazin-6-ona (Composto A11 da Tabela A)

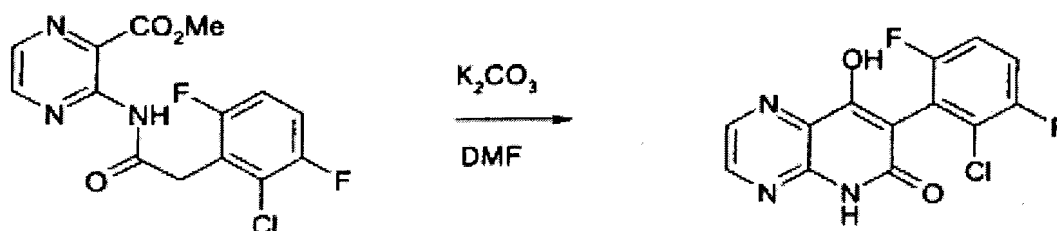
Passo 1



Cloreto de oxalila (1,30 mL) foi adicionado gota a gota numa
 solução de ácido (2-cloro-3,6-difluorfenil)acético (3,151 g) em diclorometano
 5 (20 mL) em temperatura ambiente. Uma gota de dimetilformamida foi
 adicionada para iniciar a reação. A mistura reacional foi agitada em
 temperatura ambiente por 1 hora. A mistura reacional foi concentrada para
 produzir um óleo incolor o qual foi dissolvido em acetonitrila (30 mL). A
 mistura foi dividida em três porções e cada porção foi adicionada a uma pasta
 10 de éster metílico do ácido 3-aminopirazino-2-carboxílico (0,76 g) em
 acetonitrila (15 mL). A mistura reacional foi aquecida no microondas até 130
 $^{\circ}\text{C}$ por 40 minutos. A mistura reacional foi deixada esfriar até a temperatura
 ambiente e armazenada em temperatura ambiente por 16 horas. As amostras
 foram combinadas e concentradas para produzir éster metílico do ácido 3-[2-
 15 (2-cloro-3,6-difluorfenil)metilcarbonilamino]-pirazino-2-carboxílico como
 um óleo laranja escuro (4,15 g)

RMN ^1H (CDCl_3): 4,02 (s, 3H), 4,22 (s, 2H), 7,02-7,10 (m, 1H), 7,11-7,17 (m, 1H), 8,41 (d, 1H), 8,61 (d, 1H), 10,8 (s, 1H) ppm,

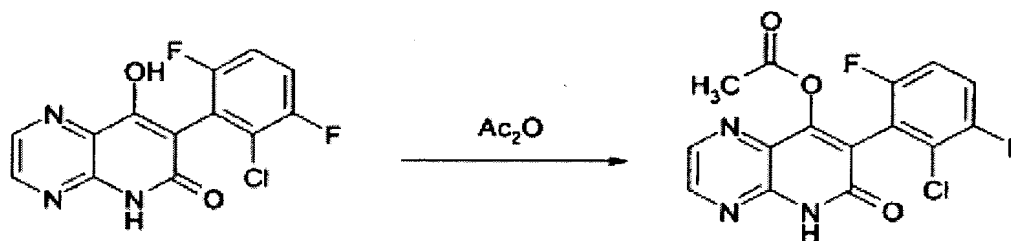
Passo 2



Uma mistura do produto do Passo 1 (4,15 g) e carbonato de potássio (1,67 g) em dimetilformamida (50 mL) foi aquecida até 110 °C por 2 horas. A mistura reacional foi deixada esfriar até a temperatura ambiente e, a seguir, armazenada em temperatura ambiente por 16 horas. Água foi adicionada à mistura reacional e a mistura foi acidificada com ácido clorídrico concentrado (36% em peso em água). O precipitado foi isolado e lavado sucessivamente com água e hexano para produzir o Composto A11 da Tabela A como um sólido marrom (2,88 g).

Os compostos A1-A10, A12-A43, A45-A49 da Tabela A foram feitos usando procedimentos análogos.

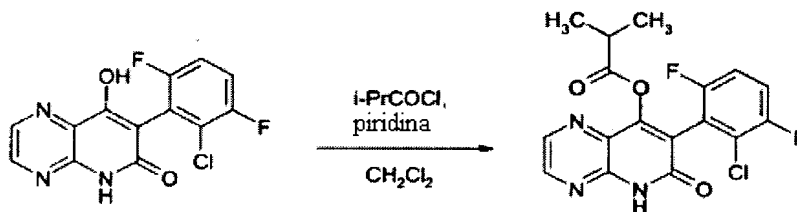
Exemplo 1.2: Preparação de éster 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-6-oxo-5,6-diidropirido[2,3-b]pirazin-8-ílico do ácido acético (Composto B5 da Tabela B)



Composto A1 da Tabela A (0,62 g) em anidrido acético (10 mL) foi aquecido até 140 °C por 3 horas. A mistura reacional foi deixada esfriar até temperatura ambiente e, a seguir, armazenada em temperatura ambiente por 16 horas. A mistura reacional foi vertida em água a 0 °C e extraída com acetato de etila. O extrato orgânico foi concentrado para produzir um sólido marrom o qual foi triturado com hexano para produzir o Composto B5 da Tabela B como um sólido marrom (0,56 g).

Os compostos B1, B8-B10, B15, B25-B27, B29 e B33 da Tabela B foram feitos usando procedimentos análogos.

Exemplo 1.3: Preparação do éster 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-6-oxo-5,6-diidropirido[2,3-b]pirazin-8-ílico do ácido isobutírico (Composto B4 da Tabela B)

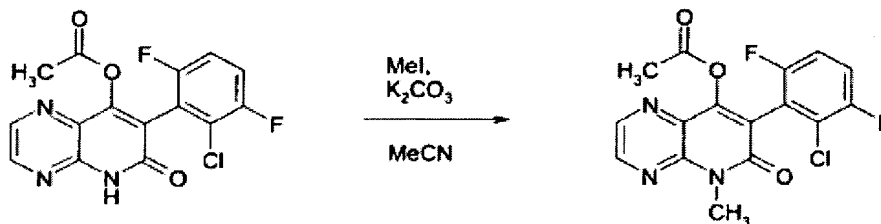


Composto A11 da Tabela A (1,0 g), cloreto de isobutirila (0,4 mL) e piridina (0,31 mL) foram agitados em diclorometano (30 mL) em temperatura ambiente por 2 horas e armazenados em temperatura ambiente por 16 horas. A mistura reacional foi filtrada. O filtrado foi diluído com diclorometano e lavado com água e hidrogenocarbonato de sódio aquoso (1 M), seco em sulfato de magnésio e concentrado para produzir o Composto B4 da Tabela B como um sólido amarelo (0,65 g).

Os compostos B2-B3 e B6-B7, B11-B14, B16-B17, B19-B24, B28, B30-B32 e B35-B62 da Tabela B foram feitos usando procedimentos análogos.

2. Reações as quais são englobadas pelo Esquema 2

Exemplo 2.1: Preparação de éster 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-5-metil-6-oxo-5,6-diidropirido[2,3-b]pirazin-8-ílico do ácido acético (Composto C16 da Tabela C)

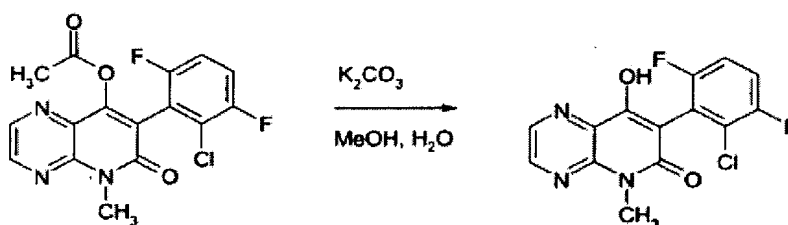


Uma mistura do Composto B5 da Tabela B (0,146 g), carbonato de potássio (0,060 g) e iodeto de metila (0,03 mL) em acetonitrila (5 mL) foi aquecida até 100 °C no microondas por 10 minutos. A mistura reacional foi deixada esfriar até a temperatura ambiente e armazenada em temperatura ambiente por 16 horas. A solução foi decantada a partir do

material insolúvel, absorvida em sílica gel e purificada por cromatografia em coluna de sílica gel (eluente:acetato de etila/hexano 1:1) para produzir o Composto C16 da Tabela C como um sólido amarelo (0,122 g).

Compostos C1-C15, C17, C19-C41, C43-C70, C72-C110, C112-C172, C173-C177, C179-C181, C183, C185 da Tabela C foram feitos usando procedimentos análogos.

Exemplo 2.2: Preparação de 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-8-hidróxi-5-metil-5H-pirido[2,3-b]pirazin-6-ona (Composto D1 da Tabela D)

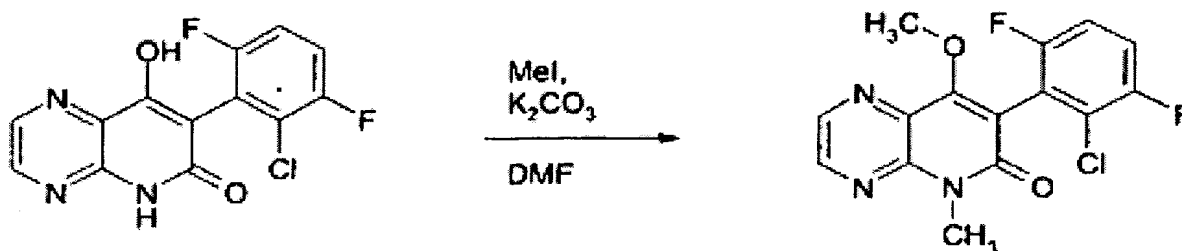


Uma mistura do Composto C16 da Tabela C (0,10 g) e carbonato de potássio (0,037 g) em metanol (3 mL) e água (1 mL) foi aquecida até o refluxo por 1 hora. A mistura reacional foi deixada esfriar até a temperatura ambiente e armazenada em temperatura ambiente por 16 horas. O solvente foi concentrado para produzir com sólido amarelo, o qual foi suspenso em éter dietílico e ácido clorídrico aquoso (2 M). As fases foram separadas e a fase orgânica foi concentrada para produzir o Composto D1 da Tabela D como um sólido amarelo pálido (0,086 g).

Os Compostos D2-D5 e D7-D15 da Tabela D foram feitos usando procedimentos análogos.

3. Reações as quais são englobadas pelo Esquema 3

Exemplo 3.1: Preparação de 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-8-metóxi-5-metil-5H-pirido[2,3-b]pirazin-6-ona (Composto C18 da Tabela C)



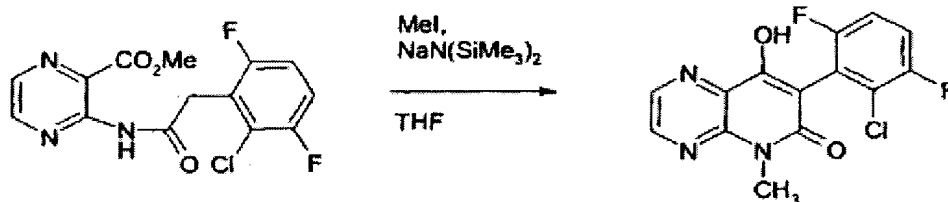
Uma mistura do Composto A11 da Tabela A (0,098 g), carbonato de potássio (0,074 g) e iodeto de metila (0,04 mL) em dimetilformamida (5 mL) foi aquecida a 100 °C num microondas por 10 minutos. A mistura reacional foi deixada esfriar até a temperatura ambiente e armazenada em temperatura ambiente por 16 horas. Água foi adicionada à mistura reacional e a mistura foi extraída com acetato de etila. O extrato orgânico foi lavado com água e concentrado. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna em sílica gel (eluente: acetato de etila/hexano 1:1) para produzir o Composto C18 da Tabela C (0,032 g).

O Composto C42 da Tabela C foi feito usando um procedimento análogo.

4. Reações as quais são englobadas pelo Esquema 4

Exemplo 4.1: Preparação alternativa de 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-8-hidróxi-5-metil-5H-pirido[2,3-b]pirazin-6-ona (Composto D1 da Tabela D) pelo

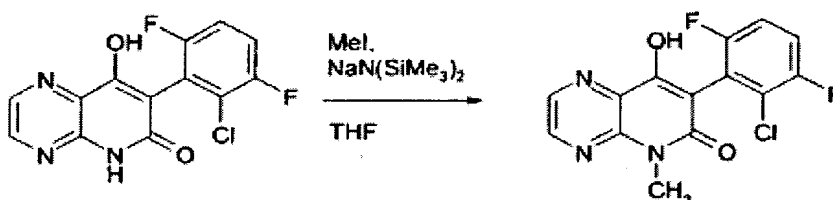
Método 1



Hexametildissilazida de sódio (1,0 mL) (1 M em THF) foi adicionada gota a gota numa solução de éster metílico do ácido 3-[2-(2-cloro-3,6-difluorfenil)metilcarbonilamino]-pirazino-2-carboxílico (0,33 g) em tetraidrofurano (12 mL) sob uma atmosfera de nitrogênio a 0 °C. Iodeto de metila (0,60 mL) foi adicionado a 0 °C e a mistura reacional foi, a seguir, aquecida até o refluxo por 45 minutos. A mistura reacional foi deixada esfriar até a temperatura ambiente e mais hexametildissilazida de sódio (1,5 mL) (1 M em THF) foi adicionada. A mistura reacional foi, a seguir, aquecida até o refluxo por mais 3 horas. A mistura reacional foi deixada esfriar e tratada com ácido clorídrico concentrado (36% em peso em água). A suspensão foi filtrada e o filtrado foi evaporado. O resíduo foi dissolvido em acetato de etila, lavado

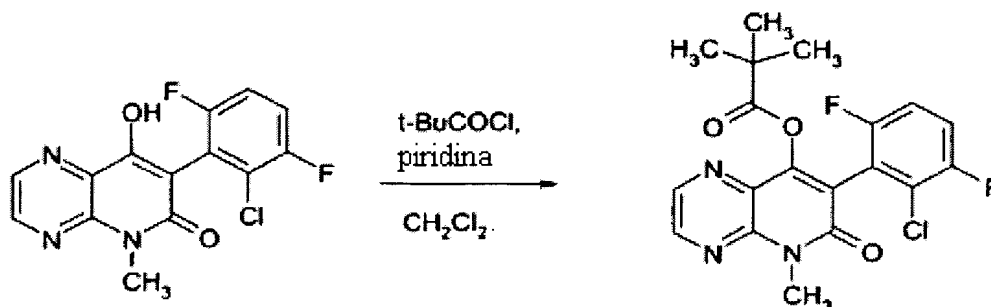
com água e ácido clorídrico aquoso (2 M), seco em sulfato de magnésio e concentrado. O resíduo foi triturado com éter dietílico para produzir o Composto D1 da Tabela D como um sólido vermelho (0,189 g).

Exemplo 4.2: Preparação alternativa de 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-8-hidróxi-5-metil-5H-pirido[2,3-b]pirazin-6-ona (Composto D1 da Tabela D) pelo Método 2



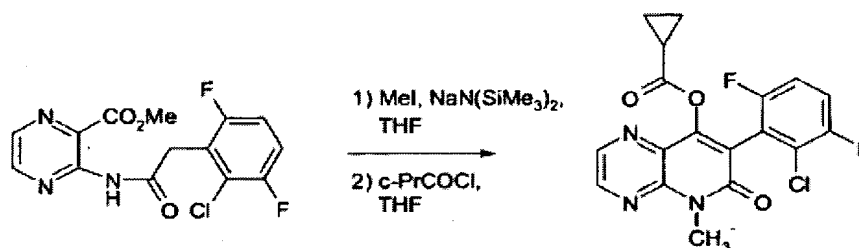
Composto A11 da Tabela A (0,155 g) e iodeto de metila (0,60 mL) foram agitados em tetraidrofurano (10 mL) sob uma atmosfera de nitrogênio em temperatura ambiente, e hexametildissilazida sódica (0,5 mL) (1 M em THF) foi adicionada gota a gota. A mistura reacional foi aquecida até o refluxo por 1 hora e, a seguir, deixada esfriar até a temperatura ambiente. Mais hexametildissilazida sódica (0,5 mL) (1 M em THF) e iodeto de metila (0,60 mL) foram adicionados e a mistura reacional foi aquecida até o refluxo por 2 horas. A mistura reacional foi deixada esfriar e diluída com água. Ácido clorídrico aquoso (2 M) foi adicionado e a mistura foi extraída com acetato de etila. O extrato orgânico foi lavado com água, seco em sulfato de magnésio e concentrado para produzir o Composto D1 da Tabela D como um sólido vermelho cristalino (0,115 g).

Exemplo 4.3: Preparação alternativa do éster 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-5-metil-6-oxo-5,6-diidropirido[2,3-b]pirazin-8-ílico do ácido 2,2-dimetilpropiónico (Composto C20 da Tabela C)



Composto D1 da Tabela D (0,050 g) foi agitado em diclorometano (5 mL) com piridina (0,5 mL) em temperatura ambiente por 20 minutos. Uma solução de cloreto de ácido 2,2-dimetilpropiónico (0,039 g) em diclorometano (1 mL) foi adicionada, e a reação foi agitada em temperatura ambiente por 24 horas. Mais diclorometano (5 mL) foi adicionado e a mistura foi lavada sucessivamente com ácido clorídrico (2 M), hidrogenocarbonato de sódio aquoso (1 M) e água. A camada orgânica foi concentrada para produzir o Composto C20 da Tabela C como um sólido (0,039 g).

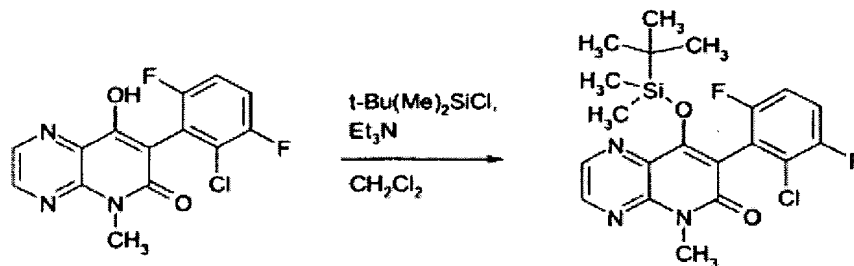
Exemplo 4.4: Preparação alternativa do éster 7-(2-cloro-3,6- difluorfenil)-5-metil-6-oxo-5,6-diidropirido[2,3-b]pirazin-8-ílico do ácido ciclopropanocarboxílico (Composto C54 da Tabela C)



Hexametildissilazida de sódio (3,0 mL) (1 M em THF) foi adicionada gota a gota a uma solução de éster metílico do ácido 3-[2-(2-cloro-3,6-difluorfenil)metilcarbonilamino]-pirazino-2- carboxílico (0,33 g) em tetraidrofurano (10 mL) sob uma atmosfera de nitrogênio em temperatura ambiente. Iodeto de metila (0,60 mL) foi adicionado em temperatura ambiente e a mistura reacional foi aquecida até o refluxo por 3 horas. A mistura reacional foi deixada esfriar até a temperatura ambiente e uma solução de cloreto de ciclopropilcarbonila (0,201 g) em tetraidrofurano (4 mL) foi adicionada. A mistura reacional foi aquecida até o refluxo por mais 15 minutos e, a seguir, foi deixada esfriar. A mistura reacional foi diluída com acetato de etila e lavada sucessivamente com ácido clorídrico aquoso (2 M), hidrogenocarbonato de sódio aquoso (1 M) e água. A camada orgânica foi concentrada e o resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (eluente: éter dietílico/hexano 1:1) para produzir o Composto C54 da Tabela C como um sólido (0,127 g).

5. Reações as quais são englobadas pelo Esquema 5

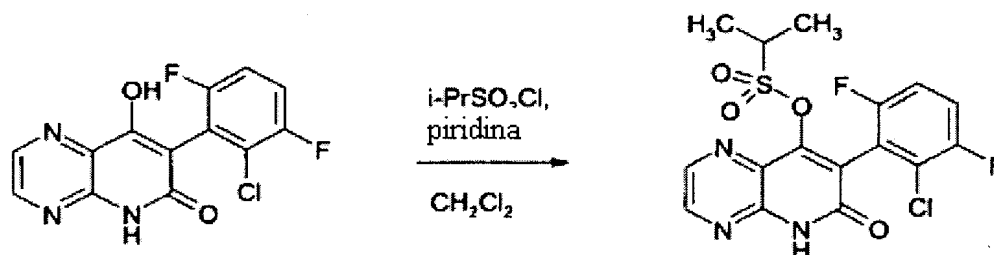
Exemplo 5.1: Preparação de 8-(terc-butildimetilsilanilóxi)-7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-5-metil-5H-pirido[2,3-b]pirazin-6-ona (Composto C184 da Tabela C)



Uma mistura de cloreto de t-butildimetilsilila (0,094 g),
 5 Composto D1 da Tabela D (0,10 g) e trietilamina (0,5 mL) em diclorometano (8 mL) foi agitada em temperatura ambiente por 16 horas. A reação foi diluída com mais diclorometano e lavada com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio e concentrada para produzir um óleo, o qual foi purificado por cromatografia em coluna de sílica gel (eluente: éter dietílico/hexano 1:1) para produzir o Composto C184 da Tabela C como um sólido incolor.

6. Reações as quais são englobadas pelo Esquema 6

Exemplo 6.1: Preparação de éster 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-5-metil-6-oxo-5,6-diidropirido[2,3-b]pirazin-8-ílico do ácido propano-2-sulfônico (Composto B34 da Tabela B)

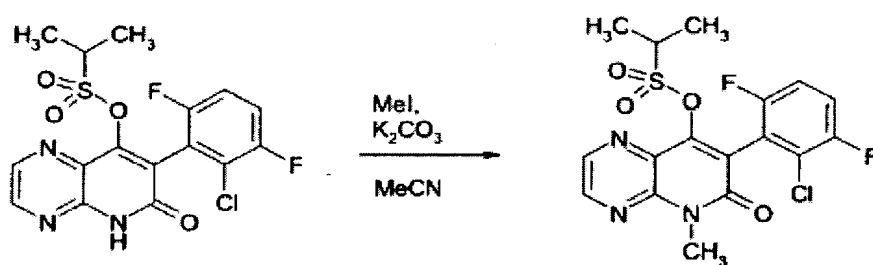


Uma mistura de cloreto de isopropilsulfonila (0,218 mL),
 Composto A11 da Tabela A (0,50 g) e piridina (2 mL) em diclorometano (10 mL) foi aquecida até o refluxo por 7 horas. A mistura reacional foi deixada esfriar até a temperatura ambiente e diluída com água. As fases foram separadas.
 20 A camada orgânica foi lavada com hidrogenocarbonato de sódio aquoso (1 M),

secas em sulfato de magnésio e concentrada para produzir um óleo o qual foi purificado por cromatografia em coluna em sílica gel (eluente: éter dietílico/hexano 1:1) para produzir o Composto B34 da Tabela B (0,048 g).

5 O Composto B18 da Tabela B foi feito pelo uso de um procedimento análogo.

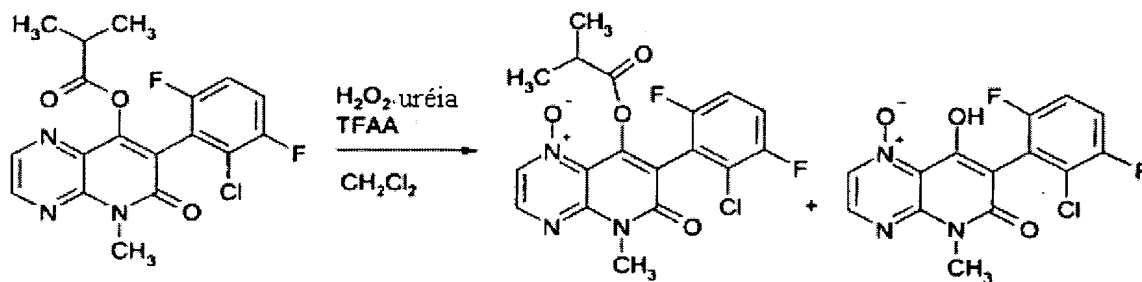
Exemplo 6.2: Preparação de éster 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-5-metil-6-oxo-5,6-diidropirido[2,3-b]pirazin-8-ílico do ácido propano-2-sulfônico (Composto C111 da Tabela C)



10 Uma mistura do Composto B34 da Tabela B (0,045 g), acetonitrila (4 mL), carbonato de potássio (0,046 g) e iodeto de metila (0,015 mL) foi aquecida até 150 °C num microondas por 10 minutos. A mistura reacional foi deixada esfriar até a temperatura ambiente e foi filtrada. O filtrado foi concentrado para produzir o Composto C111 da Tabela C (0,054 g).

15 7. Reações as quais são englobadas pelo Esquema 7

Exemplo 7.1: Preparação de 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-8-hidróxi-5-metil-1-óxi-5H-pirido[2,3-b]pirazin-6-ona (Composto D6 da Tabela D) e éster 7-(2-cloro-3,6-difluorfenil)-5-metil-6-oxo-1-óxi-5,6-diidropirido[2,3-]pirazin-8-ílico do ácido isobutírico (Composto C71 da Tabela C)

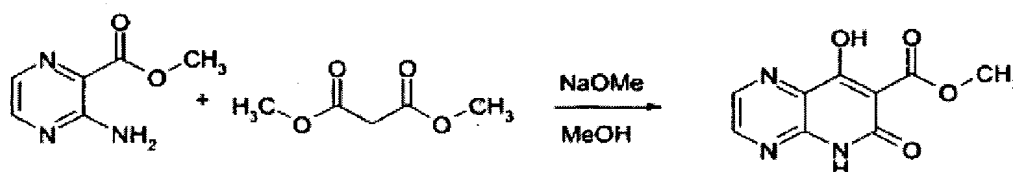


Composto C12 da Tabela C (0,30 g) e uréia recentemente moída-peróxido de hidrogênio (0,107 g) foram agitados em diclorometano (10 mL) e anidrido trifluoracético (TFAA) (0,238 g) foi adicionado gota a gota em temperatura ambiente. A reação foi agitada em temperatura ambiente por 5 horas e, a seguir, armazenada em temperatura ambiente por 16 horas. A mistura reacional foi interrompida pela adição de metabissulfito de sódio aquoso (1 M). As fases foram separadas. A fase orgânica foi lavada com hidrogenocarbonato de sódio aquoso (1 M), seca em sulfato de magnésio e concentrada para produzir um óleo amarelo, o qual foi purificado por cromatografia em coluna em sílica gel (eluente: acetato de etila/hexano 1:1) para produzir o Composto C71 da Tabela C (0,054 g) e o Composto D6 da Tabela D (0,024 g).

8. Reações as quais são englobadas pelo Esquema 8

Exemplo 8.1: Preparação alternativa do éster 7-(3,4-diclorofenil)-6-oxo-5,6-diidropirido[2,3-b]pirazin-8-ílico do ácido acético (Composto B29 da Tabela B)

Passo 1



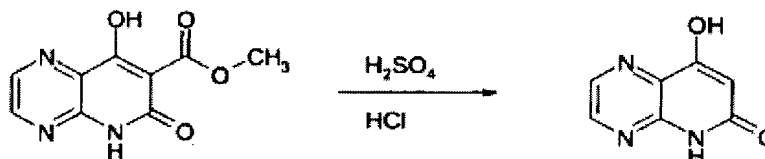
Metóxido de sódio (6,5 mL) (30% em peso em metanol) foi dissolvido em metanol (75 mL) em temperatura ambiente. Malonato de dimetila (3,7 mL) foi adicionado gota a gota em temperatura ambiente por um período de 20 minutos e a reação foi agitada em temperatura ambiente por 1 hora. 3-aminopirazino-2-carboxilato de metila (5,0 g) foi adicionado em porções em temperatura ambiente por um período de 40 minutos. A mistura reacional foi aquecida até o refluxo por 3 fias, e a seguir deixada esfriar. O solvente foi concentrado. O resíduo foi dissolvido em água e acidificado com ácido clorídrico concentrado (36% em peso em água). O precipitado foi

isolado, lavado com água, metanol e acetato de etila, e seco sob alto vácuo para produzir o éster metílico do ácido 6,8-diidroxipirido[2,3-b]pirazino-7-carboxílico como um sólido bege (4,16 g).

RMN ^1H (d_6 -DMSO): 3,80 (s, 3H), 8,59 (s, 1H), 8,70 (s, 1H)

5 ppm.

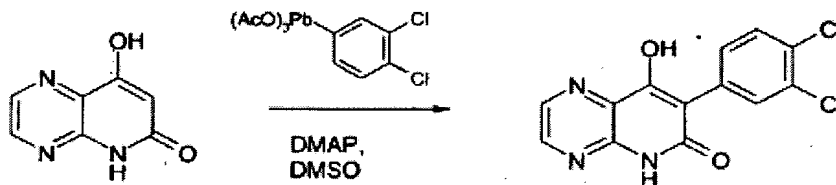
Passo 2



10 Numa solução de éster metílico do ácido 6,8-diidroxipirido[2,3-b]pirazino-7-carboxílico (5,0 g) em ácido clorídrico concentrado (36% em peso em água) foram adicionadas algumas gotas de ácido sulfúrico concentrado em temperatura ambiente. A mistura reacional foi deixada esfriar até temperatura ambiente e armazenada em temperatura ambiente por 16 horas. A seguir a mistura reacional foi concentrada e seca sob alto vácuo para produzir 8-hidróxi-5H-pirido[2,3-b]pirazin-6-ona como um sólido marrom (3,02 g).

15 RMN ^1H (d_6 -DMSO): 8,53 (s, 1H), 8,63 (s, 1H) ppm.

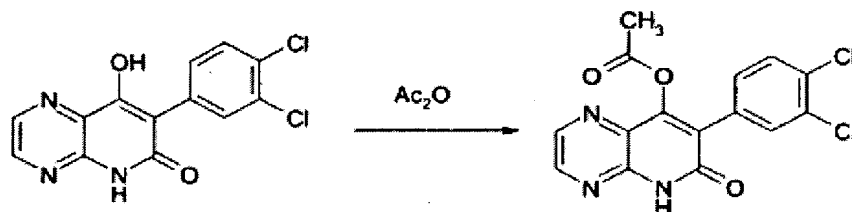
Passo 3



20 Uma mistura de triacetato de 3,4-diclorofenil chumbo (1,63 g), 8-hidróxi-5H-pirido[2,3-b]pirazin-6-ona (0,254 g) e 4-dimetilaminopiridina (DMAP) (0,549 g) em dimetilsulfóxido anidro (10 mL) sob uma atmosfera de nitrogênio foi aquecida até 60 °C por quatro horas. A mistura reacional foi, a seguir, deixada esfriar até a temperatura ambiente e armazenada em

temperatura ambiente por 16 horas. A mistura reacional foi diluída com acetato de etila. A mistura foi lavada com ácido clorídrico aquoso (1 M) e água, e a camada orgânica foi concentrada para produzir 7-(3,4-diclorofenil)-8-hidróxi-5H-pirido[2,3-b]pirazin-6-ona (0,13 g), a qual foi usada sem purificação adicional.

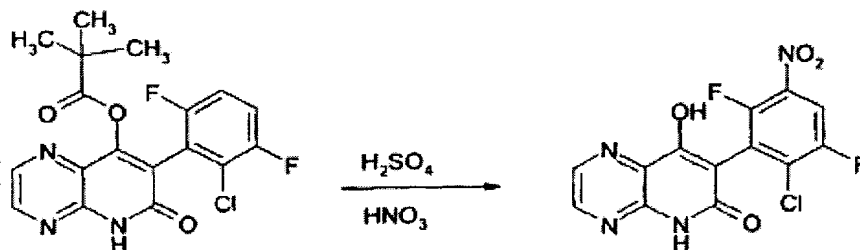
Passo 4



7-(3,4-diclorofenil)-8-hidróxi-5H-pirido[2,3-b]pirazin-6-ona bruta (0,13 g) foi aquecida em anidrido acético (10 mL) por 3 horas e, a seguir, deixada esfriar e armazenada em temperatura ambiente por 16 horas. A mistura reacional foi vertida em gelo e água, agitada vigorosamente e extraída com acetato de etila. O extrato orgânico foi lavado com água e concentrado. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna em sílica gel (eluente: acetato de etila/hexano 1:1) para produzir o Composto B29 da Tabela B como um sólido amarelo (0,077 g).

9. Reações as quais são englobadas pelo Esquema 9

Exemplo 9.1: Preparação de éster 7-(2-cloro-3,6-difluor-5-nitrofenil)-5-metil-6-oxo-5,6-diidropirido[2,3-b]pirazin-8-ílico do ácido 2,2-dimetilpropiónico (Composto A44 da Tabela A)

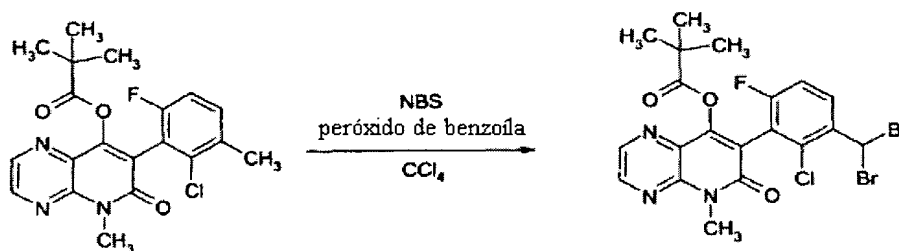


O composto B6 da Tabela B (1,0 g) foi adicionado em ácido sulfúrico concentrado (10 mL) (50% em peso em água) a 0 °C. Ácido nítrico (0,7 mL) (79% em peso em água) foi adicionado a 0 °C, seguido por ácido

nítrico fumegante (0,7 mL) a 0 °C. A mistura reacional foi deixada aquecer até a temperatura ambiente e agitada em temperatura ambiente por 5 horas. A mistura reacional foi interrompida vertendo-a em gelo. O precipitado formado foi isolado para fornecer o Composto A44 da Tabela A (0,78 g).

5 10. Reações as quais são englobadas pelo Esquema 10

Exemplo 10.1: Preparação de éster 7-(2-cloro-3-dibromometil- 6-fluorfenil)-5-metil-6-oxo-5,6-diidropirido[2,3-b]pirazin-8-ílico do ácido 2,2-dimetilpropiãoico (Composto C182 da Tabela C)



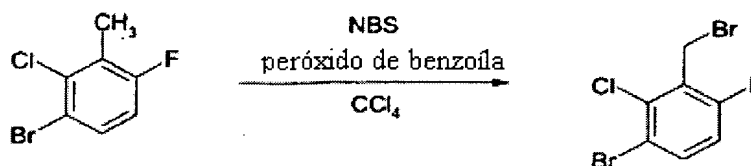
10 Composto C126 da Tabela C (0,016 g), N-bromossuccinimida (NBS) (0,014 g) e peróxido de benzoíla (quantidade catalítica) foram aquecidos até o refluxo em tetracloreto de carbono (5 mL).

15 Uma lâmpada de tungstênio-halogênio de 500 watt foi usada para iniciar a reação. A mistura reacional foi aquecida até o refluxo e irradiada até o material de partida ser consumido. A mistura reacional foi deixada esfriar e, a seguir, filtrada. O filtrado foi concentrado para produzir um óleo incolor, o qual foi purificado por cromatografia em coluna em sílica gel (eluente: acetato de etila/hexano 1:4) para produzir o Composto C182 da Tabela C como um sólido branco (0,018 g).

11. Reações as quais são englobadas pelo Esquema 11

20 Exemplo 11: Preparação do ácido (3-bromo-2-cloro-6-fluorfenil)-acético

Passo 1

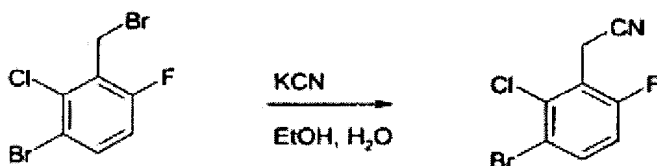


3-bromo-2-cloro-6-fluortolueno (8,0 g), N-bromossuccinimida (NBS) (6,42 g) e uma quantidade catalítica de peróxido de benzoíla em tetracloreto de carbono (40 mL) foram aquecidos até o refluxo. Uma lâmpada de tungstênio-halogênio de 500 watt foi usada para iniciar a reação. A mistura reacional foi aquecida até o refluxo e irradiada por 30 minutos. A mistura reacional foi deixada esfriar e, a seguir, foi filtrada. O filtrado foi concentrado para produzir um óleo incolor, o qual se solidificou no repouso para produzir 1-bromo-3-bromometil-2-cloro-4-fluorbenzeno como um sólido branco-sujo (10,7 g).

RMN ^1H (CDCl_3): 4,64 (d, 2H), 6,94 (t, 1H), 7,58 (dd, 1H)

10 ppm.

Passo 2

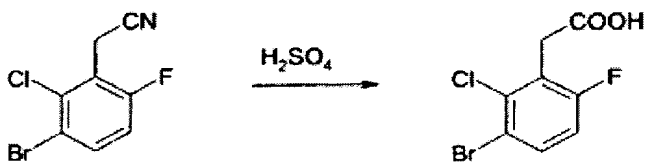


Uma solução de 1-bromo-3-bromometil-2-cloro-4-fluorbenzeno (9,945 g) em etanol absoluto (40 mL) foi adicionada gota a gota a uma solução de cianeto de potássio (2,38 g) em água (2 mL) sob aquecimento num período de 30 minutos. A mistura reacional foi aquecida até o refluxo por 7 horas. A mistura reacional foi, a seguir, deixada esfriar e armazenada em temperatura ambiente por 16 horas. A mistura foi filtrada e o filtrado foi concentrado. O resíduo foi dissolvido em acetato de etila, seco em sulfato de magnésio e concentrado para produzir (3-bromo-2-cloro-6-fluorfenil)-acetonitrila como um óleo amarelo pálido (8,19 g).

RMN ^1H : (CDCl_3): 3,89 (d, 2H), 7,00 (t, 1H), 7,64 (dd, 1H)

ppm.

Passo 3



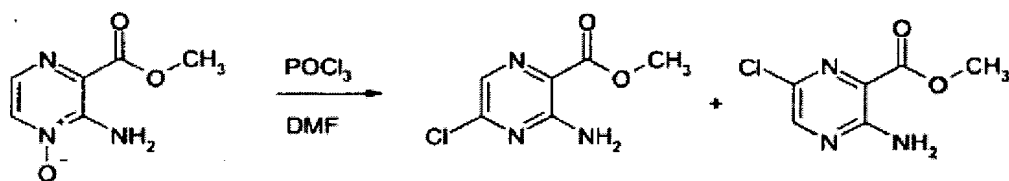
A (3-bromo-2-cloro-6-fluorfenil)-acetonitrila (8,15 g) foi dissolvida em ácido sulfúrico concentrado (50% em peso em água) (90 mL). A mistura ficou muito quente e foi, a seguir, aquecida até o refluxo por 3 horas. A mistura reacional foi deixada esfriar e foi armazenada em temperatura ambiente por 16 horas. A mistura foi extraída duas vezes com diclorometano. As fases orgânicas foram combinadas, secas em sulfato de magnésio e concentradas para produzir ácido (3-bromo-2-cloro-6-fluorfenil)-acético como um sólido branco-sujo (8,3 g).

RMN ^1H (CDCl_3): 3,94 (d, 2H), 6,94 (t, 1H), 7,56 (dd, 1H) ppm.

12. Ésteres de aminopirazina substituídos

Embora ésteres 3-amino-5-pirazinocarboxilato sejam conhecidos na literatura, particularmente nas publicações de E. J. Cragoe et al, por exemplo, J. Med. Chem., 10, 66, (1967), J. Med. Chem., 10, 899, (1967) e J. Med. Chem., 10, 598, (1967), é algumas vezes necessário fazer alguns desses compostos usando sínteses mais curtas ou mais convenientes.

Exemplo 12.1: Preparação do éster metílico do ácido 3-amino-5-cloropirazino-2-carboxílico e éster metílico do ácido 3-amino-6-cloropirazino-2-carboxílico

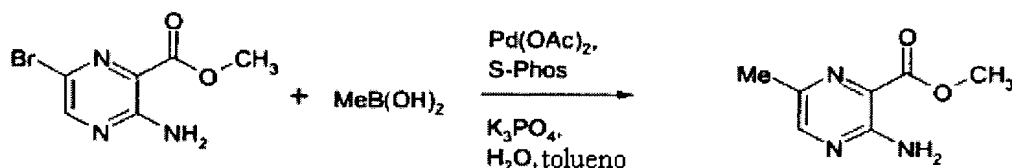


Éster metílico do ácido 3-amino-4-oxipirazino-2-carboxílico (3,2 g) (preparado de acordo com GB 1.248.146) foi agitado como uma suspensão em dimetilformamida seca (32 mL). Oxicloreto de fósforo (6,5 mL) foi adicionado numa taxa para manter a mistura reacional abaixo do refluxo. Depois da adição total do oxicloreto, a reação foi armazenada em temperatura ambiente por 30 minutos e, a seguir, vertida em gelo. A mistura foi armazenada em temperatura ambiente de

um dia para o outro. O precipitado foi filtrado e seco sob vácuo para produzir éster metílico do ácido 3-amino-5-cloropirazino-2-carboxílico e éster metílico do ácido 3-amino-6-cloropirazino-2-carboxílico como um sólido amarelo de fluxo livre (2,05 g), o qual formou uma mistura inseparável. Essa mistura foi usada como o material de partida para a preparação do Composto C82 e do Composto C83 da Tabela C pela via descrita no Esquema 1 e Esquema 2. O Composto C82 e o Composto C83 da Tabela C foram separados no passo final por cromatografia em coluna de sílica gel (eluente: acetato de etila/hexano).

RMN ^1H (CDCl_3): 4,00 (s, 3H), 7,95 (s, 0,66H, 6-cloro isômero), 8,23 (s, 0,33H, 5-cloroisômero) ppm,

Exemplo 12.2: Preparação do éster metílico do ácido 3-amino-6-metilpirazino-2-carboxílico



Éster metílico do ácido 3-amino-6-bromopirazino-2-carboxílico (1,0 g), acetato de paládio (0,101 g) e S-Phos (2'-dicicloexilfosfino-2,6-dimetóxi-1,1'-bifenil) foram colocados num frasco, com tolueno (15 mL) e água (3 gotas). Ácido metilborônico (0,394 g) e fosfato de potássio (1,71 g) foram adicionados e a mistura reacional foi submetida ao refluxo por 24 horas. Depois de deixar a mistura reacional esfriar, a mistura foi diluída com ácido clorídrico aquoso (1 M) e extraída com acetato de etila. O solvente foi evaporado e o resíduo foi purificado por cromatografia em coluna em sílica gel (eluente: éter dietílico) para produzir éster metílico do ácido 3-amino-6-metilpirazino-2-carboxílico como um sólido amarelo (0,114 g).

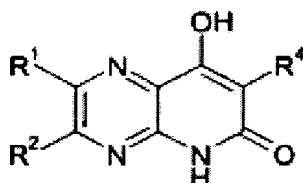
RMN ^1H (CDCl_3): 2,40 (s, 3H), 3,92 (s, 3H), 6,21 (bs, 2H), 8,03 (s, 1H) ppm.

Os compostos mencionados nas Tabelas A até D a seguir podem ser preparados de modo análogo.

Tabela A:

Compostos de Fórmula (Ia), isto é, compostos de fórmula (I)

5 em que R³ é hidrogênio e R⁵ é hidroxila.



(Ia)

Comp No.	R ¹	R ²	R ⁴	¹ H NMR (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
A1	H	H	2,4-di-C1- fenil-	(d6-DMSO): 7.37 (d, 1H), 7.49 (dd, 1H), 7.79 (d, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.68 (d, 1H), 11.6 (s, 1H), 12.3 (s, 1H).
A2	H	H	2-C1-fenil-	7.38-7.42 (m, 3H), 7.52-7.57 (m, 1H), 8.02 (bs, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
A3	H	H	2,5-di-C1- fenil-	(CDC13 + d6-DMSO): 7.31 (dd, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
A4	H	H	2,3-di-C1- fenil-	(CDC13 + d6-DMSO): 7.29-7.35 (m, 2H), 7.54 (dd, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.73 (d, 1H).
A5	H	H	2,6-di-C1- fenil-	(d6-DMSO): 7.38 (t, 1H), 7.49 (d, 2H), 8.52 (d, 1H), 8.64 (d, 1H), 11.7 (s, 1H), 12.3 (s, 1H).
A6	H	H	2-Me- fenil-	(d6-DMSO): 2.12 (s, 3H), 7.10-7.14 (m, 1H), 7.19-7.28 (m, 3H), 8.55 (d, 1H), 8.66 (d, 1H), 11.1 (s, 1H), 12.2 (s, 1H).
A7	H	H	2-MeO- fenil-	(d6-DMSO): 3.62 (s, 3H), 6.90 (t, 1H), 6.99 (d, 1H), 7.08 (dd, 1H), 7.28 (t, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.56 (d, 1H), 10.8 (s, 1H), 12.0 (s, 1H).
A8	H	H	2-F ₃ C- fenil-	7.39 (d, 1H), 7.58 (t, 1H), 7.68 (t, 1H), 7.83 (d, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
A9	H	H	3,5-di-C1-2-MeO-fenil-	(d6-DMSO): 3.60 (s, 3H), 7.27 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.68 (s, 1H), 11.59 (s, 1H), 12.3 (s, 1H).
A10	H	H	2-C1-4-F- fenil-	(d6-DMSO): 7.28 (dt, 1H), 7.39 (dt, 1H), 7.53 (dd, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.68 (d, 1H), 11.5 (s, 1H), 12.3 (s, 1H).
A11	H	H	2-C1-3,6-di-F-fenil-	(d6-DMSO): 7.34-7.42 (m, 1H), 7.51-7.59 (m, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.72 (d, 1H), 12.0 (bs, 1H), 12.4 (s, 1H).
A12	H	H	2,6-di-Et-4-Me-fenil-	1.11 (t, 6H), 2.38 (s, 3H), 2.39- 2.51 (m, 4H), 7.05 (s, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.67 (d, 1H).
A13	H	H	2-F ₃ CO- fenil-	7.39-7.44 (m, 2H), 7.49 (t, 2H), 8.10 (bs, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.65 (d, 1H), 9.77 (bs, 1H).
A14	H	H	2,6-di-C1-4-F ₃ C-fenil-	(d6-DMSO): 8.04 (s, 2H), 8.61 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 12.0 (s, 1H), 12.42 (s, 1H).
A15	H	H	2-F-fenil-	-
A16	H	H	6-F-2-F ₃ C- fenil-	-
A17	H	H	4-F-2-F ₃ C- fenil-	-
A18	H	H	2-Br-4-F- fenil-	-

Comp No.	R ¹	R ²	R ⁴	¹ H NMR (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
A19	H	H	5-Cl-2-F ₃ C- fenil-	-
A20	H	H	2,4-di-MeO- fenil-	-
A21	H	H	2,3,6-tri-Cl- fenil-	-
A22	H	H	fenil-	7.25 (d, 1H), 7.37 (t, 2H), 7.50 (d, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
A23	H	H	2-Cl-6-F- fenil-	(CD3OH): 7.15 (t, 1H), 7.40-7.50 (m, 2H), 8.58 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
A24	H	H	2-Br-fenil-	(CD3OH): 7.21-7.35 (m, 2H), 7.40 (m, 1H), 7.71 (dd, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
A25	H	H	naft-3-ila-	-
A26	Br	H	2,6-di-Cl- fenil-	(d6-DMSO): 7.45 (t, 1H), 7.55 (d, 2H), 9.78 (s, 1H), 11.9 (bs, 1H), 12.6 (s, 1H).
A27	Cl	H	2,6-di-Cl- fenil-	(d6-DMSO): 7.45 (t, 1H), 7.55 (d, 2H), 9.81 (s, 1H), 11.9 (bs, 1H), 12.6 (s, 1H).
A28	H	H	2,3,5-tri-Cl- fenil-	(d6-DMSO): 7.40 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
A29	H	H	naft-2-ila	7.50 (m, 5H), 7.95 (m, 2H), 8.55 (d, 1H), 8.70 (d, 1H), 11.1 (s, 1H), 12.3 (s, 1H).
A30	H	H	2,4,6-tri-Me- fenil-	(d6-DMSO): 2.30 (s, 3H), 2.33 (s, 6H), 6.98 (s, 2H), 8.48 (d, 1H), 8.61 (d, 1H), 10.56 (s, 1H).
A31	H	H	6-Cl-2-F ₃ C- fenil-	7.51 (t, 1H), 7.73 (d, 2H), 8.49 (d, 1H), 8.64 (d, 1H), 10.75 (s, 1H).
A32	H	H	2-Cl-3-F ₃ C- fenil-	7.55 (t, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).
A33	H	H	2-Cl-6-F-5-Me-fenil-	(d6-DMSO): 2.24 (d, 3H), 7.30 (m, 2H), 8.54 (d, 1H), 8.65 (d, 1H), 11.70 (s, 1H), 12.16 (s, 1H).
A34	H	H	2-Cl-5-F ₃ C- fenil-	(d6-DMSO): 7.72 (s, 1H), 7.78 (m, 2H), 8.58 (d, 1H), 8.69 (d, 1H), 11.72 (s, 1H), 12.35 (s, 1H).
A35	H	H	2-Cl-6-F-3-Me-fenil-	(d6-DMSO): 2.30 (s, 3H), 7.15 (t, 1H), 7.40 (t, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.65 (d, 1H), 11.7 (s, 1H), 12.3 (s, 1H).
A36	H	H	2,6-di-Cl-4-F ₃ CO- fenil-	(CD3OH): 7.47 (d, 1H), 7.66 (d, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.68 (d, 1H).
A37	H	H	2,5-di-Me- fenil-	(d6-DMSO): 2.05 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 6.95 (s, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.65 (d, 1H), 11.0 (s, 1H), 12.2 (s, 1H).
A38	H	H	2-Cl-5-F- fenil-	(d6-DMSO): 7.25 (m, 2H), 7.57 (dd, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.67 (d, 1H), 11.60 (s, 1H), 12.29 (s, 1H).
A39	H	H	2,4-di-Cl-5-F-fenil-	(d6-DMSO): 7.50 (d, 1H), 7.91 (d, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.70 (d, 1H), 11.75 (s, 1H), 12.36 (s, 1H).
A40	H	H	3-Br-2-Cl-6-F-fenil-	(d6-DMSO): 7.50 (t, 1H), 7.88 (dd, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.70 (d, 1H), 12.00 (s, 1H), 12.41 (s, 1H).
A41	H	H	2,3-di-MeO- fenil-	3.83 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 6.95 (dd, 1H), 7.00 (dd, 1H), 7.17 (t, 1H), 8.04 (bs, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.59 (d, 1H), 9.93 (bs, 1H).
A42	H	H	2-MeO-5-F ₃ CO- fenil-	3.87 (s, 3H), 7.10 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.67 (dd, 1H), 8.00 (bs, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.61 (d, 1H), 9.44 (bs, 1H).
A43	H	H	2-Br-4-F ₃ C- fenil-	7.50-7.52 (d, 1H), 7.68-7.70 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.11 (bs, 1H), 9.50 (bs, 1H).
A44	H	H	2-Cl-3,6-di-F-5-O2N- fenil-	(CD3OH): 8.03 (t, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.51 (d, 1H), 10.03 (bs, 1H).

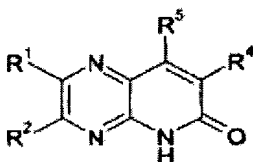
Comp No.	R ¹	R ²	R ⁴	¹ H NMR (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
A45	H	H	2-F2HCO-fenil-	(CD ₃ OH): 6.63 (t, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.31 (t, 1H), 7.38-7.47 (m, 2H), 8.54 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
A46	H	H	2-C1-4,5-di-F-fenil-	(CD ₃ OH): 7.32 (dd, 1H), 7.48 (dd, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
A47	H	H	2,3-di-C1-6-F-fenil-	(CD ₃ OH): 7.18 (t, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
A48	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	(d ₆ -DMSO): 2.60 (s, 3H), 7.35 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 8.50 (s, 1H), 11.8 (s, 1H), 12.3 (s, 1H).
A49	Me	H	2-C1-3,6-di-F-fenil-	2.65 (s, 3H), 7.35 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 8.60 (s, 1H), 12.2 (s, 1H).

Código:

s = singleto; d = duplete; t = tripleto; bs = singleto largo; dd = duplete duplo; dt = tripleto duplo; m = multiplete.

Tabela B:

- 5 Compostos de Fórmula (Ib), isto é, compostos de fórmula (I) em que R³ é hidrogênio e R⁵ é conforme definido para os compostos de fórmula (I) diferentes de hidróxi.



(Ib)

Comp No.	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
B1	H	H	2,4-di-C1-fenil-	Me(CO)0-	2,28 (s, 3H), 7,23 (d, 1H), 7,36 (dd, 1H), 7,56 (d, 1H), 8,53-8,59 (m, 2H), 9,98 (bs, 1H),
B2	H	H	2-C1-4-F-fenil-	i-Pr-(CO)0-	1,11 (d, 3H), 1,17 (d, 3H), 2,79 (septeto, 1H), 7,09 (dt, 1H), 7,25-7,31 (m, 2H), 8,52-8,60 (m, 2H), 9,87 (bs, 1H),
B3	H	H	2-C1-4-F-fenil-	Et(CO)0-	1,14 (t, 3H), 2,50-2,61 (m, 2H), 7,09 (dt, 1H), 7,25-7,32 (m, 2H), 8,45 (bs, 1H), 8,58 (bs, 1H), 10,1 (s, 1H),
B4	H	H	2-C1-3,6-di-F-fenil-	i-Pr-(CO)0-	1,17 (dd, 6H), 2,81 (septeto, 1H), 7,08-7,13 (m, 1H), 7,21-7,27 (m, 1H), 8,56 (bs, 1H), 8,59 (bs, 1H), 9,91 (bs, 1H),
B5	H	H	2-C1-3,6-di-F-fenil-	Me(CO)0-	2,30 (s, 3H), 7,09-7,15 (m, 1H), 7,22-7,30 (m, 1H), 8,56 (d, 1H), 8,59 (d, 1H), 9,56 (bs, 1H),

Comp No.	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
B6	H	H	2-C1-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,21 (s, 9H), 7,08-7,13 (m, 1H), 7,21-7,27 (m, 1H), 8,55-8,57 (m, 2H), 9,51 (bs, 1H),
B7	H	H	2-F3C0-fenil-	Et(CO)0-	1,13 (t, 3H), 2,49-2,63 (m, 2H), 7,37-7,43 (m, 3H), 7,47-7,53 (m, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,56 (d, 1H), 9,69 (s, 1H),
B8	H	H	2-F3C0-fenil-	Me(CO)0-	2,28 (t, 3H), 7,37-7,43 (m, 3H), 7,48-7,53 (m, 1H), 8,54 (d, 1H), 8,58 (d, 1H), 10,1 (bs, 1H),
B9	H	H	2,6-di-Et-4-Me-, fenil-	Me(CO)0-	1,12 (t, 6H), 2,19 (s, 3H), 2,38 (s, 3H), 2,40-2,48 (m, 4H), 7,00 (s, 2H), 8,51 (s, 2H), 9,25 (bs, 1H),
B10	H	H	2,6-di-C1-fenil-	Me(CO)0-	2,27 (s, 3H), 7,32-7,38 (m, 1H), 7,45 (d, 2H), 8,53-8,58 (m, 2H), 9,49 (bs, 1H),
B11	H	H	2,6-di-C1-fenil-	Et(CO)0-	1,11 (t, 3H), 2,56 (q, 2H), 7,34 (t, 1H), 7,46 (d, 2H), 8,56 (d, 1H), 8,59 (d, 1H), 9,95 (bs, 1H),
B12	H	H	2,6-di-C1-fenil-	EtO(CO)0-	(d6-DMSO): 1,18 (t, 3H), 4,19 (q, 2H), 7,53 (t, 1H), 7,63 (d, 2H), 8,63 (d, 1H), 8,76 (d, 1H),-
B13	H	H	2,6-di-C1-fenil-	t-Bu(CO)0-	(d6-DMSO): 1,06 (s, 9H), 7,51 (t, 1H), 7,62 (d, 2H), 8,63 (d, 1H), 8,73 (d, 1H), 13,19 (s, 1H),
B14	H	H	2,6-di-C1-fenil-	n-Pr(CO)0-	(d6-DMSO): 0,69 (t, 3H), 1,40-1,49 (m, 2H), 2,47 (t, 2H), 7,51 (t, 1H), 7,62 (d, 2H), 8,62 (d, 1H), 8,74 (d, 1H), 13,1 (s, 1H),
B15	H	H	2,6-di-C1-4-F3C-fenil-	Me(CO)0-	2,31 (s, 3H), 7,72 (s, 2H), 8,59 (d, 1H), 8,67 (d, 1H), 11,02 (bs, 1H),
B16	H	H	2,6-di-C1-4-F3C-fenil-	c-Pr(CO)0-	1,12-0,99 (m, 4H), 1,83-1,77 (m, 1H), 7,72 (s, 2H), 8,60 (d, 1H), 8,64 (d, 1H), 10,68 (bs, 1H),
B17	H	H	2-F3C0-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,18 (s, 9H), 7,35-7,41 (m, 3H), 7,46-7,52 (m, 1H), 8,52 (s, 2H), 9,39 (bs, 1H),
B18	H	H	2-C1-3,6-di-F-fenil-	MeS(O)20-	(CD3OH): 3,56 (s, 3H), 7,20-7,70 (m, 1H), 7,38-7,44 (m, 1H), 8,67 (s, 1H), 8,72 (s, 1H),

Comp No.	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
B19	Br	H	2,6-di-Cl-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,11 (d, 3H), 1,17 (d, 3H), 2,83 (septeto, 1H), 7,30-7,35 (m, 2H), 7,43-7,46 (m, 1H), 8,59 (s, 1H),
B20	Cl	H	2,6-di-Cl-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,11 (d, 3H), 1,17 (d, 3H), 2,83 (septeto, 1H), 7,30-7,35 (m, 2H), 7,43-7,46 (m, 1H), 8,67 (s, 1H),
B21	H	H	2,3-di-Cl-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,05 (d, 3H), 1,15 (d, 3H), 2,75 (m, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,30 (t, 1H), 7,55 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,55 (d, 1H), 9,50 (s, 1H),
B22	H	H	2-Cl-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,15 (s, 9H), 7,25 (m, 3H), 7,50 (d, 1H), 8,50 (m, 2H), 10,0 (s, 1H),
B23	H	H	2,3,6-tri-F-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,25 (s, 9H), 6,95 (m, 1H), 7,25 (m, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,60 (d, 1H), 10,2 (s, 1H),
B24	H	H	2,3,6-tri-F-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,20 (d, 6H), 2,85 (m, 1H), 6,95 (m, 1H), 7,25 (m, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,60 (d, 1H), 10,4 (s, 1H),
B25	H	H	2-Cl-fenil-	Me(CO)0-	2,23 (s, 3H), 7,28-7,31 (m, 1H), 7,34-7,43 (m, 2H), 7,53 (dd, 1H), 8,54 (dd, 2H), 9,69 (bs, 1H),
B26	H	H	3-Cl-fenil-	Me(CO)0-	2,32 (s, 3H), 7,36-7,39 (m, 1H), 7,40-7,43 (m, 2H), 7,48 (s, 1H), 8,54 (s, 2H), 9,7 (bs, 1H),
B27	H	H	4-Cl-fenil-	Me(CO)0-	2,31 (s, 3H), 7,41-7,48 (m, 4H), 8,53 (s, 2H), 9,67 (bs, 1H),
B28	H	H	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	Me-C-C-CH ₂ O(CO)0-	1,90 (t, 3H), 4,80 (m, 1H), 4,98 (m, 1H), 7,03 (m, 1H), 7,30 (m, 1H), 8,60 (m, 1H), 8,80 (m, 1H),
B29	H	H	3,4-di-Cl-fenil-	Me(CO)0-	2,34 (s, 3H), 7,34 (dd, 1H), 7,56 (d, 1H), 7,60 (d, 1H), 8,55 (bs, 2H), 9,70 (bs, 1H),
B30	H	H	2,4,6-tri-Me-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,01 (d, 6H), 2,12 (s, 6H), 2,30 (s, 3H), 2,70 (septeto, 1H), 6,93 (bs, 2H), 8,54 (m, 2H), 9,84 (bs, 1H),
B31	H	H	6-Cl-2-F-3-Cl-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,03 (d, 3H), 1,06 (d, 3H), 2,72 (septeto, 1H), 7,52 (t, 1H), 7,12 (d, 2H), 8,54 (d, 1H), 8,60 (d, 1H), 10,32 (bs, 1H),

Comp No.	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
B32	H	H	2-C1-3-F3C-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,04 (d, 3H), 1,10(d, 3H), 2,74 (m, 1H), 7,43 (m, 2H), 7,82 (dd, 1H), 8,62 (d, 1H) 8,64 (d, 1H), 9,89 (bs, 1H),
B33	H	H	2,4,6-tri-Me-fenil-	Me(CO)0-	2,13 (s, 6H), 2,19 (s, 3H), 2,32 (s, 3H), 6,94 (s, 2H), 8,53 (s, 2H), 9,45 (bs, 1H),
B34	H	H	2-C1-3,6-di-F-fenil-	i-PrS(0)20-	1,50 (d, 6H), 3,82 (m, 1H), 7,20 (m, 1H), 7,32 (m, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,65 (m, 1H),
B35	H	H	2-C1-3,6-di-F-fenil-	t-BuO-(CO)0-	1,45 (s, 9H), 7,09 (m, 1H), 7,23 (m, 1H), 8,58 (d, 1H), 8,65 (d, 1H), 11,07 (bs, 1H),
B36	H	H	2-C1-6-F-5-Me-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,11 (d, 3H), 1,12 (d, 3H), 2,78 (septeto, 1H), 7,20 (m, 2H), 8,53 (d, 1H), 8,56 (d, 1H), 9,83 (bs, 1H),
B37	H	H	2-C1-6-F-5-Me-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,17 (s, 9H), 2,28 (d, 3H), 7,23 (dd, 2H), 8,54 (d, 1H), 8,58 (d, 1H), 10,34 (bs, 1H),
B38	H	H	2-C1-5-F3C-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,07 (d, 3H), 1,14 (d, 3H), 2,76 (septeto, 1H), 7,65 (s, 1H), 7,65 (s, 2H), 8,56 (d, 1H), 8,62 (d, 1H), 10,69 (bs, 1H),
B39	H	H	2-C1-5-F3C-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,15 (s, 9H), 7,57 (s, 1H), 7,64 (s, 2H), 8,56 (d, 1H), 8,61 (d, 1H), 10,96 (bs, 1H),
B40	H	H	2-C1-3,6-di-F-fenil-	4-02N-C6H4-(CO)0	7,05 (m, 1H), 7,22 (m, 1H), 8,20-8,40 (m, 4H), 8,50 (d, 1H), 8,65 (d, 1H),
B41	H	H	2,6-di-C1-4-F3C-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,16 (s, 9H), 7,80 (s, 2H), 8,55 (d, 1H), 8,60 (d, 1H), 10,1 (bs, 1H),
B42	H	H	2,6-di-C1-4-F3CO-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,18 (s, 9H), 7,22 (d, 1H), 7,50 (d, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,60 (d, 1H), 10,2 (bs, 1H),
B43	H	H	fenil-	t-Bu(CO)0-	1,22 (s, 9H), 7,40 (m, 5H), 8,50 (s, 2H), 9,72 (bs, 1H),
B44	H	H	2-02N-4-F3C-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,22 (s, 9H), 7,62 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 8,50 (s, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,60 (d, 1H),
B45	H	H	2-C1-5-F-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,10 (d, 3H), 1,16 (d, 3H), 2,78 (septeto, 1H), 7,04 (dd, 1H), 7,10 (m, 1H), 7,48 (dd, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,60 (d, 1H),

Comp No.	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
B46	H	H	2-C1-5-F-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,18 (s, 9H), 7,04 (dd, 1H), 7,10 (m, 1H), 7,47 (dd, 1H), 8,54 (d, 1H), 8,56 (d, 1H), 9,95 (bs, 1H),
B47	H	H	2,4-di-C1-5-F-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,15 (d, 3H), 1,20 (d, 3H), 2,80 (septeto, 1H), 7,12 (d, 1H), 7,58 (d, 1H), 8,54 (d, 1H), 8,57 (d, 1H), 9,92 (d, 1H),
B48	H	H	2,4-di-C1-5-F-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,21 (s, 9H), 7,12 (d, 1H), 7,58 (d, 1H), 8,54 (d, 1H), 8,57 (d, 1H), 9,95 (bs, 1H),
B49	H	H	3-Br-2-C1-6-F-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,19 (s, 9H), 7,03 (t, 1H), 7,70 (dd, 1H), 8,54 (d, 1H), 8,56 (d, 1H), 9,81 (bs, 1H),
B50	H	H	3-Br-2-C1-6-F-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,13 (d, 3H), 1,14 (d, 3H), 2,79 (septeto, 1H), 7,03 (t, 1H), 7,70 (dd, 1H), 8,54 (d, 1H), 8,56 (d, 1H), 9,69 (bs, 1H),
B51	H	H	2-Br-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,14 (s, 9H), 7,29 (m, 2H), 7,40 (m, 1H), 7,69 (dd, 1H), 8,54 (d, 1H), 8,56 (d, 1H),
B52	H	H	2,3-di-MeO-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,08 (d, 3H), 1,14 (d, 3H), 2,74 (septeto, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,89 (s, 3H), 6,79 (d, 1H), 6,99 (dd, 1H), 7,09 (t, 1H), 8,49 (m, 2H), 9,71 (bs, 1H),
B53	H	H	2,3-di-MeO-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,16 (s, 9H), 3,80 (s, 3H), 3,89 (s, 3H), 6,79 (d, 1H), 6,98 (dd, 1H), 7,09 (t, 1H), 8,48 (m, 2H), 9,42 (bs, 1H),
B54	H	H	2-Br-4-F3C-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,16 (s, 9H), 7,41-7,43 (d, 1H), 7,65-7,67 (d, 1H), 7,98 (d, 1H), 8,56 (d, 1H), 8,57 (d, 1H), 9,76 (bs, 1H),
B55	H	H	2-MeO-5-F3CO-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,11 (d, 3H), 1,16 (d, 3H), 2,77 (septeto, 1H), 3,86 (s, 3H), 7,08 (d, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,69 (dd, 1H), 8,53 (m, 2H), 9,69 (bs, 1H),
B56	H	H	2-MeO-5-F3CO-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,18 (s, 9H), 3,86 (s, 3H), 7,07 (d, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,68 (dd, 1H), 8,51 (m, 2H), 9,45 (bs, 1H),
B57	H	H	2-C1-3,6-di-F-5-02N-fenil-	t-Bu(CO)0-	1,21 (s, 9H), 8,01 (dd, 1H), 8,58 (d, 1H), 8,62 (d, 1H), 10,1 (bs, 1H),
B58	H	H	2-F2HCO-fenil-	i-Pr(CO)0-	1,12 (d, 3H), 1,16 (d, 3H), 2,77 (septeto, 1H), 6,50 (dd, 1H), 7,31 (m, 3H), 7,46 (m, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,54 (d, 1H), 10,15 (bs, 1H),

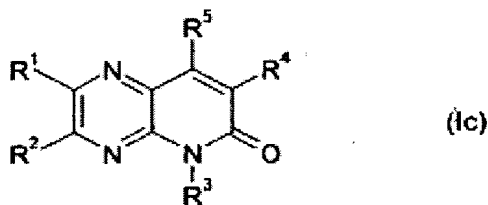
Comp No.	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
B59	H	H	2-F2HCO-fenil-	t-Bu(CO)O-	1,18 (s, 9H), 6,50 (dd, 1H), 7,30 (m, 3H), 7,45 (m, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,53 (d, 1H), 10,13 (bs, 1H),
B60	H	H	2,3-di-C1-6-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	1,21 (s, 9H), 7,03 (t, 1H), 7,55 (dd, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,54 (d, 1H),
B61	H	H	2-C1-4,5-di-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	1,18 (s, 9H), 7,12 (dd, 1H), 7,34 (dd, 1H), 8,56 (dd, 2H), 9,77 (bs, 1H),
B62	H	H	2-C1-6-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	1,21 (s, 9H), 7,12 (dd, 1H), 7,39-7,42 (m, 2H), 8,62 (d, 1H), 8,70 (d, 1H),

Código:

s = singleto; d = duplete; t = tripleto; q = quarteto; bs = singleto largo; dd = duplete duplo; dt = tripleto duplo; sept = septeto; m = multiplete.

5 Tabela C:

Compostos de Fórmula (Ic), isto é, um composto de Fórmula (I), em que R³ é conforme definido para compostos de Fórmula (I) diferentes de hidrogênio e R⁵ é conforme definido para os compostos de Fórmula (I) diferentes de hidróxi.



10

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C1	H	H	Et	2-C1-4-F-fenil-	Et(CO) O-	-	1.12 (t, 3H), 1.39 (t, 3H), 2.48-2.63 (m, 2H), 4.59 (q, 2H), 7.08 (dt, 1H), 7.26-7.30 (m, 2H), 8.49 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C3	H	H	Et	2-C1-4-F-fenil-	i-Pr(CO) O-	-	1.10 (d, 3H), 1.17 (d, 3H), 1.39 (t, 3H), 2.79 (septeto, 1H), 4.59 (q, 2H), 7.08 (dt, 1H), 7.24-7.30 (m, 2H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C5	H	H	Me	2-C1-4-F- fenil-	i- Pr(CO) O-	-	1.09 (d, 3H), 1.17 (d, 3H), 2.79 (septeto, 1H), 3.88 (s, 3H), 7.08 (dt, 1H), 7.23-7.30 (m, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C6	H	H	Et	2,4-di- Cl- fenil-	Me(CO) O-	-	1.40 (t, 3H), 2.28 (s, 3H), 4.55 (q, 2H), 7.22 (s, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C7	H	H	i-Pr	2,4-di- Cl- fenil-	Me(CO) O-	-	1.65 (dd, 6H), 2.28 (s, 3H), 5.91 (septeto, 1H), 7.23 (d, 1H), 7.34 (dd, 1H), 7.53 (d, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C9	H	H	MeO - CH2 CH2-	2,4-di- Cl- fenil-	Me(CO) O-	-	2.28 (s, 3H), 3.39 (s, 3H), 3.79 (t, 2H), 4.79 (t, 2H), 7.25 (d, 1H), 7.35 (dd, 1H), 7.56-7.58 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C11	H	H	Et	2-C1- 3,6-di- F- fenil-	i- Pr(CO) O-	-	1.17 (dd, 6H), 1.39 (t, 3H), 2.81 (septeto, 1H), 4.59 (q, 2H), 7.06-7.12 (m, 1H), 7.19-7.26 (m, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C12	H	H	Me	2-C1- 3,6-di- F- fenil-	i- Pr(CO) O-	-	1.13-1.19 (m, 6H), 2.81 (septeto, 1H), 3.89 (s, 3H), 7.07-7.12 (m, 1H), 7.21-7.27 (m, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C13	H	H	Et	2-C1- 3,6-di- F- fenil-	Me(CO) O-	-	1.39 (t, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.59 (q, 2H), 7.08-7.13 (m, 1H), 7.21-7.27 (m, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C14	H	H	allil	2-C1- 3,6-di- F- fenil-	Me(CO) O-	-	2.29 (s, 3H), 5.15 (d, 2H), 5.20-5.30 (m, 2H), 5.97-6.07 (m, 1H), 7.07-7.13 (m, 1H), 7.21-7.26 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C15	H	H	MeO - CH ₂ - CH ₂ -	2-C1-3,6-di- F- fenil-	i-Pr(CO) O-	-	1.17 (dd, 6H), 2.78-2.86 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 3.79 (t, 2H), 4.79 (t, 2H), 7.08-7.13 (m, 1H), 7.21-7.28 (m, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C16	H	H	Me	2-C1-3,6-di- F- fenil-	Me(CO) O-	-	2.29 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 7.09-7.15 (m, 1H), 7.22-7.28 (m, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C17	H	H	n-Bu	2-C1-3,6-di- F- fenil-	Me(CO) O-	-	0.99 (t, 3H), 1.41-1.52 (m, 2H), 1.72-1.81 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 4.50-4.56 (m, 2H), 7.08-7.14 (m, 1H), 7.22-7.28 (m, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).
C18	H	H	Me	2-C1-3,6-di- F- fenil-	MeO-	-	3.83 (s, 3H), 4.09 (s, 3H), 7.08-7.13 (m, 1H), 7.20-7.27 (m, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C19	H	H	i-Pr	2-C1-3,6-di- F- fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.20 (s, 9H), 1.67 (d, 6H), 5.93 (septeto, 1H), 7.04-7.11 (m, 1H), 7.19-7.24 (m, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.58 (d, 1H).
C20	H	H	Me	2-C1-3,6-di- F- fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.20 (s, 9H), 3.89 (s, 3H), 7.06-7.11 (m, 1H), 7.19-7.26 (m, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C21	H	H	Et	2-C1-3,6-di- F- fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.20 (s, 9H), 1.39 (t, 3H), 4.60 (q, 2H), 7.06-7.12 (m, 1H), 7.19-7.26 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C22	H	H	CH ₂ = CH- CH ₂ - CH ₂ -	2-F ₃ CO- fenil-	Me(CO) O-	-	2.25 (s, 3H), 2.54 (q, 2H), 4.59 (t, 2H), 4.99-5.11 (m, 2H), 5.82-5.93 (m, 1H), 7.35-7.41 (m, 3H), 7.47-7.51 (m, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C23	H	H	i-Pr	2-F3C0-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.18 (s, 9H), 1.66 (d, 6H), 5.92 (septeto, 1H), 7.32-7.39 (m, 3H), 7.43-7.48 (m, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.53 (d, 1H).
C24	H	H	Ph-CH2-	2-F3C0-fenil-	Me(CO)O-	-	2.25 (s, 3H), 5.67 (d, 1H), 5.80 (d, 1H), 7.21-7.31 (m, 3H), 7.35-7.43 (m, 3H), 7.47-7.55 (m, 3H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C25	H	H	allil	2-F3C0-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.19 (s, 9H), 5.14-5.18 (m, 2H), 5.19-5.27 (m, 2H), 5.97-6.08 (m, 1H), 7.32-7.40 (m, 3H), 7.43-7.49 (m, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.57 (d, 1H).
C26	H	H	Et	2-F3C0-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.18 (s, 9H), 1.37 (t, 3H), 4.59 (q, 2H), 7.33-7.41 (m, 3H), 7.43-7.50 (m, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.58 (d, 1H).
C27	H	H	Et	2-F3C0-fenil-	Me(CO)O-	-	1.38 (t, 3H), 2.27 (s, 3H), 4.59 (q, 2H), 7.35-7.42 (m, 3H), 7.47-7.51 (m, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C28	H	H	Me	2-F3C0-fenil-	Et(CO)O-	-	1.12 (t, 3H), 2.47-2.64 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 7.35-7.42 (m, 3H), 7.46-7.52 (m, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C29	H	H	Me	2-F3C0-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.18 (s, 9H), 3.88 (s, 3H), 7.32-7.40 (m, 3H), 7.45-7.50 (m, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C30	H	H	allil	2,6-di-Cl-fenil-	Et(CO)O-	-	1.11 (t, 3H), 2.56 (q, 2H), 5.16-5.29 (m, 4H), 5.99-6.09 (m, 1H), 7.31-7.36 (m, 1H), 7.44 (d, 2H), 8.53 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C31	H	H	Et	2,6-di-Cl-fenil-	Et(CO)O-	-	1.10 (t, 3H), 1.39 (t, 3H), 2.56 (q, 2H), 4.61 (q, 2H), 7.31-7.36 (m, 1H), 7.44 (d, 2H), 8.52 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C32	H	H	Me	2,6-di-Cl-fenil-	Et(CO)O-	-	1.10 (t, 3H), 2.56 (q, 2H), 3.89 (s, 3H), 7.32-7.37 (m, 1H), 7.46 (d, 2H), 8.53 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).
C33	H	H	Me	2,6-di-Cl-fenil-	Me(CO)O-	-	2.27 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 7.31-7.35 (m, 1H), 7.44 (d, 2H), 8.51 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C34	H	H	MeO-CH ₂ -CH ₂ -	2,6-di-Cl-fenil-	Et(CO)O-	-	1.10 (t, 3H), 2.55 (q, 2H), 3.38 (s, 3H), 3.79 (t, 2H), 4.80 (t, 2H), 7.30-7.35 (m, 1H), 7.43 (d, 2H), 8.52 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C35	H	H	Me	2,6-di-Cl-fenil-	(E)-Me-CH=CH-(CO)O-	-	1.92 (dd, 3H), 3.89 (s, 3H), 5.98 (dd, 1H), 7.10-7.19 (m, 1H), 7.32 (t, 1H), 7.44 (d, 2H), 8.53 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C36	H	H	Me	2,6-di-Cl-fenil-	EtO(CO)O-	-	1.36 (t, 3H), 3.92 (s, 3H), 4.32 (q, 2H), 7.38 (t, 1H), 7.48 (d, 2H), 8.59 (d, 1H), 8.69 (d, 1H).
C37	H	H	Me	2,6-di-Cl-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.21 (s, 9H), 3.94 (s, 3H), 7.35 (t, 1H), 7.48 (d, 2H), 8.57 (d, 1H), 8.66 (d, 1H).
C38	H	H	Me	2,6-di-Cl-fenil-	n-Pr(CO)O-	-	0.83 (t, 3H), 1.57-1.65 (m, 2H), 2.50 (t, 2H), 3.89 (s, 3H), 7.30-7.34 (m, 1H), 7.43 (d, 2H), 8.51 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C39	H	H	allil	2,6-di-Cl-fenil-	EtO(CO)O-	-	1.31 (t, 3H), 4.29 (q, 2H), 5.17 (d, 2H), 5.19-5.28 (m, 2H), 5.99-6.09 (m, 1H), 7.32 (t, 1H), 7.43 (d, 2H), 8.53 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C40	H	H	n-Bu	2,6-di-Cl-fenil-	Me(CO) O-	-	0.99 (t, 3H), 1.47 (sext, 2H), 1.73-1.80 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 4.50-4.57 (m, 2H), 7.32 (t, 1H), 7.44 (d, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C41	H	H	Et	2,6-di-Cl-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.21 (s, 9H), 1.42 (t, 3H), 4.66 (q, 2H), 7.34 (t, 1H), 7.47 (d, 2H), 8.54 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).
C42	-H	H	Me	2,6-di-Cl-4-F3C-fenil-	MeO-	-	3.84 (s, 3H), 4.10 (s, 3H), 7.70 (s, 2H), 8.57 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).
C43	H	H	Me	2,4-di-Cl-fenil-	Me(CO) O-	-	2.28 (s, 3H), 3.87 (s, 3H), 7.21 (d, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.55 (d, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C44	H	H	Me	2-Cl-4-F-fenil-	Et(CO) O-	-	1.13 (t, 3H), 2.48-2.63 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 7.08 (dt, 1H), 7.24-7.30 (m, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C45	H	H	Et	2,3-di-Cl-fenil-	i-Pr-(CO)O-	-	1.05 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 1.40 (t, 3H), 2.80 (m, 1H), 4.60 (q, 2H), 7.20 (d, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.55 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C46	H	H	i-Pr-CH ₂ -	2-F3CO-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	0.95 (t, 6H), 1.18 (s, 9H), 2.31 (septeto, 1H), 4.39 (d, 2H), 7.31-7.39 (m, 3H), 7.42-7.49 (m, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.54 (d, 1H).
C47	H	H	c-Pr-CH ₂ -	2-F3CO-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	0.48-0.60 (m, 4H), 1.21 (s, 9H), 1.50-1.59 (m, 1H), 4.47 (d, 2H), 7.35-7.46 (m, 3H), 7.47-7.53 (m, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.59 (s, 1H).
C48	H	H	i-Pr-CH ₂ -	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	0.99 (dd, 6H), 1.20 (s, 9H), 2.31 (septeto, 1H), 4.39 (d, 2H), 7.04-7.11 (m, 1H), 7.19-7.24 (m, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C49	H	H	c-Pr-CH ₂ -	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	0.48-0.57 (m, 4H), 1.20 (s, 9H), 1.37-1.44 (m, 1H), 4.44 (d, 2H), 7.06-7.11 (m, 1H), 7.19-7.26 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C50	H	H	Me	2-Cl-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.15 (s, 9H), 3.90 (s, 3H), 7.30 (m, 3H), 7.50 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C51	H	H	Me	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	4-O ₂ N-Ph-(CO)O-	-	3.92 (s, 3H), 7.02 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 8.25 (d, 2H), 8.32 (d, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.70 (d, 1H).
C52	H	H	Me	naphth-2-il-	t-Bu(CO)O-	-	0.85 (s, 9H), 3.85 (s, 3H), 7.35-7.45 (m, 4H), 7.55 (d, 1H), 7.80 (t, 2H), 8.45 (d, 1H), 8.55 (d, 1H).
C53	H	H	Me	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-CH ₂ -(CO)O-	-	0.92 (s, 9H), 2.41 (s, 2H), 3.88 (s, 3H), 7.05 (m, 1H), 7.27 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).
C54	H	H	Me	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	c-Pr(CO)O-	-	1.01 (m, 2H), 1.12 (m, 2H), 1.72 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 7.10 (m, 1H), 7.21 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C55	H	H	Me	2,3,6-tri-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.30 (s, 9H), 3.95 (s, 3H), 7.00 (m, 1H), 7.30 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C56	H	H	Me	2,6-di-Cl-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.10 (d, 6H), 3.68 (m, 1H), 3.92 (s, 3H), 7.33 (m, 1H), 7.48 (d, 2H), 8.55 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C57	H	H	Et	2,3,6-tri-F-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.25 (d, 6H), 1.45 (t, 3H), 2.90 (m, 1H), 4.65 (q, 2H), 7.00 (m, 1H), 7.30 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C58	H	H	Me	2,3,6-tri-F-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.25 (d, 6H), 2.90 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 7.00 (m, 1H), 7.30 (m, 1H), 8.55' (d, 1H), 8.65 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C59	H	H	Et	2,3,6- tri-F- fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.30 (s, 9H), 1.45 (t, 3H), 4.65 (q, 2H), 7.00 (m, 1H), 7.30 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C60	H	H	c-Pr-CH ₂ -	2-C1-3,6-di-F- fenil-	i-Pr(CO) O-	-	0.42 (m, 4H) 1.32 (d, 6H), 1.44 (m, 1H), 2.62 (m, 11H), 4.48 (d, 2H), 7.05 (m, 1H), 7.35 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.72 (d, 1H).
C61	H	H	Me	2,4-di-Cl- fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.20 (s, 9H), 3.90 (s, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.55 (s, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C62	H	H	Et	2,4-di-Cl- fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.20 (d, 9H), 1.35 (t, 3H), 4.60 (q, 2H), 7.25 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.55 (s, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C63	H	H	Me	2,4-di-Cl- fenil-	i-Pr(CO) O-	-	1.10 (d, 3H), 1.20 (d, 3H), 2.80 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 7.20 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.55 (s, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C64	H	H	Et	2,4-di-Cl- fenil-	i-Pr(CO) O-	-	1.10 (d, 3H), 1.20 (d, 3H), 1.40 (t, 3H), 2.80 (m, 1H), 4.60 (q, 2H), 7.25 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.55 (s, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C65	H	H	Me	2,6-di-Et-4-Me- fenil-	i-Pr(CO) O-	-	0.99 (d, 6H), 1.10 (t, 6H), 2.34-2.46 (m, 7H), 2.61-2.73 (m, 1H), 3.87 (s, 3H), 6.98 (s, 2H), 8.48 (d, 1H), 8.58 (d, 1H).
C66	H	H	Et	3-C1- fenil-	Me(CO) O-	-	1.39 (t, 3H), 2.319 (s, 3H), 4.59 (q, 2H), 7.34-7.38 (m, 1H), 7.39-7.42 (m, 2H), 7.48 (s, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C67	H	H	Et	4-C1- fenil-	Me(CO) O-	-	1.38 (t, 3H), 2.31 (s, 3H), 4.58 (q, 2H), 7.42-7.47 (m, 4H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C68	H	H	Me	2,3,5-tri-C1-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.15 (d, 3H), 1.20 (d, 3H), 2.80 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 7.20 (d, 1H), 7.55 (s, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C69	H	H	Me	2-MeO-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.10 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 2.75 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 7.00 (m, 2H), 7.20 (d, 1H) 7.40 (t, 1H-i), 8.45 (d, 1H), 8.55 (d, 1H).
C70	H	H	Et	2-MeO-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.10 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 1.40 (t, 3H), 2.75 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 4.60 (q, 2H), 7.01 (m, 2H), 7.24 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.55 (d, 1H).
C71	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	i-Pr(CO)O-	5-N-óxido	1.10 (bs, 6H), 2.72 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 7.02 (m, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.92 (m, 1H), 8.42 (d, 1H).
C72	H	H	Et	3,4-di-Cl-fenil-	Me(CO)O-	-	1.38 (t, 3H), 2.33 (s, 3H), 4.59 (q, 2H), 7.33 (dd, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C73	H	H Me		2-C1-3,6-di-F-fenil-	Me-CC-CH ₂ O(CO)O-	-	1.82 (t, 3H), 3.88 (s, 3H), 4.72 (q, 2H), 7.02 (m, 1H), 7.21 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C74	H	H	c-Pr-CH ₂ -	2-C1-3,6-di-F-fenil-	Me-CE-C-CH ₂ O(CO)O-	-	0.51 (s, 4H), 1.39 (m, 1H), 1.88 (t, 3H), 4.32 (d, 2H), 4.72 (q, 2H), 7.05 (m, 1H), 7.21 (m, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C75	H	H	Me	2,4,6-tri-Me-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	0.99 (d, 6H), 2.08 (s, 6H), 2.28 (s, 3H), 2.68 (septeto, 1H), 3.86 (s, 3H), 6.90 (bs, 2H), 8.47 (1d, 1H), 8.57 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C76	H	H	Me	6-C1-2-F3C-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.02 (d, 3H), 1.07 (d, 3H), 2.71 (septeto, 1H), 3.86 (s, 3H), 7.51 (t, 1H), 7.71 (d, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C77	H	H	Me	2-C1-3-F3C-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.04 (d, 3H), 1.10 (d, 3H), 2.73 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 7.45 (m, 2H), 7.81 (m, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C78	H	H	Et	2-C1-3-F3C-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.03 (d, 3H), 1.10 (d, 3H), 1.37 (t, 3H), 2.72 (m, 1H), 4.57 (q, 2H), 7.42 (m, 2H), 7.78 (dd, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C79	H	H	Me	2,3,6-tri-C1-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.25 (d, 6H), 2.80 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 7.40 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C80	H	H	Et	6-C1-2-F3C-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.02 (d, 3H), 1.07 (d, 3H), 1.34 (t, 3H), 2.71 (septeto, 1H), 4.58 (q, 2H), 7.50 (t, 1H), 7.70 (d, 2H), 8.48 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C81	H	H	Et	2,4,6-tri-Me-fenil-	Me(CO)O-	-	1.37 (t, 3H), 2.09 (s, 6H), 2.18 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 4.59 (q, 2H), 6.93 (s, 2H), 8.48 (d, 1H), 8.58 (d, 1H).
C82	H	Cl	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.05 (m, 6H), 2.78 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 7.05 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 8.42 (s, 1H).
C83	Cl	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.17 (m, 6H), 2.81 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 7.05 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 8.60 (s, 1H).
C84	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	Ph(CO)O-	-	3.90 (s, 3H), 7.04 (m, 1H), 7.15 (m, 1H), 7.46 (t, 2H), 7.62 (t, 1H), 8.07 (m, 2H), 8.47 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C85	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	3-MeO-Ph(CO)O-	-	3.82 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 7.04 (m, 1H), 7.15 (m, 2H), 7.36 (t, 1H), 7.56 (m, 1H), 7.68 (m, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C86	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	furan-2-il-(C0)0-	-	3.88 (s, 3H), 6.56 (m, 1H), 7.05 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 7.34 (m, 1H), 7.65 (m, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C87	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	but-2-il-(C0)0-	-	0.80 (m, 3H), 1.13 (dd, 3H), 1.45 (m, 1H), 1.65 (m, 1H), 2.59 (m, 1H), 3.87 (s, 3H), 7.07 (m, 1H), 7.21 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C88	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	octil-(C0)0-	-	0.88 (t, 3H), 1.23 (m, 12H), 2.52 (t, 2H), 3.86 (s, 3H), 7.07 (m, 1H), 7.21 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C89	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	pent-3-il-(C0)0-	-	0.79 (t, 6H), 1.51 (m, 2H), 1.63 (m, 2H), 2.40 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 7.06 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C90	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	Me2C=CH-(C0)0-	-	1.94 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 5.86 (s, 1H), 7.06 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C91	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	thio-phen-2-il-(C0)0-	-	3.88 (s, 3H), 7.04 (m, 1H), 7.12 (dd, 1H), 7.16 (m, 1H), 7.65 (dd, 1H), 7.90 (dd, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C92	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	hept-3-il-(C0)0-	-	0.82 (m, 6H), 1.18 (m, 4H), 1.54 (m, 4H), 2.45 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 7.07 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C93	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	i-Pr-CH ₂ -(C0)0-	-	0.86 (d, 3H), 0.88 (d, 3H), 2.07 (m, 1H), 2.41 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 7.08 (m, 1H), 7.21 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C94	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	1-Ph-prop-1-il-(C0)0-	-	0.92 (m, 3H), 1.80 (m, 1H), 2.16 (m, 1H), 3.70 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 6.80 (m, 1H), 6.98 (m, 1H), 7.12 (m, 2H), 7.21 (m, 3H), 8.48 (m, 1H), 8.62 (m, 1H).
C95	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	pent-2-il-(C0)0-	-	0.82 (t, 3H), 1.15-1.22 (m, 5H), 1.38 (m, 1H), 1.58-1.65 (m, 1H), 2.67 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 7.08 (m, 1H), 7.22 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C96	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	hept-4-il-(C0)0-	-	0.85-0.89 (m, 6H), 1.24 (m, 4H), 1.47 (m, 3H), 1.65 (m, 2H), 3.92 (s, 3H), 7.12 (m, 1H), 7.27 (m, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.66 (d, 1H).
C97	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	c-Pe-CH ₂ -(C0)0-	-	1.00-1.6 (m, 8H), 2.17 (m, 1H), 2.53 (d, 2H), 3.87 (s, 3H), 7.09 (m, 1H), 7.23 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C98	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	2,4,4-trimetil-pent-1-il-(C0)0-	-	0.81-0.92 (m, 10H), 1.01-1.29 (m, 3H), 2.35 (m, 1H), 2.62 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 7.10 (m, 1H), 7.23 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C99	H	H	Me	2-C1-6-F-3-02N-fenil-	t-Bu-(C0)0-	-	1.18 (s, 9H), 3.88 (s, 3H), 7.25 (m, 1H), 8.00 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C100	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	3,5-dimetil-isoxazol-4-il-(C0)0-	-	2.37 (s, 3H), 2.62 (s, 3H), 3.91 (s, 3H), 7.09 (m, 1H), 7.24 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.66 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C101	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	dec-9-en-1-il-(C0)0-	-	1.22 (m, 8H), 1.36 (m, 2H), 1.58 (m, 2H), 2.03 (m, 2H), 2.52 (t, 2H), 3.86 (s, 3H), 4.95 (m, 2H), 5.80 (m, 1H), 7.08 (m, 1H), 7.22 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C102	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	2,5-dimetil-furan-3-il-(C0)0-	-	2.28 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 3.93 (s, 3H), 6.29 (s, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.22 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.66 (d, 1H).
C103	H	H	Et	2,4,6-tri-Me-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	0.99 (d, 6H), 1.35 (t, 3H), 2.07 (s, 6H), 2.28 (s, 3H), 2.68 (septeto, 1H), 4.58 (q, 2H), 6.90 (bs, 2H), 8.47 (d, 1H), 8.56 (d, 1H).
C104	H	H	Et	3,5-di-F3C-fenil-	Me(CO)O-	-	1.49 (t, 3H), 2.32 (s, 3H), 4.60 (q, 2H), 7.94 (s, 1H), 8.00 (s, 2H), 8.52 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).
C105	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.45 (s, 9H), 3.86 (s, 3H), 7.08 (m, 1H), 7.22 (m, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.63 (d, 1H).
C106	H	H	Me	2-Me0-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.20 (s, 9H), 3.80 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 7.00 (m, 2H), 7.20 (d, 1H) 7.40 (m, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.55 (d, 1H).
C107	H	H	Et	2,3,6-tri-C1-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.15 (d, 6H), 1.40 (t, 3H), 2.80 (m, 1H), 4.60 (q, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C108	H	H	Me	2,3,6-tri-C1-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.20 (s, 9H), 3.90 (s, 3H), 7.40 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C109	H	H	Me	2-F3C-fenil-	t-Bii(CO)O-	-	1.15 (s, 9H), 3.90 (s, 3H), 7.35 (d, 1H), 7.60 (t, 1H), 7.65 (t, 1H), 7.85 (d, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C110	H	H	Me	2-F3C-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	0.95 (d, 3H), 1.10 (d, 3H), 2.80 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 7.30 (d, 1H), 7.60 (t, 1H), 7.65 (t, 1H), 7.80 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C111	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	i-PrS(0)2O-	-	1.45 (d, 6H), 3.71 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 7.05 (m, 1H), 7.22 (m, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.69 (d, 1H).
C112	H	H	Et	2-C1-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-CH2-(CO)O-	-	0.98 (bs, 9H), 1.40 (t, 3H), 1.48 (s, 2H), 4.65 (q, 2H), 7.10 (m, 1H), 7.21 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C113	H	H	any'	2-C1-3,6-di-F-fenil-	allil-(CO)O-	-	4.97 (m, 2H), 5.08-5.25 (m, 6H), 5.86 (m, 1H), 6.00 (m, 1H), 7.07 (m, 1H), 7.19 (m, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C114	H	H	Me	2-C1-6-F-5-Me-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.10 (d, 3H), 1.11 (d, 3H), 2.27 (d, 3H), 2.77 (septeto, 1H), 3.86 (s, 3H), 7.19 (d, 2H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C115	H	H	Et	2-C1-6-F-5-Me-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.10 (d, 3H), 1.11 (d, 3H), 1.37 (t, 3H), 2.27 (d, 3H), 2.77 (septeto, 1H), 4.58 (g, 2H), 7.18 (m, 2H), 8.48 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C116	H	H	Me	2-C1-6-F-5-Me-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.17 (s, 9H), 2.27 (d, 3H), 3.87 (s, 3H), 7.19 (m, 2H), 8.49 (d, 1H), 8.58 (d, 1H).
C117	H	H	Et	2-C1-6-F-5-Me-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.17 (s, 9H), 1.37 (t, 3H), 2.27 (d, 3H), 4.59 (q, 2H), 7.19 (m, 2H), 8.48 (d, 1H), 8.58 (d, 1H).
C118	H	H	Me	2-C1-5-F3C-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.05 (d, 3H), 1.12 (d, 3H), 2.75 (septeto, 1H), 3.87 (s, 3H), 7.54 (s, 1H), 7.63 (s, 2H), 8.51 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C119	H	H	Et	2-C1-5-F3C-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.06 (d, 3H), 1.13 (d, 3H), 1.37 (t, 3H), 2.75 (septeto, 1H), 4.59 (g, 2H), 7.56 (s, 1H), 7.63 (s, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C120	H	H	Me	2,6-cli-C1-4-F3C-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.18 (s, 9H), 3.88 (s, 3H), 7.69 (s, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C121	H	H	Me	2-C1-5-F3C-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.14 (s, 9H), 3.87 (s, 3H), 7.54 (s, 1H), 7.63 (m, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C122	H	H	Et	2-C1-5-F3C-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.15 (s, 9H), 1.37 (t, 3H), 4.59 (q, 2H), 7.56 (s, 1H), 7.62 (s, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C123	H	H	Me	2-C1-3-F3C-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.15 (s, 9H), 3.90 (s, 3H), 7.50 (m, 2H), 7.80 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C124	H	H	c-Pr-CH2-	2-C1-3-F3C-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	0.50 (m, 4H), 1.05 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 1.40 (m, 1H), 2.80 (m, 1H), 4.45 (m, 2H), 7.50 (m, 2H), 7.80 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C125	H	H	any]	2-C1-3-F3C-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.05 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 2.80 (m, 1H), 5.15 (d, 2H), 5.25-5.30 (m, 2H), 6.00 (m, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.80 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C126	H	H	Me	2-C1-6-F-3-Me-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.10 (d, 6H), 2.40 (s, 3H), 2.80 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 7.00 (t, 1H), 7.30 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C127	H	H	Et	2-C1-6-F-3-Me-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.15 (d, 6H), 1.45 (t, 3H), 2.45 (s, 3H), 2.80 (m, 1H), 4.60 (q, 2H), 7.05 (t, 1H), 7.30 (t, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C128	H	H	Me	2-C1-6-F-3-Me-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.15 (s, 9H), 2.40 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 7.00 (t, 1H), 7.30 (t, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60(d, 1H).
C129	H	H	Et	2,6-di-C1-4-F3C-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.16 (s, 9H), 1.38 (t, 3H), 4.62 (q, 2H), 7.68 (s, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C130	H	H	c-Pr-CH2-	2,6-di-C1-4-F3C-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	0.48 (m, 4H), 1.17 (s, 9H), 1.41 (m, 1H), 4.47 (d, 2H), 7.68 (s, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C131	H	H	c-Bu-CH2-	2-C1-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.22 (s, 9H), 1.82-2.12 (m, 6H), 2.94 (m, 1H), 4.17 (m, 2H), 7.05 (m, 1H), 7.23 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C132	H	H	Et	2-C1-3-F3C-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.15 (s, 9H), 1.40 (t, 3H), 4.60 (q, 2H), 7.50 (m, 2H), 7.80 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C133	H	H	Me	2,5-di-Me-fenil-	i-Pr(CO) O-	-	1.00 (d, 6H), 2.15 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.70 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 6.95 (s, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C134	H	H	Me	2,5-di-Me-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.10 (s, 9H), 2.15 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 6.95 (s, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.15 (t, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C135	H	H	Et	2,5-di-Me-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.10 (s, 9H), 1.40 (t, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 4.60 (q, 2H), 6.95 (s, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60(d, 1H).•
C136	H	H	Me	2-1- fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.15 (s, 9H), 3.90 (s, 3H), 7.10 (t, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.40 (t, 1H), 7.95 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C137	H	H	Me	fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.21 (s, 9H), 3.88 (s, 3H), 7.40 (s, 5H), 8.46 (d, 1H), 8.52 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C138	H	H	Me	2,6-di- C1-4- F3C0-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.18 (s, 9H), 3.87 (s, 3H), 7.31 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C139	H	H	Et	2,6-di- C1-4- F3C0-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.19 (s, 9H), 1.34 (t, 3H), 4.56 (q, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C140	H	H	Me	2-02N- 4-F3C-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.21 (s, 9H), 3.84 (s, 3H), 7.60 (d, 1H), 7.92 (dd, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C141	H	H	Et	2-02N- 4-F3C-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.21 (s, 9H), 1.31 (t, 3H), 4.55 (q, 2H), 7.60 (d, 1H), 7.92 (dd, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.50 d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C142	H	H	Me	2-C1-5- F-fenil-	i-Pr(CO) O-	-	1.09 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 2.78 (septeto, 1H), 3.86 (s, 3H), 7.01 (dd, 1H), 7.09 (dt, 1H), 7.47 (dd, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C143	H	H	Me	2-C1-5- F-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.17 (s, 9H), 3.86 (s, 3H), 7.02 (dd, 1H), 7.08 (dt, 1H), 7.46 (dd, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C144	H	H	Me	3-Br-2-C1-6-F-fenil-	i-Pr(CO) O-	-	1.12 (d, 3H), 1.13 (d, 3H), 2.79 (septeto, 1H), 3.87 (s, 3H), 7.02 (t, 1H), 7.69 (dd, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C145	H	H	Me	3-Br-2-C1-6-F-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.18 (s, 9H), 3.87 (s, 3H), 7.01 (t, 1H), 7.68 (dd, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C146	H	H	Me	2-13r-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.18 (s, 9H), 3.92 (s, 3H), 7.31 (m, 2H), 7.42 (m, 1H), 7.73 (dd, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C147	H	H	Et	2-Br-4-F3C-fenil-	t-Bu(CO) O-	-	1.20 (s, 9H), 1.41-1.44 (t, 3H), 4.62-4.67 (q, 2H), 7.45-7.47 (d, 1H), 7.68-7.70 (d, 1H), 8.01 (s, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.66 (d, 1H).
C148	H	H	Me	2,4-di-C1-5-F-fenil-	i-Pr(CO) O-		1.14 (d, 3H), 1.19 (d, 3H), 2.80 (septeto, 1H), 3.86 (s, 3H), 7.10 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C149	H	H	•Me	2,4-di-C1-5-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.21 (s, 9H), 3.86 (s, 3H), 7.10 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C150	H	H	Et	2-C1-5-F-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.09 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 1.36 (t, 3H), 2.77 (septeto, 1H), 4.57 (q, 2H), 7.02 (dd, 1H), 7.08 (m, 1H), 7.45 (dd, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C151	H	H	Et	2-C1-5-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.18 (s, 9H), 1.37 (t, 3H), 4.58 (q, 2H), 7.00-7.11 (m, 2H), 7.46 (dd, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C152	H	H	Et	2,4-di-C1-5-F-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.14 (d, 3H), 1.19 (d, 3H), 1.36 (t, 3H), 2.79 (septeto, 1H), 4.57 (q, 2H), 7.11 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C153	H	H	Et	2,4-di-C1-5-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.21 (s, 9H), 1.36 (t, 3H), 4.57 (q, 2H), 7.12 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C154	H	H	Et	3-Br-2-C1-6-F-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.12 (d, 3H), 1.13 (d, 3H), 1.37 (t, 3H), 2.78 (septeto, 1H), 4.58 (q, 2H), 7.02 (t, 1H), 7.68 (dd, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C155	H	H	Et	3-Br-2-C1-6-F-fenil-	t-13u(CO)O-	-	1.18 (s, 9H), 1.36 (t, 3H), 4.58 (q, 2H), 7.01 (t, 1H), 7.67 (dd, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C156	H	H	Et	5-(4'-C1-Ph)-2-Me-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	0.96 (m, 6H), 1.39 (t, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.67-2.77 (septeto, 1H), 4.61 (q, 2H), 7.34-7.40 (m, 4H), 7.48-7.52 (m, 3H), 8.50 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C157	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-5-02N-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.20 (s, 9H), 3.88 (s, 3H), 8.01 (dd, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C158	H	H	Et	2-C1-3,6-di-F-5-02N-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.20 (s, 9H), 1.36 (t, 3H), 4.58 (q, 2H), 8.02 (dd, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C159	H	H	Me	2-MeO-5-F3CO-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.08 (d, 3H), 1.13 (d, 3H), 2.74 (septeto, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 7.05 (d, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.65 (dd, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.56 (d, 1H).
C160	H	H	Et	2-MeO-5-F3CO-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.08 (d, 3H), 1.14 (d, 3H), 1.37 (t, 3H), 2.75 (septeto, 1H), 3.83 (s, 3H), 4.57 (m, 2H), 7.05 (d, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.65 (dd, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.56 (d, 1H).
C161	H	H	Me	6-Me-2-02N-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.07 (s, 9H), 2.28 (s, 3H), 3.91 (s, 3H), 7.57-7.59 (d, 1H), 7.46-7.50 (m, 1H), 7.96-7.98 (d, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
C162	H	H	Me	2-C1-4,5-di-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.21 (s, 9H), 3.83 (s, 3H), 7.12 (dd, 1H), 7.37 (dd, 1H), 8.51 (d, 1H) 8.62 (d, 1H).
C163	H	H	Me	2,3-di-C1-6-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.19 (s, 9H), 3.88 (s, 3H), 7.03 (t, 1H), 7.52 (dd, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C164	H	H	Me	2-F2HCO-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.10 (d, 3H), 1.15 (d, 3H), 2.76 (septeto, 1H), 3.85 (s, 3H), 6.47 (dd, 1H), 7.29 (m, 3H), 7.44 (m, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.58 (d, 1H).
C165	H	H	Et	2-F2HCO-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.11 (d, 3H), 1.16 (d, 3H), 1.35 (t, 3H), 2.77 (septeto, 1H), 4.56 (q, 2H), 6.48 (dd, 1H), 7.29 (m, 3H), 7.44 (m, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.57 (d, 1H).
C166	H	H	Me	2-MeO-5-F3CO-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.16 (s, 9H), 3.83 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 7.05 (d, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.66 (dd, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.56 (d, 1H).
C167	H	H	Et	2-MeO-5-F3CO-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.16 (s, 9H), 1.36 (t, 3H), 3.82 (s, 3H), 4.57 (m, 2H), 7.04 (d, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.64 (dd, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.55 (d, 1H).

Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C168	H	H	Me	2-F2HCO-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.17 (s, 9H), 3.84 (s, 3H), 6.47 (dd, 1H), 7.27 (m, 3H), 7.43 (m, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.56 (d, 1H).
C169	H	H	Et	2-F2HCO-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.18 (s, 9H), 1.35 (t, 3H), 4.57 (q, 2H), 6.48 (dd, 1H), 7.27 (m, 3H), 7.43 (m, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.56 (d, 1H).
C170	H	Me	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.20 (s, 9H), 2.70 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 7.10 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 8.40 (s, 1H).
C171	H	H	HO-CH ₂ -CH ₃ -	2-C1-3,6-di-F-fenil-	i-Pr-(CO)O-	-	1.14-1.16 (m, 6H), 2.77-2.84 (m, 1H), 2.71 (m, 1H), 4.03-4.05 (m, 2H), 4.79-4.82 (m, 2H), 7.07-7.12 (m, 1H), 7.21-7.27 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C172	H	H	Me	2-C1-6-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	-	1.17 (s, 9H), 3.88 (s, 3H), 7.10 (dt, 1H), 7.30-7.41 (m, 2H), 8.49 (d, 1H), 8.62 (d, 1H).
C173	Me	Me	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.25 (s, 9H), 2.60 (s, 3H), 2.70 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 7.10 (m, 1H), 7.20 (m, 1H).
C174	H	H	NEC-CH ₂ -	2-C1-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.21 (s, 9H), 5.42 (s, 2H), 7.08-7.14 (m, 1H), 7.23-7.29 (m, 1H), 8.63 (d, 1H), 8.68 (d, 1H).
C175	Me	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	- -	1.20 (s, 9H), 2.60 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 7.10 (m, 1H), 7.20 (m, 1H), 8.50 (s, 1H).
C176	H	H	HCE-: C-CH ₂ -	2-C1-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-(CO)O-	-	1.21 (s, 9H), 2.21 (t, 1H), 5.30 (d, 2H), 7.06-7.11 (m, 1H), 7.19-7.26 (m, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.68 (d, 1H).
C177	H	H	MeO-CH ₂ -	2-C1-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.20 (s, 9H), 3.53 (s, 3H), 5.98 (s, 2H), 7.06-7.12 (m, 1H), 7.20-7.26 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).

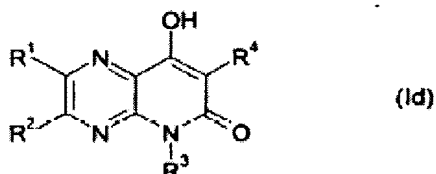
Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em ppm)
C178	H	H	Me	2,6-di-Cl-fenil-	Me-C=C-CH ₂ O(CO)O-	-	1.88 (t, 3H), 3.90 (s, 3H), 4.72 (q, 2H), 7.32 (t, 1H), 7.41 (dd, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.65 (d, 1H).
C179	H	H	(5-F ₃ C-furan-2-yl)-CH ₂ -	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.22 (s, 9H), 5.82 (s, 2H), 6.45 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 7.12 (m, 1H), 7.28 (m, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C180	H	H	c-Bu	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.20 (s, 9H), 1.81-1.91 (m, 1H), 2.01-2.07 (m, 1H), 2.39-2.45 (m, 1H), 3.10-3.20 (m, 2H), 5.97 (quin, 1H), 7.04-7.10 (m, 1H), 7.18-7.24 (m, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.58 (d, 1H).
C181	H	H	HC≡C-CH ₂ -	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	i-Pr(CO)O-	-	1.17 (d, 6H), 2.21 (t, 1H), 2.80 (septeto, 1H), 5.29 (d, 2H), 7.06-7.12 (m, 1H), 7.20-7.26 (m, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.67 (d, 1H).
C182	H	H	Me	2-Cl-3-Br ₂ HC-6-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.15 (s, 9H), 3.87 (s, 3H), 7.11 (s, 1H), 7.22 (t, 1H), 8.11 (dd, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.61 (d, 1H).
C183	H	H	EtO-CH ₂ -	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu(CO)O-	-	1.21 (s, 9H), 1.23 (t, 3H), 3.79 (q, 2H), 6.02 (s, 2H), 7.07-7.12 (m, 1H), 7.19-7.25 (m, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.66 (d, 1H).
C184	H	H	Me	2-Cl-3,6-di-F-fenil-	t-Bu-Me ₂ Si-O-	-	0.42 (s, 6H), 0.64 (s, 9H), 3.82 (s, 3H), 7.02 (m, 1H), 7.14 (m, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).
C185	H	H •	Et	2-Cl-fenil-	Me(CO)O- /	-	1.38 (t, 3H), 2.23 (s, 3H), 4.59 (q, 2H), 7.29 (dd, 1H), 7.32-7.40 (m, 2H), 7.52 (dd, 1H), 8.49 (d, 1H), 8.60 (d, 1H).

Código:

s = singleto; d = duplete; t = tripleto; q = quarteto; bs = singleto largo; dd = duplete duplo; dt = tripleto duplo; quin = quinteto; sext = sexteto; sept = septeto; m = multiplete.

Tabela D:

Composto de Fórmula (Id), isto é, compostos de Fórmula (I), em que R^3 é conforme definido para os compostos de fórmula (I) diferentes de hidrogênio e R^5 é hidróxi.



Comp No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	N-óxido	RMN ¹ H (CDCl ₃ , exceto onde indicado; deslocamentos químicos em
D1	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	-	3.84 (s, 3H), 7.09-7.14 (m, 1H), 7.20-7.26 (m, 1H), 8.16 (bs, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.72 (d, 1H).
D2	H	H	Et	2-C1-3,6-di-F-fenil-	-	1.38 (t, 3H), 4.57 (q, 2H), 7.09-7.14 (m, 1H), 7.20-7.26 (m, 1H), 8.16 (bs, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.72 (d, 1H).
D3	H	H	Me	2,4-di-Cl-fenil-	-	3.78 (s, 3H), 7.27 (s, 2H), 7.44 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.62 (s, 1H).
D4	H	H	Me	2-C1-6-F-3-	-	3.82 (s, 3H), 7.42 (m, 1H), 8.07 (m, 1H), 8.60
D5	H	H	Et	2-F3C0-fenil-	-	1.38 (t, 3H), 4.55 (q, 2H), 7.35-7.42 (m, 3H), 7.47-7.52 (m, 1H), 8.65 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
D6	H	H	Me	2-C1-3,6-di-F-fenil-	5-N-óxido	3.80 (s, 3H), 7.03 (m, 1H), 7.19 (m, 1H), 8.00 (d, 1H), 8.49 (d, 1H), 14.0 (s, 1H).
D7	H	H	Me	2,4,6-tri-Me-fenil-	-	2.11 (s, 6H), 2.31 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 6.97 (bs, 2H), 7.76 (bs, 1H), 8.41 (d, 1H), 8.64 (d, 1H).
D8	H	H	Me	6-F-2-F3C-fenil-	-	3.81 (s, 3H), 7.49 (t, 1H), 7.72 (d, 2H), 8.02 (bs, 1H), 8.43 (d, 1H), 8.69 (d, 1H).

D9	H	H	Me	2-C1-5-F3C-fenil-	-	3.62 (s, 3H), 7.58-7.66 (m, 3H), 8.44 (d, 1H), 8.70 (d, 1H).
D10	H	H	Et	2-C1-5-F3C-fenil-	-	1.35 (t, 3H), 4.54 (q, 2H), 7.57-7.69 (m, 3H), 8.11 (bs, 1H), 8.44 (d, 1H), 8.69 (d, 1H).
D11	H	H	Et	2,6-di-C1-4-F ₃ CO-fenil-	-	(CD ₃ OH): 1.33 (t, 3H), 4.56 (q, 2H), 7.48 (t, 1H), 7.68 (d, 1H), 8.63 (d, 1H), 8.78 (d, 1H).
D12	H	H	Me	6-Me-2-02N-fenil-	-	2.30 (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 7.46 (m, 1H), 7.57-7.59 (d, 1H), 7.96-7.98 (d, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.59 (d, 1H).
D13	H	H	Me	3-Br-2-C1-6-F-fenil-	-	3.82 (s, 3H), 7.02 (t, 1H), 7.68 (dd, 1H), 8.44 (d, 1H), 8.70 (d, 1H).
D14	H	H	Me	2-C1-6-F-3-(6'-ciclo-propilo-Metoxi-pirid-3'-il)-fenil	-	0.40 (m, 2H), 0.68 (m, 2H), 1.33 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 4.20 (d, 2H), 6.98 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.39 (dd, 1H), 7.98 (dd, 1H), 8.32 (bs, 1H), 8.35 (bs, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.72 (d, 1H).
D15	H	H	NEC-CH,-	2-C1-3,6-di-F-fenil-	-	(dd-DMSO): 5.38 (s, 2H), 7.39-7.47 (m, 1H), 7.57-7.63 (m, 1H), 8.78 (d, 1H), 8.91 (d, 1H).

Código:

s = singleto; d = duplete; t = tripleto; q = quarteto; bs = singleto largo; dd = duplete duplo; m = multiplete.

5 Exemplos biológicosExemplo B1: Ação herbicida

Sementes de uma variedade de espécies de teste foram semeadas em solo padrão esterilizado em bandejas de sementes, cada uma com 96 células. Depois do cultivo por 8 a 9 dias de cultivo (pós aparecimento) sob condições controladas numa câmara climática (cultivo a 23/17 °C, dia/noite; 13 horas de luz; 50 a 60% de umidade), as plantas foram

5 tratadas com uma solução de pulverização aquosa de 1000 mg/L do ingrediente ativo dissolvido em DMSO 10% (dimetilsulfóxido, CAS RN 67-68-5) como um solvente, equivalente a 1000 g/ha. As plantas cresceram na câmara climática após a aplicação a (24/19 °C, dia/noite; 13 horas de luz; 50 a 60% de umidade) e regadas duas vezes ao dia. Depois de 9 dias até o teste foram avaliadas (100 = dano total para a planta, 0 = nenhum dano à planta).

Tabela B1: Aplicação pós aparecimento

Número do Composto	Stellaria media (STEME)	Nasturtium Officinale (NAAOF)	Amaranthus retr0flexus (AMARE)	Solanum nigrum (SOLNI)
A1	7	5	0	0
A2	2	2	6	0
A3	3	4	8	0
A4	1	2	5	2
A5	3	6	3	3
A6	0	0	0	5
A8	2	7	5	0
A9	8	3	7	4
A10	2	2	9	0
A11	2	3	0	0
A13	3	0	5	0
A14	7	7	6	0
A15	0	2	0	0
A17	5	7	8	5
A18	4	9	6	6
A19	5	5	6	7
A20	0	2	-	-
A21	3	6	7	5
A26	2	0	0	0
A27	2	0	0	0
A28	2	3	2	0
A29	3	0	2	2
A30	4	3	7	0
A31	3	3	5	0
A32	0	0	0	2
A33	3	2	4	3
A34	4	4	6	2
A35	0	3	4	4
B1	3	0	8	0
B2	0	0	5	0
B3	2	0	8	0
B4	2	3	8	0
B5	2	3	8	0
B8	3	3	1	2
B10	0	6	8	0
B11	1	3	8	0
B15	2	7	0	0
B17	0	0	0	2
B33	3	5	5	0
B37	5	0	0	0
B38	0	4	4	0
B40	1	0	6	0
B41	1	2	2	2
C3	6	7	0	5
C5	8	7	7	2

C6	9	8	8	5
C9	2	2	0	3
C11	8	8	9	5
C12	8	6	6	0
C13	8	8	8	2
C14	8	8	7	4
C15	5	6	0	1
C16	7	7	0	7
C18	7	5	3	0
C19	6	4	0	3
C20	5	7	0	0
C21	8	8	8	0
C22	5	8	1	2
C23	0	0	0	4
C24	3	4	0	3
C25	2	0	0	0
C26	2	0	0	0
C27	5	7	7	6
C28	7	7	2	2
C29	0	2	0	4
C30	8	8	8	4
C31	8	8	8	4
C32	8	8	8	2
C33	6	7	3	6
C34	6	5	2	0
C35	7	7	2	0
C36	5	7	5	6
C37	5	7	5	6
C38	7	7	5	7
C39	6	6	7	7
C40	2	2	3	2
C41	2	2	2	0
C43	5	5	3	3
C44	6	4	8	2
C45	9	8	8	6
C46	1	1	0	4
C47	0	1	4	3
C48	1	0	0	1
C49	3	0	3	0
C50	7	7	4	4
C51	7	7	7	0
C52	3	3	0	0
C53	5	7	7	3
C54	5	5	7	0
C55	4	0	4	0
C56	7	7	8	0
C57	7	6	5	2
C58	8	7	6	0
C59	7	7	6	0
C60	5	8	7	7
C61	8	8	8	2
C62	8	8	7	1
C63	8	9	5	5
C64	10	10	6	8
C65	6	7	4	3
C66	7	7	0	0
C67	6	8	4	0
C68	5	5	0	0

C69	6	5	0	0
C70	3	4	0	0
C71	8	7	0	2
C72	2	8	0	0
C73	4	6	4	0
C75	7	6	3	7
C76	6	6	7	4
C78	6	8	6	4
C79	7	5	6	6
C80	8	6	7	2
C81	8	8	5	4
C82	0	0	4	0
C83	0	0	0	1
C84	7	5	6	8
C85	4	3	5	4
C86	6	6	7	7
C87	2	4	6	6
C89	5	5	5	4
C90	7	6	3	8
C91	8	4	7	8
C92	6	2	5	7
C94	6	7	5	4
C95	7	7	6	5
C96	6	3	5	3
C98	1	2	5	2
C100	3	6	6	5
C101	2	3	7	4
C102	7	7	4	7
C103	7	6	4	7
C104	0	4	2	0
C105	8	6	5	5
C108	5	5	6	3
C109	0	4	3	6
C110	7	6	7	6
C111	1	3	5	0
012	7	5	6	7
C113	8	6	7	6
C114	6	5	2	2
C115	8	7	4	4
C116	4	2	0	4
C117	1	0	0	5
C118	8	7	6	6
C119	8	7	7	6
C120	7	6	5	7
C121	7	6	5	7
C122	7	4	6	6
C123	6	4	4	6
C124	8	8	9	7
C125	7	7	2	8
C126	7	6	6	7
C127	7	6	2	7
C128	6	6	3	7
C178	7	6	4	2
C184	6	6	5	4
C185	10	8	4	4
D1	2	3	0	0
D2	8	8	6	8
D3	8	8	0	8
D5	6	7	3	-
D6	6	7	5	3

Compostos Nos. A7, A12, A16, B6-B7, B9, B12-B14, B16, B18-B32, B34-B36, B39, C42 e C106 foram testados usando o mesmo protocolo e não apresentaram danos às plantas de teste sob as condições de teste.

5 Exemplo B2: Ação herbicida

Sementes de uma variedade de espécies de teste foram semeadas em solo padrão em potes. Depois de 8 dias de cultivo (pós aparecimento) sob condições controladas numa estufa (a 24/16 °C, dia/noite; 14 horas de luz; 65% de umidade), as plantas foram pulverizadas com uma solução de pulverização aquosa derivada da formulação do ingrediente ativo técnico em solução de acetona/água (50:50) contendo Tween 20 0,5% (monolaurato de polioxietileno sorbitan, CAS RN 9005-64-5). As plantas de teste, a seguir, cresceram numa estufa sob condições controladas numa estufa (a 24/16 °C, dia/noite; 14 horas de luz; 65% de umidade) e foram regadas duas vezes por dia. Depois de 13 dias, o teste foi avaliado (100 = dano total para a planta, 0 = nenhum dano à planta).

Tabela B2: Aplicação pós emergência

Número do Composto	Solanum nigrum	Amaranthus retroflexus (AMARE)	Setaria faberi (SETFA)	Echinochloa Crusgalli (ECHCG)	Ipomea hederaceae (IPOHE)
A24	9	10	6	4	6
A36	8	7	8	10	0
A37	6	4	7	7	1
A38	9	10	9	8	0
A39	6	8	7	8	0
A40	8	9	9	5	0
B42	5	0	8	1	0
B44	3	7	0	3	-
B45	9	4	8	8	0
B46	10	10	6	4	9
B47	3	2	4	3	1
B49	9	10	7	3	8
B50	9	10	8	8	8
B51	7	3	6	3	0
B59	2	0	4	0	3
C129	10	10	6	4	9
C131	2	0	0	0	0
C133	9	9	4	6	3

C134	10	9	2	0	6
C135	10	8	0	2	0
C136	10	9	8	9	
C137	0	9	0	0	5
C138	8	8	4	2	8
C139	10	10	10	10	10
C140	9	8	0	3	2
C142	10	10	7	8	9
C143	10	10	8	7	9
C144	10	10	2	4	9
C145	9	7	0	1	6
C146	8	9	6	5	7
C147	4	2	0	0	2
C148	6	9	4	6	7
C149	7	9	3	3	5
C150	10	10	6	3	9
C151	6	7	0	0	4
C152	9	10	2	4	6
C153	8	9	1	1	5
C154	10	10	0	3	9
C155	10	10	0	3	9
C159	8	9	7	9	2
C160	9	10	6	8	7
C162	10	9	7	8	7
C163	9	6	0	1	9
C164	8	9	4	3	8
C165	10	9	2	1	7
C167	9	10	2	5	5
C168	8	10	2	3	5
C169	9	9	0	0	7
C170	6	8	7	8	4
D7	10	10	10	10	9
D11	10	10	9	10	10

Compostos Nos. A22, B48 e C137 foram testados usando o mesmo protocolo e não apresentaram danos às plantas de teste sob as condições de teste.

Exemplo B3: Ação herbicida

5 Sementes de uma variedade de espécies de teste foram
semeadas em adubo esterilizado em pequenos potes. Depois do cultivo por
sete dias (pós aparecimento) em condições controladas na estufa (a 24/16 °C,
dia/noite; 14 horas de luz; 65% de umidade), as plantas foram pulverizadas
com 1 mg do ingrediente ativo, formuladas em 2,5 mL de solução de
10 acetona/água (50:50), o que é equivalente a 1000 g/ha. Uma vez secas as

folhas, os potes foram mantidos na estufa (a 24/16 °C, dia/noite; 14 horas de luz; 65% de umidade), e foram regadas duas vezes por dia. Depois de 13 dias, o teste foi avaliado (100 = dano total à planta, 0 = sem danos à planta).

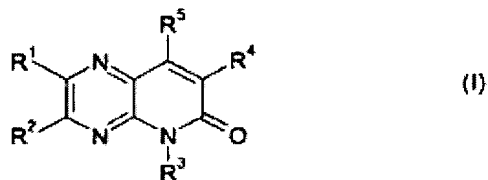
Tabela B3: Aplicação pós emergência

Número do Composto	<i>Amaranthus retroflexus</i> (AMARE)	<i>Alopecurus myosuroides</i> (AL0MY)	<i>Digitaria sanguinalis</i> (DIGSA)	<i>Chenopodium album</i> (CHEAL)
A41	0	3	6	6
A43	7	0	0	8
B54	3	0	0	8
C7	9	0	3	7
C107	10	0	2	10
C132	10	0	0	8
C141	10	0	0	7
C156	0	8	3	0
C157	6	0	0	8
C158	9	0	0	10
C161	6	0	5	2

5 Os compostos Nos. A42, A44-A45, B43, B52-B53, B55-B57 e D12 foram testados usando o mesmo protocolo e não apresentaram danos às plantas de teste sob as condições de teste.

REIVINDICAÇÕES

1. Método para controlar plantas, caracterizado pelo fato de compreender a aplicação às plantas ou aos seus locais de uma quantidade herbicidamente eficaz de um composto de fórmula (I)



5 em que

R^1 e R^2 são independentemente hidrogênio, alquil C_1-C_4 , haloalquil C_1-C_4 , halo, ciano, hidróxi, alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , aril ou aril substituído por de um a cinco R^6 , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heteroaril ou heteroaril substituído por de uma cinco R^6 , o qual pode ser o mesmo ou diferente;

R^3 é hidrogênio, alquil C_1-C_{10} , alquenil C_2-C_{10} , alquinil C_2-C_{10} , cicloalquil C_3-C_{10} , cicloalquil C_3-C_{10} -alquil C_1-C_6 -, alcóxi C_1-C_{10} -alquil C_1-C_6 -, cianoalquil C_1-C_{10} , alcoxicarbonil C_1-C_{10} -alquil C_1-C_6 -, N-alquil C_1-C_3 -aminocarbonilalquil C_1-C_6 -, N,N-di-(alquil C_1-C_3)-aminocarbonilalquil C_1-C_6 , arilalquil C_1-C_6 - ou arilalquil C_1-C_6 -, em que a porção aril é substituída por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heterociclilalquil C_1-C_6 ou heterociclilalquil C_1-C_6 , em que a porção heterociclil é substituída por de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente;

R^4 é aril ou aril substituído por de um a cinco R^8 , os quais podem ser os mesmos ou diferentes, ou heteroaril ou heteroaril substituído por de um a quatro R^8 , os quais podem ser os mesmos ou diferentes;

R^5 é hidróxi, R^9 -óxi-, R^{10} -carbonilóxi-, tri- R^{11} -sililóxi- ou R^{12} -sulfonilóxi-, cada R^6 , R^7 e R^8 sendo independentemente halo, ciano, nitro, alquil C_1-C_{10} , haloalquil C_1-C_4 , alquenil C_2-C_{10} , alquinil C_2-C_{10} , hidróxi, alcóxi C_1-C_{10} , haloalcóxi C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_{10} - alquil C_1-C_4 , cicloalquil C_3-C_7 , cicloalcóxi C_3-C_7 , cicloalquil C_3-C_7 -alquil C_1-C_4 -, cicloalquil C_3-C_7 -alcóxi C_1 -

C₄-, alquilcarbonil C₁-C₆-, formil, alcóxicarbonil C₁-C₄-, alquilcarbonilóxi C₁-C₄-, alquiltio C₁-C₁₀-, haloalquiltio C₁-C₄-, alquilsulfinil C₁-C₁₀-, haloalquilsulfinil C₁-C₄-, alquilsulfonil C₁-C₁₀-, haloalquilsulfonil C₁-C₄-, amino, alquilamino C₁-C₁₀-, dialquilamino C₁-C₁₀-, alquilcarbonilamino C₁-C₁₀-, aril ou aril substituído por de um a três R¹³, os quais podem ser os mesmos ou diferentes, heteroaril ou heteroaril substituído por de um a três R¹³, os quais pode ser os mesmos ou diferentes, arilalquil C₁-C₄ ou arilalquil C₁C₄, em que a porção aril é substituída por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente, heteroarilalquil C₁-C₄ ou heteroarilalquil C₁-C₄, em que a porção heteroaril é substituída por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente, arilóxi- ou arilóxi- substituído por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente, heteroarilóxi- ou heteroarilóxi- substituído por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente, ariltio- ou ariltio- substituído por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente ou heteroariltio- ou heteroariltio- substituído por de um a três R¹³, o qual pode ser o mesmo ou diferente;

R⁹ é alquil C₁-C₁₀, alquenil C₂-C₁₀, alquinil C₂-C₁₀ ou arilalquil C₁-C₄- ou arilalquil C₁-C₄-, em que a porção aril é substituída por de um a cinco substituintes independentemente selecionados de halo, ciano, nitro, alquil C₁-C₆, haloalquil C₁-C₆ ou alcóxi C₁-C₆;

R¹⁰ é alquil C₁-C₁₀, cicloalquil C₃-C₁₀, cicloalquil C₃-C₁₀-alquil C₁-C₁₀-, haloalquil C₁-C₁₀, alquenil C₂-C₁₀, alquinil C₂-C₁₀, alcóxi C₁-C₄-alquil C₁-C₁₀-, alquiltio C₁-C₄-alquil C₁-C₄-, alcóxi C₁-C₁₀, alquenilóxi C₂-C₁₀, alquinilóxi C₂-C₁₀, alquiltio C₁-C₁₀-, N-alquilamino C₁-C₄-, N,N-di-(alquil C₁-C₄)-amino-, aril ou aril substituído por de um a três R¹⁴, o qual pode ser o mesmo ou diferente, heteroaril ou heteroaril substituído por de um a três R¹⁴, o qual pode ser o mesmo ou diferente, arilalquil C₁-C₄ ou arilalquil C₁-C₄, em que a porção aril é substituída por de uma três R¹⁴, o qual pode ser o mesmo ou diferente, heteroarilalquil C₁-C₄- ou heteroarilalquil C₁-C₄-, em que a

porção heteroaril é substituída por de um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente, arilóxi- ou arilóxi- substituído por de um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente, heteroarilóxi- ou heteroarilóxi- substituído por de um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ariltio- ou ariltio- substituído por de um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heteroariltio- ou heteroariltio- substituído por de um a três R^{14} , o qual pode ser o mesmo ou diferente;

5 cada R^{11} é independentemente alquil C_1-C_{10} ou fenil ou fenil substituído por de um a cinco substituintes independentemente selecionados de halo, ciano, nitro, alquil C_1-C_6 , haloalquil C_1-C_6 ou alcóxi C_1-C_6 ;

R^{12} é alquil C_1-C_{10} ou fenil ou fenil substituído por de um a cinco substituintes independentemente selecionados de halo, ciano, nitro, alquil C_1-C_6 , haloalquil C_1-C_6 ou alcóxi C_1-C_6 ;

15 cada R^{13} é independentemente halo, ciano, nitro, alquil C_1-C_6 , haloalquil C_1-C_6 ou alcóxi C_1-C_6 ; e

20 cada R^{14} é independentemente halo, ciano, nitro, alquil C_1-C_{10} , haloalquil C_1-C_4 , alcóxi C_1-C_{10} , alcóxicarbonil C_1-C_4 , haloalcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_{10} , haloalquiltio C_1-C_4 , alquilsulfinil C_1-C_{10} , haloalquilsulfinil C_1-C_4 , alquilsulfonil C_1-C_{10} , haloalquilsulfonil C_1-C_4 , aril ou aril substituído por de um a cinco substituintes selecionados independentemente de halo, ciano, nitro, alquil C_1-C_6 , haloalquil C_1-C_6 ou alcóxi C_1-C_6 , ou heteroaril ou heteroaril substituído por de um a quatro substituintes independentemente selecionados de halo, ciano, nitro, alquil C_1-C_6 , haloalquil C_1-C_6 ou alcóxi C_1-C_6 ; ou sais ou N-óxidos dos mesmos.

25 2. Método de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que R^1 é hidrogênio, alquil C_1-C_4 , haloalquil C_1-C_4 , halogênio, ciano, hidróxi ou alcóxi C_1-C_4 .

3. Método de acordo com a reivindicação 1 ou com a reivindicação 2, caracterizado pelo fato de que R^2 é hidrogênio, alquil C_1-C_4 ,

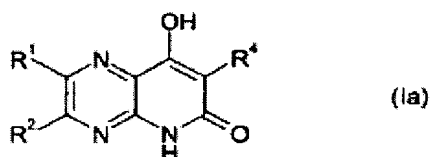
haloalquil C₁-C₄, halogênio, ciano, hidróxi ou alcóxi C₁-C₄.

4. Método de acordo com qualquer uma das Reivindicações de 1 a 3, caracterizado pelo fato de que R³ é hidrogênio, alquil C₁-C₁₀, alquenil C₂-C₁₀, alquinil C₂-C₁₀, cicloalquil C₃-C₁₀, cicloalquil C₃-C₁₀-alquil C₁-C₆-, alcóxi C₁-C₁₀-alquil C₁-C₆-, cianoalquil C₁-C₁₀, alcoxicarbonil C₁-C₁₀-alquil C₁-C₆-, N-alquilaminocarbonil C₁-C₃-alquil C₁-C₆-, N,N-di-(alquil C₁-C₃)-aminocarbonilalquil C₁-C₆-, benzil ou benzil em que a porção fenil é substituída por de um a três R⁷, o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou fenetil- ou fenetil-, em que a porção fenil é substituída por de um a três R⁷, o qual pode ser o mesmo ou diferente.

5. Método de acordo com qualquer uma das Reivindicações de 1 a 3, caracterizado pelo fato de que R⁴ é aril ou aril substituído por de um a cinco substituintes R⁸, os quais podem ser iguais ou diferentes.

6. Método de acordo com qualquer uma das Reivindicações de 1 a 5, caracterizado pelo fato de que R⁵ é hidróxi, R⁹-óxi- ou R¹⁰-carbonilóxi-.

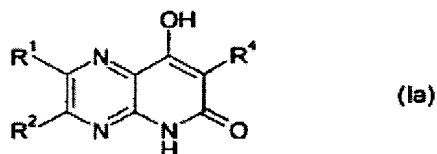
7. Composto, caracterizado pelo fato de ser de Fórmula (Ia):



em que R¹, R² e R⁴ são conforme é definido para os compostos de Fórmula (I); ou sais ou N-óxidos dos mesmos, com a condição de que se R¹ e R² são hidrogênio, R⁴ não é 4-bromo-2,6-difluorfenil, 2-bromofenil, 2-cloro-4-fluorfenil, 2-cloro-6-fluorfenil, 4-cloro-2-fluorfenil, 4-cloro-2-metilfenil, 2-clorofenil, 5-cloro-2-trifluormetilfenil, 2,4-diclorofenil, 2,6-diclorofenil, 2,6-difluór-4-cianofenil, 2,6-difluór-4-metoxifenil, 2,6-difluór-4-metilfenil, 2,3-difluorfenil, 2,4-difluorfenil, 2,5-difluorfenil, 2,6-difluorfenil, 2,4-dimetilfenil, 2,6-dimetilfenil, 2-flúor-4-metilfenil, 2-fluorfenil, 2-flúor-6-metoxifenil, 2-flúor-6-metilfenil, 4-flúor-2-metilfenil, 4-flúor-2-trifluormetilfenil, 5-flúor-2-trifluormetilfenil, 2,3,4,5,6-pentafluorfenil,

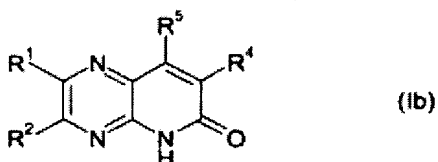
2,3,5,6-tetrafluorfenil, 2,3,4-trifluorfenil, 2,4,6-trifluorfenil, 2,5,6-trifluorfenil ou 2,4,6-trimetilfenil.

8. Composto, caracterizado pelo fato de ser de fórmula (Ia):



e que R^1 , R^2 e R^4 são conforme é definido para os compostos de fórmula (I); ou sais ou N-óxidos dos mesmos, com a condição de que se R^1 e R^2 são hidrogênio, R^4 não é 2-bromo-4,6-difluorfenil, 4-bromo-2,6-difluorfenil, 2-bromo-6-fluorfenil, 2-bromofenil, 2-cloro-4,6-difluorfenil, 2-cloro-4-fluorfenil, 2-cloro-6-fluorfenil, 4-cloro-2-fluorfenil, 2-cloro-6-metilfenil, 4-cloro-2-metilfenil, 2-clorofenil, 2-cloro-6-trifluormetilfenil, 5-cloro-2-trifluormetilfenil, 2,4-dicloro-6-fluorfenil, 2,6-dicloro-4-fluorfenil, 2,4-diclorofenil, 2,6-diclorofenil, 2,6-diflúor-4-cianofenil, 2,4-diflúor-6-metoxifenil, 2,6-diflúor-4-metoxifenil, 2,4-diflúor-6-metilfenil, 2,6-diflúor-4-metilfenil, 2,3-difluorfenil, 2,4-difluorenil, 2,5-difluorenil, 2,6-difluorenil, 2,4-diflúor-6-trifluormetilfenil, 2,6-dimetoxifenil, 2,4-dimetilfenil, 2,6-dimetilfenil, 2,6-di(trifluormetil)-fenil, 2-flúor-6-metoxifenil, 2-flúor-4-metilfenil, 2-flúor-6-metilfenil, 4-flúor-2-metilfenil, 2-fluorfenil, 2-flúor-6-trifluormetilfenil, 4-flúor-2-trifluormetilfenil, 5-flúor-2-trifluormetilfenil, 2-metoxifenil, 2,3,4,5,6-pentaclorofenil, 2,3,4,5,6-pentafluorfenil, 2,3,5,6-tetrafluorfenil, 2,3,6-triclorofenil, 2,4,6-triclorofenil, 2-trifluormetilfenil, 2,3,4-trifluorfenil, 2,4,6-trifluorfenil, 2,5,6-trifluorfenil ou 2,4,6-trimetilfenil.

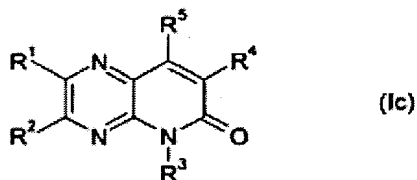
9. Composto, caracterizado pelo fato de ser de Fórmula (Ib):



e que R^1 , R^2 e R^4 são conforme definido para os compostos de fórmula (I) e R^5 é R^9 -óxi, R^{10} -carbonilóxi, tri- R^{11} -sililóxi ou R^{12} -sulfonilóxi;

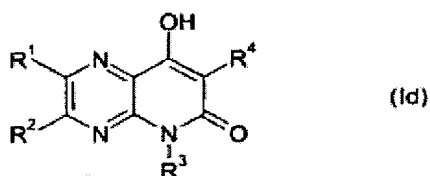
ou sais ou N-óxidos dos mesmos.

10. Composto, caracterizado pelo fato de ser de fórmula (Ic):



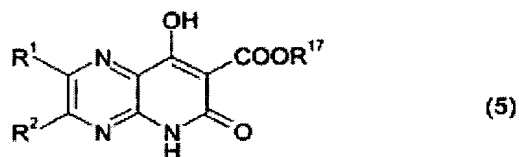
e que R^1 , R^2 e R^4 são conforme é definido para os compostos de fórmula (I) e R^3 é alquil C_1 - C_{10} , alquenil C_2 - C_{10} , alquinil C_2 - C_{10} , cicloalquil C_3 - C_{10} , cicloalquil C_3 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, alcóxi C_1 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, cianoalquil C_1 - C_{10} , alcóxicarbonil C_1 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, N-alquil C_1 - C_3 -aminocarbonilalquil C_1 - C_6 -, N,N-di-(alquil C_1 - C_3)-aminocarbonilalquil C_1 - C_6 -, arilalquil C_1 - C_6 - ou arilalquil C_1 - C_6 - substituído com de um a três R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heterociclilalquil C_1 - C_6 ou heterociclilalquil C_1 - C_6 substituído com de um a três substituintes R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente; e R^5 é R^9 -óxi, R^{10} -carbonilóxi, tri- R^{11} -sililóxi- ou R^{12} -sulfonilóxi; ou sais ou N-óxidos dos mesmos.

11. Composto, caracterizado pelo fato de ser de fórmula (Id):



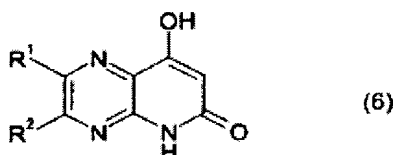
e que R^1 , R^2 e R^4 são conforme é definido para os compostos de fórmula (I) e R^3 é alquil C_1 - C_{10} , alquenil C_2 - C_{10} , alquinil C_2 - C_{10} , cicloalquil C_3 - C_{10} , cicloalquil C_3 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, alcóxi C_1 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, cianoalquil C_1 - C_{10} , alcóxicarbonil C_1 - C_{10} -alquil C_1 - C_6 -, N-alquil C_1 - C_3 -aminocarbonilalquil C_1 - C_6 -, N,N-di-(alquil C_1 - C_3)-aminocarbonilalquil C_1 - C_6 -, arilalquil C_1 - C_6 - ou arilalquil C_1 - C_6 - substituído com de um a três substituintes R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente, ou heterociclilalquil C_1 - C_6 ou heterociclilalquil C_1 - C_6 substituído com de um a três substituintes R^7 , o qual pode ser o mesmo ou diferente; ou sais ou N-óxidos dos mesmos.

12. Composto, caracterizado pelo fato de ser de fórmula (5):



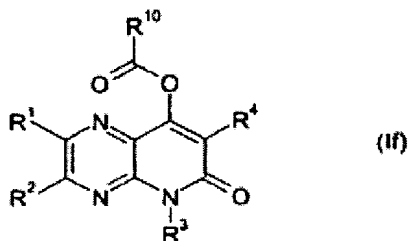
em que R¹ e R² são conforme é definido para os compostos de fórmula (I) e R¹⁷ é alquilC₁-C₆; ou sais ou N-óxidos dos mesmos.

13. Composto, caracterizado pelo fato de ser de fórmula (6):

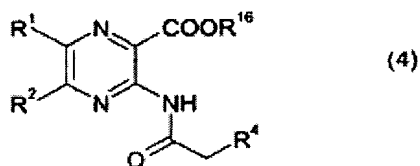


5 e que R¹ e R² são conforme é definido para os compostos de fórmula (I); ou sais ou N-óxidos dos mesmos.

14. Processo para preparar um composto de fórmula (If):



10 e que R¹, R², R³, R⁴ e R¹⁰ são conforme é definido na reivindicação 1, caracterizado pelo fato de ser pela reação de um composto de fórmula (4)



15 em que R¹, R² e R⁴ são conforme é definido na reivindicação 1 e R¹⁶ é alquil C₁-C₆ com um composto de fórmula R³LG, em que R³ é conforme definido na reivindicação 1 e LG é um grupo de saída na presença de uma base, seguido pela reação com um cloreto de ácido de fórmula R¹⁰COCl ou um anidrido ácido de fórmula (R¹⁰CO)₂O, em que R¹⁰ é como

definido na reivindicação 1, no mesmo recipiente reacional.

15. Composição herbicida, caracterizada pelo fato de compreender uma quantidade herbicidamente eficaz de um composto de fórmula (I) além dos adjuvantes de formulação.

5

16. Composição herbicida, caracterizada pelo fato de compreender uma quantidade herbicidamente eficaz de um composto de fórmula (I), um ou mais outros herbicidas e opcionalmente um ou mais agentes de segurança.

RESUMO

“MÉTODO PARA CONTROLAR PLANTAS, COMPOSTO, PROCESSO PARA PREPARAR UM COMPOSTO, E, COMPOSIÇÃO HERBICIDA”

5 A presente invenção se refere a um método de controle de plantas ou de inibição do crescimento vegetal, o qual compreende a aplicação às plantas ou aos seus locais de uma quantidade herbicidamente eficaz de um composto de fórmula (I), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são conforme é definido na reivindicação 1; ou sais ou N-óxidos dos mesmos. Além disso, a presente invenção se refere aos processos para preparar compostos de fórmula (I), aos
10 compostos herbicidas compreendendo os compostos de fórmula (I) e a certas novas pirido[2,3-b]pirazinas.