



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

(11) PI 0923893-0 B1



(22) Data do Depósito: 28/12/2009

(45) Data de Concessão: 09/03/2021

(54) Título: DERIVADOS DE PIRIMIDINA OPTICAMENTE ATIVOS, SEU USO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, COMPOSIÇÃO HERBICIDA OU REGULADORA DO CRESCIMENTO DE PLANTAS, E PROCESSO PARA CONTROLE DE PLANTAS NOCIVAS OU PARA REGULAR O CRESCIMENTO DE PLANTAS

(51) Int.Cl.: C07D 239/48; C07D 239/50; C07D 405/12; A01N 43/54.

(30) Prioridade Unionista: 30/12/2000 EP 08 022522.0.

(73) Titular(es): BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH.

(72) Inventor(es): KLEMENS MINN; HANSJÖRG DIETRICH; JAN DITTGEN; DIETER FEUCHT; ISOLDE HÄUSER-HAHN; CHRISTOPHER HUGH ROSINGER.

(86) Pedido PCT: PCT EP2009009287 de 28/12/2009

(87) Publicação PCT: WO 2010/076009 de 08/07/2010

(85) Data do Início da Fase Nacional: 30/06/2011

(57) Resumo: DERIVADOS DE PIRIMIDINA E SEU EMPREGO PARA O CONTROLE DE CRESCIMENTO DE PLANTAS INDESEJADAS. A presente invenção refere-se a derivados de pirimidina e a seu emprego para o controle do crescimento de plantas indesejadas. São descritos compostos de fórmula geral (I) e seu emprego no âmbito da proteção de plantas.

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "DERIVADOS DE PIRIMIDINA OPTICAMENTE ATIVOS, SEU USO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, COMPOSIÇÃO HERBICIDA OU REGULADORA DO CRESCIMENTO DE PLANTAS, E PROCESSO PARA CONTROLE DE PLANTAS NOCIVAS OU PARA REGULAR O CRESCIMENTO DE PLANTAS".

Descrição

[001] A presente invenção se refere ao campo técnico dos defensivos agrícolas, em particular a herbicidas para o controle seletivo de ervas daninhas e gramíneas daninhas em culturas de plantas úteis.

[002] Se refere, em especial, a 2-aminopiridinas, a um processo para sua preparação, assim como a seu uso no controle de plantas daninhas.

[003] O estado da técnica descreve pirimidinas que apresentam uma eficácia herbicida. Assim, por exemplo, o EP 0 523 533 A1 descreve 4-aminopirimidinas substituídas e seu uso no âmbito da proteção de plantas. O WO 2008/043031 divulga (R)-6-cloro-N4-(8-fluorocroman-4-il)pirimidina-2,4,5-triaminas como pré-etapa para a preparação de purinas farmacologicamente eficazes.

[004] O uso dos derivados desse tipo como herbicidas seletivos para o controle de plantas daninhas ou como reguladores do crescimento de plantas em diversas culturas de plantas úteis, entretanto, requer uma taxa de aplicação excessiva ou leva a danos indesejados das plantas úteis. Além disso, o uso dos ingredientes ativos em muitos casos não é econômico devido aos custos de produção relativamente elevados.

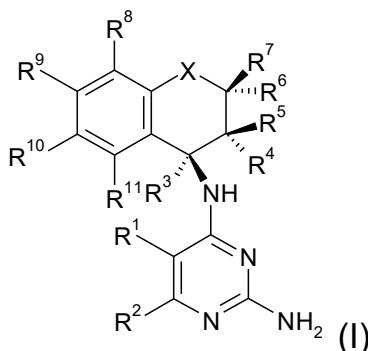
[005] É, portanto, desejável fornecer ingredientes ativos químicos alternativos à base de derivados de pirimidina, que podem ser empregados como herbicidas ou como reguladores do crescimento de plantas, e que estão associados a determinadas vantagens em compara-

ção com os sistemas conhecidos do estado da técnica.

[006] Assim o objeto geral da presente invenção é o de preparar derivados de pirimidina alternativos que podem ser empregados como herbicidas ou reguladores do crescimento de plantas, em particular com uma eficácia herbicida satisfatória contra plantas daninhas, com um amplo espectro perante plantas daninhas e/ou com uma maior seletividade em plantas úteis de cultura. Esses derivados de pirimidina devem, assim, exibir, de preferência, um melhor perfil de propriedades, em particular uma melhor eficácia herbicida contra plantas daninhas, um espectro mais amplo perante plantas daninhas e/ou uma maior seletividade em plantas úteis de cultura, do que os derivados de pirimidina conhecidos do estado da técnica.

[007] De acordo com a invenção, foram, então, constatadas novas pirimidinas que podem ser empregadas vantajosamente como herbicidas e reguladores do crescimento de plantas. Os compostos dessa série distinguem-se, além de por um bom perfil de eficácia e compatibilidade com plantas de cultura, por um processo de preparação mais econômico e possibilidades de acesso, já que as substâncias de acordo com a invenção podem ser preparadas a partir de precursores de bom preço e prontamente acessíveis, sendo assim possível dispensar o uso de produtos intermediários mais caros e dificilmente disponíveis.

[008] Objetos da presente invenção são, portanto, compostos da Fórmula (I) e seus sais



na qual

[009] R¹ e R², independentemente um do outro, são selecionados do grupo que consiste em

- hidrogênio, halogênio, hidróxi, ciano, nitro, amino, C(O)OH, C(O)NH₂;

- (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-halogenalquila, (C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₁-C₆)-haloalquilcarbonila, (C₁-C₆)-alquilcarbonilóxi, (C₁-C₆)-halogenalquilcarbonilóxi, (C₁-C₆)-alquilcarbonila-(C₁-C₄)-alquila;

- (C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-halogenalcóxi, (C₁-C₆)-alcoxicarbonila, (C₁-C₆)-haloalcoxicarbonila, (C₁-C₆)-alcoxicarbonila-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalcoxicarbonila-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alcoxicarbonila-(C₁-C₆)-halogenalquila, (C₁-C₆)-halogenalcóxicarbonila-(C₁-C₆)-halogenalquila;

- (C₂-C₆)-alquenila, (C₂-C₆)-halogenalquenila, (C₂-C₆)-alquenilcarbonila, (C₂-C₆)-haloalquenilcarbonila, (C₂-C₆)-alquenilóxi, (C₂-C₆)-haloalquenilóxi, (C₂-C₆)-alqueniloxicarbonila, (C₂-C₆)-haloalqueniloxicarbonila;

- (C₂-C₆)-alquinila, (C₂-C₆)-halogenalquinila, (C₂-C₆)-alquinilcarbonila, (C₂-C₆)-haloalquinilcarbonila, (C₂-C₆)-alquinilóxi, (C₂-C₆)-haloalquinilóxi, (C₂-C₆)-alquiniloxicarbonila, (C₂-C₆)-halogenalquiniloxicarbonila;

- tri(C₁-C₆)-alquilsilil-(C₂-C₆)-alquinila, di(C₁-C₆)-alquilsilil-(C₂-C₆)-alquinila, mono(C₁-C₆)-alquilsilil-(C₂-C₆)-alquinila, fenilsilil-(C₂-C₆)-alquinila;

- (C₆-C₁₄)-arila, (C₆-C₁₄)-arilóxi, (C₆-C₁₄)-arilcarbonila e (C₆-C₁₄)-ariloxicarbonila, que podem em cada caso ser substituídas na parcela arila por halogênio, (C₁-C₆)-alquila e/ou (C₁-C₆)-haloalquila;

- (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-alquila, (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-alcóxi, (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-

alquilcarbonilóxi, (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-alcoxicarbonila, (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-alcoxicarbonilóxi;

- mono((C₁-C₆)-alquil) amino, mono((C₁-C₆)-haloalquil)-amino, di((C₁-C₆)-alquil) amino, di((C₁-C₆)-haloalquil)-amino, ((C₁-C₆)-alquil-(C₁-C₆)-haloalquil)-amino, N-((C₁-C₆)-alcanoil)-amino, N-((C₁-C₆)-haloalcanoil)-amino, aminocarbonil-(C₁-C₆)-alquila, di(C₁-C₆)-alquilaminocarbonil-(C₁-C₆)-alquila;

- mono((C₁-C₆)-alquil)-amino-carbonila, mono((C₁-C₆)-haloalquil)-amino-carbonila, di((C₁-C₆)-alquil)-amino-carbonila, di((C₁-C₆)-haloalquil)-amino-carbonila, ((C₁-C₆)-alquil-(C₁-C₆)-haloalquil)-amino-carbonila, N-((C₁-C₆)-alcanoil)-amino-carbonila, N-((C₁-C₆)-haloalcanoil)-amino-carbonila;

- (C₁-C₆)-alcóxi-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alcóxi-(C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-alcoxicarbonil-(C₁-C₆)-alcóxi;

- (C₃-C₈)-cicloalquila, que pode ser opcionalmente substituída no radical cicloalquila por (C₁-C₆)-alquila e/ou halogênio; (C₃-C₈)-cicloalcóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alcóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-haloalcóxi, (C₃-C₈)-cicloalquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalcoxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-haloalquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alcoxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-haloalcoxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalcoxicarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-haloalquilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alcoxicarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-haloalcoxicarbonilóxi;

- (C₃-C₈)-cicloalquenila, (C₃-C₈)-cicloalquenilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-halogenalquila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alcóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-halogenalcóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenilcarbonila, (C₃-

(C₈)-cicloalqueniloxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-halogenalquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alcoxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-haloalcoxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalqueniloxicarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alquilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-halogenalquilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alcoxicarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-haloalcoxicarbonilóxi;

- hidróxi-(C₁-C₆)-alquila, hidróxi-(C₁-C₆)-alcóxi, ciano-(C₁-C₆)-alcóxi, ciano-(C₁-C₆)-alquila;

- (C₁-C₆)-alquilsulfonila, (C₁-C₆)-alquiltio, (C₁-C₆)-alquilsulfinila, (C₁-C₆)-haloalquilsulfonila, (C₁-C₆)-halogenalquiltio, (C₁-C₆)-halogenalquilsulfinila, (C₁-C₆)-alquilsulfonil-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquilsulfinil-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquilsulfonil-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquiltio-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquilsulfinil-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquilsulfonil-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alquilsulfinil-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-haloalquiltio-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-haloalquilsulfinil-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alquilsulfonilóxi, (C₁-C₆)-halogenalquilsulfonilóxi, (C₁-C₆)-alquiltiocarbonila, (C₁-C₆)-haloalquiltiocarbonila, (C₁-C₆)-alquiltiocarbonilóxi, (C₁-C₆)-haloalquiltiocarbonilóxi, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-alquilcarbonilóxi, (C₄-C₁₄)-arilsulfonila, (C₆-C₁₄)-ariltio, (C₆-C₁₄)-arilsulfinila, (C₃-C₈)-cicloalquiltio, (C₃-C₈)-alqueniltio, (C₃-C₈)-cicloalqueniltio, (C₃-C₆)-alquiniltio;

- os radicais R¹ e R² juntamente formam um grupo (C₂-C₆)-alquileno, que podem compreender um ou mais átomos de oxigênio e/ou de enxofre, onde o grupo (C₂-C₆)-alquileno pode ser monossustituído ou polissustituído por halogênio e os substituintes halogênio

respectivos podem ser iguais ou diferentes;

[010] R^3 é selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila e (C₁-C₆)-haloalquila;

[011] R^4 e R^5 em cada caso, independentemente um do outro, são selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila, hidróxi, (C₁-C₆)-alcóxi e (C₁-C₆)-halogenalcóxi; ou, juntamente com o átomo de carbono ao qual eles estão ligados, formam um anel de três a sete membros;

R^6 e

[012] R^7 em cada caso, independentemente um do outro, são selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-halogenalcóxi, (C₆-C₁₄)-arila, (C₆-C₁₄)-arilóxi, (C₆-C₁₄)-arilcarbonila e (C₆-C₁₄)-ariloxicarbonila; ou os radicais R^6 e R^7 juntamente formam um grupo (C₂-C₇)-alquilenos, que pode compreender um ou mais átomos de oxigênio e/ou de enxofre, onde o grupo (C₂-C₇)-alquilenos pode ser monossustituído ou polissustituído por halogênio e os substituintes halogênio respectivos podem ser idênticos ou diferentes,

[013] R^8 , R^9 , R^{10} e R^{11} , em cada caso, independentemente um do outro, são selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, halogênio, ciano, nitro, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₁-C₆)-alquiloxicarbonila, (C₁-C₆)-alquilaminocarbonila, (C₁-C₆)-dialquilaminocarbonila, (C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-halogenalcóxi, (C₂-C₆)-alquinila, (C₂-C₆)-halogenalquinila, (C₂-C₆)-alquinilcarbonila, (C₂-C₆)-haloalquinilcarbonila, (C₂-C₆)-alquinilóxi, (C₂-C₆)-haloalquinilóxi, (C₂-C₆)-alquiniloxicarbonila e (C₂-C₆)-halogenalquiniloxicarbonila; e

[014] X representa uma ligação, CH₂, O, S, carbonila, NH, CR₁₂R₁₃ e NR₁₄,

[015] R^{12} e R^{13} em cada caso, independentemente um do outro,

são selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila e (C₁-C₆)-haloalquila,

[016] R¹⁴ é selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila,

a) com a condição de que pelo menos um radical de R¹, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ ou R¹¹ não representa hidrogênio caso R² seja CF₃,

b) R² não representa cloro caso R¹ seja NH₂.

[017] Os compostos, de acordo com a invenção, diferenciam-se dos compostos de acordo com a EP 0 523 533 A1 pelo fato de que se tratam de 4-aminopirimidina-2-aminas biclicamente substituídas.

[018] De acordo com a invenção verificou-se que esses compostos apresentam um bom perfil de eficácia e compatibilidade com plantas de cultura.

[019] A seguir são então descritos os significados para os substituintes individuais primeiramente preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos.

[020] Um primeiro modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula Geral (I) na qual

[021] R¹ é de preferência selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, halogênio, ciano, C(=O)NH₂, NO₂, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₁-C₆)-haloalquila, (C₃-C₆)-ciclopropila, (C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-tioalquila, (C₂-C₆)-alquinila, mono-(C₁-C₆)-alquilamino, di-(C₁-C₆)-alquilamino e tri-(C₁-C₆)-alquilsilil-(C₂-C₆)-alquinila;

[022] R¹ é particularmente, de preferência, selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, ciano, flúor, cloro, bromo, iodo, nitro, trimetilsililetinila, metila, etila, propila, isopropila, butila, terc-butila, n-pentila, n-heptila, ciclopropila, ciclobutila, acetila, etinila, amino, dimetilamino, trifluorometila, difluorometila, monofluorometila, metóxi, etóxi e metoximetila; e

[023] R^1 é muito particularmente, de preferência, ciano, acetila ou trifluorometila.

[024] Um segundo modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula Geral (I) na qual

[025] R^2 é de preferência selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, halogênio, (C_1-C_6) -alquilfenila; (C_6-C_{14}) -arila, que podem ser substituídos no radical arila por (C_1-C_6) -alquila, (C_6-C_{14}) -haloalquila e/ou halogênio; C_6 -aril- (C_1-C_6) -haloalquila, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -haloalquila, (C_1-C_6) -alcóxi, (C_1-C_6) -alcóxi- (C_1-C_6) -alquila; (C_3-C_6) -cicloalquila, que podem ser substituídos no radical cicloalquila por (C_1-C_6) -alquila, (C_6-C_{14}) -haloarila e/ou halogênio; 1- (C_1-C_6) -alquilciclopropila, 1- $((C_1-C_6)$ -alquil- C_6 -aril)ciclopropila, 1-(mono-halogenofenil)ciclopropila, 1-(di-halogenofenil)ciclopropila, mono (C_1-C_6) -alquilamino, di (C_1-C_6) -alquilamino, (C_1-C_6) -tioalquila, (C_1-C_6) -alquiltio, (C_1-C_6) -alcóxi e amino;

[026] R^2 é particularmente preferentemente selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, cloro, fenila, 2-metilfenila, 3-trifluorometilfenila, metila, etila, isopropila, butila, terc-butila, n-pentila, n-heptila, trifluorometila, 1-metilciclopropila, 1-(p-xilil)ciclopropila, 1-(2,4-diclorofenil)-ciclopropila, amino, dimetilamino, trifluorometila, difluorometila, monofluorometila, $CHFCH_3$, $CF(CH_3)_2$, $CHF(CH_2CH_3)$, 1-fluorociclopropila, ciclopentila, metóxi, etóxi, metoximetila, etoximetila, tiometila, metiltio e metóxi; e

[027] R^2 é muito particularmente preferentemente hidrogênio, metila ou difluorometila.

[028] Um terceiro modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula Geral (I) nos quais

[029] R^1 e R^2 , de preferência, juntos com os átomos de carbono aos quais eles estão ligados, formam um anel de cinco ou seis membros, que pode ser interrompido por um ou dois heteroátomos selecio-

nados do grupo que consiste em oxigênio e enxofre;

[030] particularmente de preferência, junto com os átomos de carbono aos quais eles estão ligados, formam um anel de cinco membros, que pode ser interrompido por um heteroátomo selecionado do grupo que consiste em oxigênio e enxofre; e

[031] são muito particularmente preferentemente $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-}$ ou $-\text{CH}_2\text{-S-CH}_2\text{-}$.

[032] Um quarto modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula Geral (I) na qual

[033] R^3 é de preferência hidrogênio ou $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$; e

[034] R^3 é particularmente preferentemente hidrogênio.

[035] Um quinto modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula Geral (I) na qual

[036] R^4 e R^5 , em cada caso, independentemente um do outro, são de preferência selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$, hidróxi, ciclopropila e $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alcóxi}$;

[037] R^4 e R^5 , em cada caso, independentemente um do outro, são particularmente de preferência selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, metila, etila, propila, ciclopropila, hidróxi e metóxi; e

[038] R^4 e R^5 , em cada caso, independentemente um do outro, são muito particularmente de preferência selecionados do grupo que consiste em metila, etila ou hidrogênio.

[039] Neste quinto modo de execução é especialmente preferido, quando pelo menos um dos radicais R^4 ou R^5 é hidrogênio. Ainda é mais preferido se pelo menos um dos radicais R^4 ou R^5 é hidrogênio e o outro radical R^4 ou R^5 não é hidrogênio, em particular é $(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{-alquila}$.

[040] Neste quinto modo de execução é muito especialmente preferido quando um dos radicais R^4 ou R^5 é hidrogênio e o outro radical de R^4 ou R^5 é metila.

[041] Um sexto modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula Geral (I) na qual

[042] R^4 e R^5 de preferência juntos formam um grupo alquilenos (C_2-C_7)-alquilenos que pode compreender um ou mais átomos de oxigênio e/ou enxofre, onde o grupo (C_2-C_7)-alquilenos pode ser monosubstituído ou polissubstituído por halogênio e os respectivos substituintes de halogênio podem ser iguais ou diferentes; e

[043] R^4 e R^5 , são particularmente preferentemente $-CH_2-CH_2-CH_2-$ ou $-CH_2-CH_2-$.

[044] Um sétimo modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula Geral (I) na qual

[045] R^6 e R^7 , independentemente um do outro, são selecionados grupo que consiste em hidrogênio, (C_1-C_6)-alquila e (C_6-C_{14})-arila;

[046] R^6 e R^7 , independentemente um do outro são particularmente preferentemente selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, metila e fenila; e

[047] R^6 e R^7 são muito particularmente, de preferência, hidrogênio.

[048] Um oitavo modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula Geral (I), na qual

[049] R^8 é de preferência selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, (C_1-C_6)-alquila ou halogênio;

[050] R^8 é particularmente preferentemente selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, metila ou flúor; e

[051] R^8 é muito particularmente preferentemente hidrogênio.

[052] Um nono modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula Geral (I) na qual

[053] R^9 é de preferência selecionado do grupo que consiste em hidrogênio e (C_1-C_6)-alquila;

[054] R^9 é particularmente preferentemente selecionado do grupo

que consiste em hidrogênio e metila; e

[055] R^9 é muito particularmente preferentemente hidrogênio.

[056] Um décimo modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula (I) na qual

[057] R^{10} é de preferência selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, $di(C_1-C_6)$ -alquilamino, halogênio, (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_6) -alquinila, (C_1-C_6) -alquil- (C_2-C_6) -alquinila, (C_1-C_6) -alcóxi- (C_1-C_6) -alquil- (C_2-C_6) -alquinila, ciano, (C_1-C_6) -alcóxicarbonila e aminocarbonila;

[058] R^{10} é particularmente preferentemente selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, metila, propila, isopropila, butila, terc-butila, dimetilamino, flúor, cloro, bromo, iodo, etenila, etinila, metiletinila, etiletinila, $MeOCH_2C\equiv C-$, ciano, $COOMe$ e $CONH_2$; e

[059] R^{10} é muito particularmente preferentemente hidrogênio ou metila.

[060] Um décimo primeiro modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula (I) na qual

[061] R^{11} é de preferência selecionado do grupo que consiste em hidrogênio e (C_1-C_6) -alquila;

[062] R^{11} é particularmente preferentemente selecionado do grupo que consiste em hidrogênio e metila; e

[063] R^{11} é muito particularmente preferentemente hidrogênio.

[064] Um décimo segundo modo de execução da presente invenção abrange compostos da Fórmula Geral (I) na qual

[065] X é de preferência selecionado do grupo que consiste em CH_2 , O, NH, uma ligação química e S; e

[066] X é particularmente preferentemente selecionado do grupo que consiste em CH_2 , O e uma ligação química.

[067] No contexto da presente invenção, é possível combinar os significados individuais preferidos, particularmente preferidos e muito

particularmente preferidos para os substituintes R^1 até R^{11} e X entre si conforme desejado. Isto significa que os compostos da Fórmula Geral (I) estão abrangidos pela presente invenção na qual, por exemplo, o substituinte R^1 tem um significado preferido e os substituintes R^2 até R^{11} possuem o significado geral, ou o substituinte R^2 possui um significado preferido, o substituinte R^3 possui um significado particularmente preferido e os outros substituintes possuem um significado geral.

[068] No contexto da presente invenção, o composto de Fórmula (I) também abrange compostos que foram quaternizados por uma a) protonação, b) alquilação ou c) oxidação para formar um íon em um átomo de nitrogênio.

[069] Os compostos de Fórmula (I) podem formar sais.

[070] A formação de sal ocorrer como um resultado da ação de uma base naqueles compostos da Fórmula (I) que portam um átomo de hidrogênio ácido, por exemplo, quando R^1 compreende um grupo COOH ou um grupo sulfonamida $-NH\text{SO}_2-$. Bases apropriadas são, por exemplo, aminas orgânicas, tais como trialkilaminas, morfolina, piperidina ou piridina, e também amônia, hidróxido de metal alcalino ou de metal alcalino terroso, carbonatos e hidrogenocarbonatos, em particular hidróxido de sódio, e hidróxido de potássio, carbonato de sódio e carbonato de potássio e hidrogenocarbonato de sódio e hidrogenocarbonato de potássio. Esses sais são compostos nos quais o hidrogênio ácido é substituído por um cátion apropriado para a agricultura, por exemplo, sais de metal, em particular sais de metal alcalino ou sais de metal alcalino terroso, em particular sais de sódio e sais de potássio, ou também sais de amônio, sais com aminas orgânicas ou sais de amônio quaternários, por exemplo com cátions da Fórmula $[NRR'R''R''']^+$, na qual R até R''' , em cada caso independentemente um do outro, são um radical orgânico, em particular alquila, arila, aralquila ou alquilarila. Também são apropriados sais de alquilsulfônio e

de alquilsulfoxônio, tais como sais de (C₁-C₄)-trialquilsulfônio e (C₁-C₄)-trialquilsulfoxônio.

[071] Os compostos de Fórmula (I) podem formar sais através da reação de adição de um ácido inorgânico ou orgânico apropriado, tal como, por exemplo, ácidos minerais como, por exemplo, HCl, HBr, H₂SO₄, H₃PO₄ ou HNO₃, ou ácidos orgânicos, por exemplo ácidos carboxílicos, tais como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiônico, ácido oxálico, ácido láctico ou ácido salicílico, ou ácidos sulfônicos como, por exemplo ácido p-toluenossulfônico em um grupo básico, tal como, por exemplo, amino, alquilamino, dialquilamino, piperidino, morfolino ou piridino. Esses sais compreendem, então, a base conjugada do ácido como ânion.

[072] Substituintes apropriados que estão presentes na forma desprotonada, tal como, por exemplo, ácidos sulfônicos ou ácidos carboxílicos, podem formar sais internos com grupos que por sua vez são protonáveis, tais como grupos amino.

[073] A seguir os compostos de Fórmula (I) e seus sais também são denominados abreviadamente de "compostos (I)" de acordo com a invenção ou são empregados de acordo com a invenção.

[074] Na Fórmula Geral (I) e em todas as outras Fórmulas na presente invenção os radicais alquila, alcóxi, haloalquila, haloalcóxi, alquilamino, alquiltio, haloalquiltio, assim como os radicais insaturados e/ou substituídos correspondentes na estrutura principal de carbono, podem, em cada caso, ser de cadeia reta ou ramificada. Se nada em especial é especificado, nesses radicais é dada preferência às estruturas de cadeia de carbono baixas, por exemplo, com 1 até 6 átomos de carbono, em particular 1 até 4 átomos de carbono ou em grupos insaturados com 2 até 6 átomos de carbono, em particular 2 até 4 átomos de carbono. Radicais alquila, incluindo no composto significados tais como alcóxi, haloalquila etc., representam, por exemplo, metila, etila,

n-propila ou isopropila, n-butila, isobutila, t-butila ou 2-butila, pentila, hexila, tal como n-hexila, isso-hexila e 1,3-dimetilbutila, heptila, tal como n-heptila, 1-metil-hexila e 1,4-dimetilpentila; radicais alquenila e alquinila possuem o significado dos radicais insaturados possíveis correspondentes aos radicais alquila; onde está presente pelo menos uma dupla ligação ou tripla ligação, de preferência uma dupla ligação ou tripla ligação. Alquenila é, por exemplo, vinila, alila, 1-metilprop-2-en-1-ila, 2-metilprop-2-en-1-ila, but-2-en-1-ila, but-3-en-1-ila, 1-metilbut-3-en-1-ila e 1-metilbut-2-en-1-ila; alquinila é, por exemplo, etinila, propargila, but-2-in-1-ila, but-3-in-1-ila e 1-metilbut-3-in-1-ila.

[075] Grupos cicloalquila são, por exemplo, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, ciclo-hexila, ciclo-heptila e ciclo-octila. Os grupos cicloalquila podem ocorrer na forma bicíclica ou tricíclica.

[076] Se grupos haloalquila e radicais haloalquila de haloalcóxi, haloalquiltio, haloalquenila, haloalquinila etc. são dados, nesses radicais a cadeia de carbono é mais baixa, por exemplo, contendo de 1 até 6 átomos de carbono ou de 2 até 6, em particular de 1 até 4 átomos de carbono ou de preferência de 2 até 4 átomos de carbono, assim como os respectivos radicais insaturados e/ou substituídos na cadeia principal de carbono são, em cada caso, cadeia reta ou ramificada. Exemplos são difluormetila, 2,2,2-trifluoretila, trifluoralila, 1-cloroprop-1-il-3-ila.

[077] Grupos alquilenos, nesses radicais, são as cadeias principais de carbono baixas, por exemplo, contendo de 1 até 10 átomos de carbono, em particular de 1 até 6 átomos de carbono ou de preferência de 2 até 4 átomos de carbono, e os radicais correspondentes insaturados e/ou substituídos na estrutura principal de carbono, que pode ser em cada caso de cadeia reta ou ramificada. Exemplos são metileno, etileno, n-propileno e isopropileno e n-butileno, sec-butileno, isobutileno, t-butileno.

[078] Nesses radicais os grupos hidroxialquila são os de cadeias principais de carbono baixas, por exemplo, contendo de 1 até 6 átomos de carbono, em particular de 1 até 4 átomos de carbono, e os radicais insaturados correspondentes e/ou radicais substituídos na cadeia principal de carbono, que pode ser em cada caso de cadeia reta ou ramificada. Exemplos disto são 1,2-di-hidroxietila e 3-hidroxipropila.

[079] Halogênio significa flúor, cloro, bromo ou iodo. Haloalquila, haloalquenila e haloalquinila são alquila, alquenila ou alquinila, respectivamente, parcialmente ou completamente substituídos por halogênio, de preferência por flúor, cloro ou bromo, em particular por flúor e/ou cloro, por exemplo, mono-haloalquila, per-haloalquila, CF_3 , CHF_2 , CH_2F , CF_3CF_2 , CH_2FCHCl , CCl_3 , CHCl_2 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; haloalcóxi é por exemplo. OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2F , $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$, OCH_2CF_3 e $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; o mesmo se aplica para haloalquenila e outros radicais substituídos por halogênio.

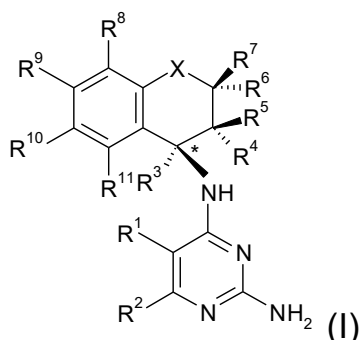
[080] Arila significa um sistema monocíclico, bicíclico ou policíclico aromático, por exemplo, fenila ou naftila, de preferência fenila.

[081] Sobretudo por razões de uma maior eficácia herbicida, melhor seletividade e/ou melhor preparabilidade, os compostos da Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção ou seus sais agroquímicos ou quaternários são de particular interesse, nos quais os radicais individuais possuem um ou mais dos significados preferidos já especificados ou especificados abaixo, ou em particular aqueles nos quais um ou mais dos significados preferidos já especificados ou especificados abaixo ocorrem em combinação.

[082] As definições dos radicais dadas acima em geral ou dadas em faixas de aplicação preferidas valem tanto para os produtos finais da Fórmula Geral (I) e como também correspondentemente para os produtos de partida e produtos intermediários requisitados em cada caso para a preparação. Essas definições dos radicais podem ser tro-

cadadas entre si, e também em particular entre as faixas preferidas mencionadas.

[083] Os presentes compostos da Fórmula Geral (I) apresentam um átomo de carbono quiral, que é mostrado na estrutura apresentada abaixo pelo símbolo (*):



[084] De acordo com as regras de Cahn, Ingold e Prelog (regras CIP), este átomo de carbono tanto pode apresentar uma configuração (R) como também uma configuração (S).

[085] A presente invenção abrange compostos da Fórmula Geral (I) tanto com configuração (S) quanto com configuração (R), isto é, a presente invenção abrange os compostos da Fórmula Geral (I) na qual o átomo de carbono em questão apresenta

(1) uma configuração (R); ou

(2) uma configuração (S).

[086] Além disso, no contexto da presente invenção também são abrangidos

(3) quaisquer misturas desejadas de compostos da Fórmula (I) que apresentam a configuração (R) (compostos da Fórmula (I-(R))), com compostos da Fórmula (I) que possuem uma configuração (S) (compostos da Fórmula (I-(S))),

[087] Sendo que uma mistura racêmica dos compostos da Fórmula Geral (I) com configuração (R) e (S) está igualmente abrangida pela presente invenção.

[088] Entretanto, no contexto da presente invenção, é dada prefe-

rência em particular a compostos da Fórmula (I) contendo a configuração (R) com uma seletividade de 60 até 100%, de preferência de 80 até 100%, em particular de 90 até 100%, muito particularmente preferido de 95 até 100%, onde o composto particular (R) está presente com uma enancioseletividade de, em cada caso, mais do que 50% ee, de preferência de 60 até 100% ee, em particular de 80 até 100% ee, muito particularmente de 90 até 100% ee, mais preferentemente preferido de 95 até 100% ee, baseado no teor total do composto (R) em questão.

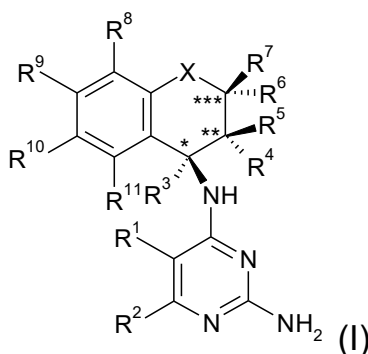
[089] Portanto, a presente invenção se refere em particular a compostos da Fórmula Geral (I) na qual a configuração estereoquímica no átomo de carbono indicado por (*) está presente com uma pureza estereoquímica de 60 até 100% (R), de preferência de 80 até 100% (R), em particular de 90 até 100% (R), muito particularmente de 95 até 100% (R).

[090] Levando-se em consideração a regra segundo Cahn, Ingold e Prelog, com o átomo de carbono indicado por (*), pode-se chegar a uma situação na qual, devido à prioridade dos respectivos substituintes, a configuração (S) é preferida no átomo de carbono indicado por (*). Este é o caso, por exemplo, quando os radicais R^4 e/ou R^5 correspondem a um radical C_1 - C_6 -alcóxi correspondente.

[091] Portanto, no contexto da presente invenção é dada preferência, em particular, a compostos da Fórmula Geral (I) que, em sua disposição espacial, correspondem àqueles compostos da Fórmula Geral (I) onde R^4 e R^5 = hidrogênio com a configuração (R), com uma seletividade de 60 até 100%, de preferência de 80 até 100%, em particular de 90 até 100%, muito particularmente de 95 até 100%, onde o composto análogo a (R) particular está presente com uma enancioseletividade em cada caso de mais do que 50% ee, de preferência de 60 até 100% ee, em particular de 80 até 100% ee, muito particularmente

de 90 até 100% ee, mais preferentemente de 95 até 100% ee, baseado no teor total do composto (R) análogo em questão. Portanto, a presente invenção se refere em particular a compostos da Fórmula Geral (I) na qual a configuração estereoquímica no átomo de carbono indicada por (*) está presente com uma pureza estereoquímica de 60 até 100% (R, ou R análogo), de preferência de 80 até 100% (R, ou R análogo), em particular de 90 até 100% (R, ou R análogo), muito particularmente de 95 até 100% (R, ou R análogo).

[092] Em particular, os compostos de Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção também podem conter ainda outros centros de quiralidade nos átomos de carbono indicados por (**) e (***):



[093] No contexto da presente invenção, quaisquer configurações estereoquímicas desejadas nos átomos de carbono indicados por (*), (**) e (***) são possíveis:

Configuração do átomo de carbono (*)	Configuração do átomo de carbono (**)	Configuração do átomo de carbono (***)
R	R	R
R	R	S
R	S	R
S	R	R
R	S	S
S	R	S
S	S	R
S	S	S

[094] Além disso, dependendo da seleção dos radicais particula-

res, outros estereoelementos podem estar presentes nos compostos de Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção.

[095] Se um ou mais grupos alquenila, por exemplo, está presente, então os diastereômeros (isômeros Z e E) podem ocorrer.

[096] Caso por exemplo um ou mais átomos de carbono assimétricos estão presentes, então podem ocorrer enanciômeros e diastereômeros.

[097] Estereoisômeros correspondentes podem ser obtidos durante a preparação das misturas preparadas por processos de separação usuais, por exemplo, por processos de separação cromatográfica. Estereoisômeros podem, da mesma forma, ser seletivamente preparados pelo uso de reações estereoseletivas usando materiais de partida e/ou auxiliares opticamente ativos. A invenção também se refere a todos os estereoisômeros que são abrangidos pela Fórmula Geral (I), mas cuja estereoforma específica não foi fornecida e suas misturas.

[098] As possibilidades de combinação dos vários substituintes da Fórmula (I) devem ser compreendidas tal que os princípios gerais de construção de compostos químicos sejam observados, isto é, a Fórmula (I) não abrange compostos que o especialista sabe não serem quimicamente possíveis.

[099] Na tabela que se segue são mencionados exemplos específicos de execução dos compostos de Fórmula (I) de acordo com a invenção

Tabela

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.1.	H	Ph	H	R	CH ₃	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.2.	H	2-CH ₃ -Ph	H	R	CH ₃	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.3.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.4.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.5.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	F	H	-
1.6.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-
1.7.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	Br	H	-
1.8.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CN	H	-
1.9.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CCH	H	-
1.10.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	C(=O)NH ₂	H	-
1.11.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	H	-
1.12.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH=CH ₂	H	-
1.13.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CCCH ₃	H	-
1.14.	H	CH ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	CCH	H	-
1.15.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	I	H	-
1.16.	H	CH ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	I	H	-
1.17.	H	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.18.	H	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.19.	OCH ₃	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.20.	OCH ₃	CF ₂ H	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.21.	OCH ₃	CF ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.22.	OCH ₂ CH ₃	CF ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.23.	OCH ₃	CF ₂ H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	Cl	H	-

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.24.	OCH ₃	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.25.	CH ₃	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.26.	CH ₃	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.27.	H	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.28.	H	CClF ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.29.	H	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-
1.30.	H	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.31.	H	CF ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.32.	H	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.33.	H	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.34.	H	CF ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.35.	H	CF ₂ H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.36.	H	CF ₂ H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.37.	I	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.38.	Cl	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.39.	CH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.40.	I	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.41.	OCH ₃	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.42.	H	Cl	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.43.	H	Cl	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.44.	H	Cl	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.45.	OCH ₃	CF ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.1.	H	CF ₃	H	R	CH ₂ C H ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.46.	Cl	CF ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.47.	H	OCH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.48.	H	OCH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.49.	H	OCH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.50.	CN	-Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.51.	CF ₃	CF ₂ -CF ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.52.	CN	Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.53.	CN	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.54.	CN	OCH ₂ CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.55.	CN	OCH ₂ CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.56.	CF ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.57.	CF ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.58.	Cl	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.59.	Cl	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.60.	Br	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.61.	Br	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.62.	H	C(=O)OCH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.63.	CF ₃	CF ₂ -CF ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.64.	NO ₂	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.65.	NO ₂	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.66.	Br	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.67.	Br	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.68.	Br	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-O-
1.69.	CN	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.70.	C≡CH	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.71.	C≡CC H ₃	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.72.	CN	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.73.	C≡CH	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.74.	C≡CC H ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.75.	C≡CH	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.76.	C(=O)CH ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.77.	Br	CH ₂ CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.78.	Br	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.79.	Br	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.80.	CN	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.81.	CN	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.82.	CCH	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.83.	C(=O)CH ₃	CF ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.84.	C(=O)CH ₃	CF ₂ H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.85.	CN	CFH ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.86.	Br	CFH ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.87.	Br	CF ₂ H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.88.	Br	CF ₂ H	H	R	H	H		H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-
1.89.	CN	CF ₂ H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.90.	C≡CH	CF ₂ H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.91.	C≡CC H ₃	CF ₂ H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.92.	C≡CH	CF ₂ H	H	R	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.93.	Br	CF ₂ H	H	R	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.94.	H	CN	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.95.	H	C(=O)NH ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.96.	H	C(=O)N(CH ₃) ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.97.	C(=O))NH ₂	Cl	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.98.	C(=O))NH ₂	Br	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.99.	CN	N(CH ₃) ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.100.	CH ₃	N(CH ₃) ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.101.	Cl	N(CH ₃) ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.102.	Cl	N(CH ₂ CH ₃) ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.103.	Cl	N- Morfolina	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.104.	Cl	N(CH ₃) ₂	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.105.	Cl	N(CH ₃) ₂	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.106.	Cl	N(CH ₃) ₂	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.107.	Cl	N(CH ₃) ₂	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-O-
1.108.	Cl	N(CH ₃) ₂	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	CH ₃	-O-
1.109.	Cl	N(CH ₃) ₂	CH ₃	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.110.	Cl	H	CH ₃	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.111.	Cl	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.112.	Br	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.113.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.114.	CN	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.115.	CN	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-O-
1.116.	CN	H	H	rac	H	H		H	H		F	H	CH ₃	H	-O-
1.117.	CN	N(CH ₃) ₂	H	rac	H	H		H	H		F	H	H	H	-O-
1.118.	CH ₃	N(CH ₃) ₂	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.119.	CH ₃	OCH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.120.	CH ₃	OCH ₂ CCH	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.121.	Cl	OCH ₂ CCH	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.122.	Br	OCH ₂ CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.123.	H	CH ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	Cl	H	-
1.124.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	Cl	H	-
1.125.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	F	F	H	-
1.126.	H	CH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	OCH ₃	OCH ₃	H	-
1.127.	H	OCH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	OCH ₃	OCH ₃	H	-
1.128.	H	OCH ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-
1.129.	Cl	CF ₃	H	rac	H	H		CH ₃	H	rac	H	H	H	H	-
1.130.	Cl	CF ₂ H	H	rac	H	H		CH ₃	H	rac	H	H	H	H	-
1.131.	Cl	CH ₃	H	rac	-CH ₂ - CH ₂ -		H	H		H	H	H	H	-	
1.132.	Br	CH ₃	H	rac	-CH ₂ - CH ₂ -		H	H		H	H	H	H	-	

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.133.	CN	CH ₃	H	rac	-CH ₂ - CH ₂ -		H	H		H	H	H	H	-	
1.134.	C≡CH	CH ₃	H	rac	-CH ₂ - CH ₂ -		H	H		H	H	H	H	-	
1.135.	Cl	CH ₃	H	rac	CH ₃	CH ₃		H	H		H	H	H	H	-
1.136.	Br	CH ₃	H	rac	CH ₃	CH ₃		H	H		H	H	H	H	-
1.137.	CN	CH ₃	H	rac	CH ₃	CH ₃		H	H		H	H	H	H	-
1.138.	C≡CC H ₃	CH ₃	H	rac	CH ₃	CH ₃		H	H		H	H	H	H	-
1.139.	C≡CH	CH ₃	H	rac	CH ₃	CH ₃		H	H		H	H	H	H	-
1.140.	C(=O)CH ₃	CH ₃	H	rac	CH ₃	CH 3		H	H		H	H	H	H	-
1.141.	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.142.	OCH ₃	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.143.	OCH ₃	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.144.	OCH ₃	H	H	rac	H	H		CH ₃	H	rac	H	H	CH ₃	H	-O-
1.145.	OCH ₃	H	H	rac	H	H		CH ₃	H	rac	H	H	F	H	-O-
1.146.	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	rac	H	H		CH ₃	H	rac	H	H	F	H	-O-
1.147.	CH ₃	CH ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.148.	CH ₃	OCH ₃	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.149.	CH ₃	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.150.	CH ₃	H	H	rac	CH ₂ C H ₃	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.151.	CH ₃	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-
1.152.	CH ₃	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	CH(CH ₃) ₂	H	-

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.153.	CH ₃	H	H	rac	OCH ₃	H	rac	H	H		H	H	H	H	-
1.154.	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	I	H	-
1.155.	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CN	H	-
1.156.	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CCH	H	-
1.157.	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	C(=O)NH ₂	H	-
1.158.	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	C(=O)OH	H	-
1.159.	CH ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	C(=O)CH ₃	H	-
1.160.	H	2F-Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.161.	H	2F,4CH ₃ - Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.162.	CN	2,4-F-Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.163.	CN	4CH ₃ -Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.164.	CN	4F-Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.165.	Br	4CH ₃ -Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-CH ₂ -
1.166.	C≡CH	4CH ₃ -Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.167.	Br	2CH ₃ -Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.168.	CN	2CH ₃ -Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.169.	C≡CH	2CH ₃ -Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.170.	C(=O))CH ₃	2CH ₃ -Ph	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.171.	H	2CH ₃ -Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.172.	Br	2CH ₃ -Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.173.	CN	2CH ₃ -Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.174.	C≡CH	2CH ₃ -Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.175.	H	2CH ₃ -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.176.	H	2CH ₃ -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-O-
1.177.	H	2CH ₃ -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.178.	H	2CH ₃ -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.179.	H	2CH ₃ -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.180.	H	2CH ₃ -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.181.	C≡CH	2CH ₃ -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.182.	H	2CH ₃ -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.183.	Br	2Cl-Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.184.	CN	2Cl-Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.185.	H	2F-Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.186.	Br	2F-Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	CH ₃	H	-O-
1.187.	Br	2Cl-Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	CH ₃	-O-
1.188.	Br	2OCH ₃ -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.189.	H	2OCH ₃ -Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.190.	Br	2,4-OCH ₃ - Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.191.	H	2N(CH ₃) 2- Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.192.	H	4N(CH ₃) 2- Ph	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.193.	H	2N(CH ₃) 2- Ph	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-O-
1.194.	H	2 CH ₃ -Ph	H	rac	H	H		CH ₃	H	rac	H	H	H	H	-O-
1.195.	H	Ph	H	rac	H	H		CH ₃	H	rac	H	H	CH ₃	H	-O-
1.196.	H	Ph	H	rac	H	H		CH ₃	H	rac	CH ₃	H	CH ₃	H	-O-

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.197.	H	Ph	H	rac	H	H		CH ₃	H	rac	F	H	H	H	-O-
1.198.	H	4F-Ph	H	rac	H	H		CH ₃	H	rac	H	H	CH ₃	H	-O-
1.199.	H	2,4 CH ₃ -Ph	H	rac	H	H		CH ₃	H	rac	H	H	CH ₃	H	-O-
1.200.	H	CH ₂ CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.201.	H	CH(CH ₃) ₂	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.202.	H	CH ₂ CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.203.	H	CH(CH ₃) ₂	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.204.	H	C(CH ₃) ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.205.	CN	NH ₂	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.206.	CN	O CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.207.	H	O-(4-FPh)	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.208.	H	O-(3-Cl, 4-FPh)	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.209.	Cl	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.210.	CF ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.211.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-O-
1.212.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₃	H	-O-
1.213.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	OCH ₃	H	-CH ₂ -
1.214.	CF ₃	H	H	rac	H	H		CH ₃	CH ₃		H	Cl	F	H	-O-
1.215.	CF ₃	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	H	F	H	-
1.216.	CF ₃	H	H	rac	CH ₃	H	rac	H	H		H	Cl	H	H	-
1.217.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	Cl	H	H	-
1.218.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.219.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-
1.220.	H	CF ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-

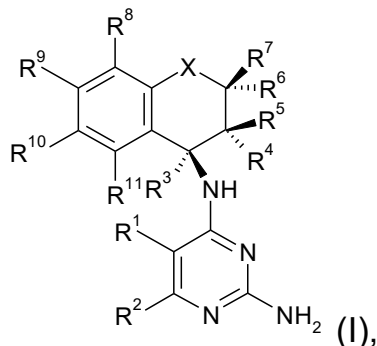
	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.221.	H	CF ₃	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-
1.222.	C(=O) O- ciclo- hexila	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.223.	CF ₃	OCH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.224.	CF ₃	OCH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	- ₂ -
1.225.	CF ₃	H	H	S	OH	H	R	H	H		H	H	H	H	-
1.226.	CF ₃	H	H	S	OH	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.227.	CF ₃	H	H	S	O CH ₃	H	R	H	H		H	H	H	H	-
1.228.	CF ₃	H	H	S	O CH ₃	H	S	H	H		H	H	H	H	-
1.229.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		F	H	H	H	-O-
1.230.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		CH ₃	H	H	H	-O-
1.231.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	OCH ₃	OCH ₃	H	-
1.232.	CF ₃	H	H	rac	H	H		H	H		H	OCH ₂ O	H	-	
1.233.	CF ₂ H	H	H	R	H	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.234.	SCH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.235.	S(=O) CH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.236.	S(=O) ₂ CH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-

	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.237.	C(=O) CH ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.238.	C(=O) CH ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.239.	C≡CH	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.240.	C≡CC (CH ₃) ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.241.	C≡CS i(CH ₃) ₃	H	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.242.	C≡CH	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.243.	C≡CS i(CH ₃) ₃	CH ₃	H	R	CH ₃	H	S	H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.244.	CCSi(CH ₃) ₃	CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.245.	C(=O) CH ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.246.	C≡CH	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.247.	C≡C- C(CH ₃) ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -

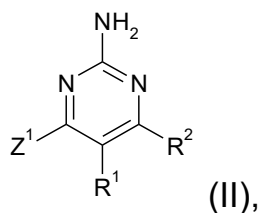
	R ¹	R ²	R ³	Estereo N, R ³	R ⁴	R ⁵	Estereo R ⁴ , R ⁵	R ⁶	R ⁷	Estereo R ⁶ , R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X
1.248.	C≡C- Si(CH ₃) ₃	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.249.	C≡C- Ph	H	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.250.	Cl	C(=O)O CH ₃	H	R	CH ₃	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.251.	Cl	C(=O)O CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.252.	Cl	CN	H	R	CH ₃	H		H	H		H	H	CH ₃	H	-
1.253.	Cl	C(=O)NH ₂	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.254.	Cl	CN	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.255.	CF ₃	OCH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-
1.256.	CF ₃	OCH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH ₂ CH ₃	H	-O-
1.257.	CF ₃	OCH ₂ CH ₃	H	R	H	H		H	H		H	H	H	H	-CH ₂ -
1.258.	CF ₃	OCH ₃	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH(CH ₃) ₂	H	-
1.259.	CF ₃	OCH(CH ₃) ₂	H	rac	H	H		H	H		H	H	CH(CH ₃) ₂	H	-

[0100] Outros objetos da presente invenção são ainda processos para preparação dos compostos correspondentes da Fórmula Geral (I) e/ou seus sais e/ou seus derivados de nitrogênio quaternizados agro-quimicamente compatíveis:

a.) para a preparação de compostos da Fórmula Geral (I)

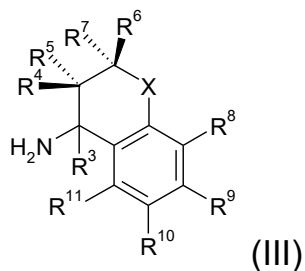


[0101] em que os radicais R^1 até R^{11} e X apresentam os significados acima, pode-se reagir um composto da Fórmula (II)



[0102] em que R^1 e R^2 apresentam o significado acima e Z1 é um radical intercambiável ou um grupo de partida, como em particular clo-ro, triclorometila, (C₁-C₄)-alquilsulfonila, fenil-(C₁-C₄)-alquilsulfonila ou (C₁-C₄)-alquilfenilsulfonila, substituídos ou não substituídos,

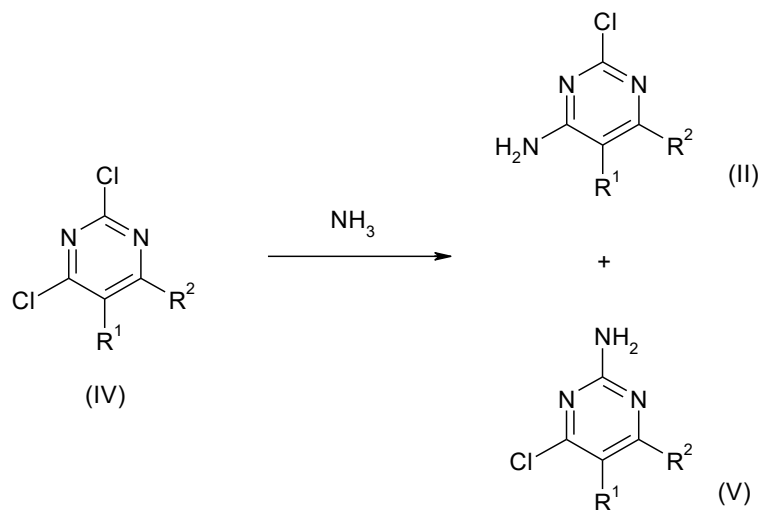
[0103] com uma amina da Fórmula (III) ou um seu sal de adição ácido



[0104] sendo que os radicais R^3 até R^{11} e X apresentam o significado acima.

[0105] Os compostos da Fórmula Geral (II) podem ser obtidos pa-

ra Z = cloro por reação de compostos da Fórmula Geral (IV) com amoníaco de acordo com o seguinte esquema de reação:



[0106] A mistura isomérica de (II) e (V) obtida resultante pode ser separada cromatograficamente ou ser empregada como mistura na reação subsequente.

[0107] As aminas da Fórmula Geral (III) ou os seus sais de adição ácidos são comercialmente disponíveis e sua síntese é descrita na WO 2004/069814 A1.

[0108] As pirimidinas da Fórmula Geral (II) são derivados especiais comercialmente disponíveis e podem ser preparados por processos conhecidos. Por exemplo,

a. as 4-hidroxipirimidinas podem ser preparadas de acordo com a publicação de Perez *et al.*, Synthesis 1983, página 402 a partir das cianoacetamidas e N-cianocarboximidoatos, e essas podem ser subsequentemente convertidas, por exemplo com oxiclureto de fósforo, para formar os compostos de Fórmula (II);

b. 4-hidroxipirimidinas podem ser preparadas a partir dos ésteres acetoacéticos de acordo com o processo publicado por Gershon *et al.*, J. Heterocyclic Chem., 20, 219 (1983) e J. Heterocycl. Chem., 21(4), (1984), 1161, e podem ser convertidas em cloropirimidinas.

b.) Para preparação de compostos da Fórmula Geral (I), compostos podem ser usados como precursores e, conforme descrito abaixo, podem ser convertidos em outros compostos de acordo com a invenção:

i. Por exemplo, derivados da Fórmula Geral (I) com R^1 , R^2 ou R^{10} = halogênio, em particular iodo ou bromo, podem ser reagidos com acetileno ou acetileno protegido por trimetilsilila sob catalisadores de metal de transição, por exemplo, cloreto de bis(trifenilfosfina)paládio(II), em solventes próticos ou apróticos, e a adição de uma base a temperaturas entre 20 e 150°C para originar compostos da Fórmula Geral (I) onde R^1 , R^2 ou R^{10} = alquinila.

ii. Por exemplo, derivados da Fórmula Geral (I) onde R^1 = CN podem ser saponificados sob catálise ácida ou básica; os ácidos carboxílicos obtidos desta forma podem ser convertidos por processos conhecidos para formar cloretos ácidos e, por sua vez, esses podem ser convertidos em amidas.

iii. Por exemplo, derivados da Fórmula Geral (I) onde R^2 = Hal podem ser convertidos, em solventes próticos ou apróticos, e a adição de uma base a temperaturas entre 100 e 250°C, através da reação com alcoolatos ou aminas para originar compostos da Fórmula Geral (I) onde R^2 = alcoxialquila ou aminoalquila ou diaminoalquila.

[0109] Coleções de compostos da Fórmula (I) e/ou seus sais, que podem ser sintetizados segundo as reações mencionadas anteriormente, também podem ser preparados de uma maneira paralela, sendo possível para tanto ocorrer de uma maneira manual, parcialmente automatizada ou completamente automatizada. Assim é possível, por exemplo, automatizar a execução da reação, a elaboração ou a purificação dos produtos e/ou das etapas intermediárias. No todo compreende-se aqui por modo de procedimento, um procedimento conforme descrito, por exemplo por D. Tiebes em Combinatorial Chemistry –

Synthesis, Analysis, Screening (editor Günther Jung), editora Wiley 1999, nas páginas 1 até 34.

[0110] Para o procedimento de reação em paralelo e elaboração é possível usar uma série de instrumentos comercialmente disponíveis, por exemplo, blocos de reação Calpyso da Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, EUA ou estágios de reação de Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, Inglaterra ou MultiPROBE Automated Workstations da Perkin Elmer, Waltham, Massachusetts 02451, EUA. Para a purificação paralela de compostos da Fórmula Geral (I) e seus sais, ou de produtos intermediários produzidos durante a preparação, estão disponíveis, entre outros, equipamentos de cromatografia, por exemplo, da ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EUA.

[0111] Os equipamentos indicados levam a um procedimento modular, no qual as etapas individuais de processo são automatizadas, entretanto, entre as etapas de trabalho, devem ser realizadas operações manuais. Isto pode ser contornado pelo uso de sistemas de automação parcialmente ou totalmente integrados, em que os respectivos módulos de automação, por exemplo, são operados por robôs. Este tipo de sistemas de automação pode ser adquirido, por exemplo, na Caliper, Hopkinton, MA 01748, EUA.

[0112] A realização de uma ou mais etapas de síntese pode ser suportada pelo uso de reagentes de suporte de polímero/resinas sequestrante. Na literatura técnica uma série de protocolos de teste são descritos, por exemplo, na ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich).

[0113] Além dos métodos aqui descritos, a preparação de compostos da Fórmula Geral (I) e seus sais podem ocorrer totalmente ou parcialmente por processos suportados por fases sólidas. Para este pro-

pósito, etapas intermediárias individuais ou todas as etapas intermediárias da síntese ou uma síntese adaptada ao modo de procedimento correspondente estão ligados a uma resina de síntese. Processos de síntese suportada por fase sólida são suficientemente descritos na literatura especializada, por exemplo, Barry A. Bunin em "The Combinatorial Index", editora Academic Press, 1998 e Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (editor Günther Jung), editora Wiley, 1999. O uso de processos de síntese suportados por fase sólida permite uma série de protocolos conhecidos na literatura, que por sua vez podem ser realizados manualmente ou de uma maneira automatizada. As reações podem, por exemplo, ser realizadas por meio de tecnologia IRORI em microrreatores da Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, EUA.

[0114] Tanto na fase sólida como também na fase líquida, a realização de uma ou mais etapas de síntese pode ser suportada pelo uso da tecnologia de micro-ondas. Na literatura especializada são descritos uma série de protocolos de teste, por exemplo, em Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (editor C. O. Kappe e A. Stadler), editora Wiley, 2005.

[0115] A preparação de acordo com o processo descrito aqui produz compostos da Fórmula (I) e seus sais na forma de coleções de substância que são denominadas bibliotecas. A presente invenção também fornece bibliotecas que compreendem pelo menos dois compostos da Fórmula (I) e seus sais.

[0116] Devido à propriedade herbicida dos compostos da Fórmula Geral (I), outro objeto da invenção é também o uso dos compostos de acordo com a invenção da Fórmula Geral (I) como herbicidas para o controle de plantas daninhas.

[0117] Herbicidas são utilizados em culturas utilizadas agricolamente durante diversas fases de cultivo. Assim a aplicação de alguns

produtos ocorre imediatamente antes ou durante a semeadura. Outros são aplicados antes que a planta emerja, isto é, antes do rompimento das sementes através da superfície da terra (herbicidas de pré-emergência). Herbicidas de pós-emergência finalmente, são empregados, quando já estão formadas as folhas germinadas das sementes ou a folhagem das plantas de cultura.

[0118] Os compostos de acordo com a invenção podem ser empregados aqui tanto na pré-emergência como também na pós-emergência, sendo que é preferido um uso dos compostos de acordo com a invenção na pré-emergência.

[0119] O tratamento de pré-emergência finalmente inclui tanto o tratamento da área sob cultivo antes da semeadura (ppi = aplicação pré-planta), como também o tratamento das áreas cultivadas, mas ainda não crescidas.

[0120] Os compostos de Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção e seus sais, referidos a seguir também como sinônimos, juntos como compostos da Fórmula (I), possuem excelente eficácia herbicida contra um amplo espectro de plantas daninhas monocotiledôneas e dicotiledôneas economicamente importantes. Também são bem abrangidas plantas daninhas perenes dificilmente controláveis, que produzem brotos a partir de rizomas, hastes de raízes ou outros órgãos perenes e que são bem controladas. Aqui não importa se as substâncias são aplicadas no processo de pré-semeadura, métodos de pré-emergência ou de pós-emergência.

[0121] Em detalhes são mencionados alguns substituintes da flora monocotiledônea e dicotiledônea mencionada, que podem ser controlados pelos compostos da Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção, sem que ocorra uma limitação devido à menção a determinadas espécies mencionadas.

[0122] Do lado das espécies de ervas daninhas monocotiledôneas,

são bem controladas, por exemplo: *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Brachicaria*, *Bromus*, *Dactyloctenium*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleocharis*, *Eleusine*, *Festuca*, *Fimbristylis*, *Ischaemum*, *Lolium*, *Monochooria*, *Panicum*, *Paspalum*, *Phalaris*, *Phleum*, *Poa*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria*, *Sphenoclea*, e também a espécie *Cyperus* predominantemente do grupo anual e, do lado das espécies perenes *Agropyron*, *Cynodon*, *Imperata*, assim como sorgo, e também as espécies *Cyperus* perenes são bem abrangidas.

[0123] Em espécies de ervas dicotiledôneas, o espectro de ação se estende a espécies tais como, por exemplo, *Galium*, *Viola*, *Veronica*, *Lamium*, *Stellaria*, *Amaranthus*, *Sinapis*, *Ipomoea*, *Matricaria*, *Abutilon* e *Sida* do lado anual, assim como *Convolvulus*, *Cirsium*, *Rumex* e *Artemisia* no caso de ervas daninhas perenes. Além disso, a eficácia herbicida em ervas daninhas dicotiledôneas, tais como *Ambrosia*, *Anthemis*, *Carduus*, *Centaurea*, *Chenopodium*, *Cirsium*, *Convolvulus*, *Datura*, *Emex*, *Galeopsis*, *Galinsoga*, *Lepidium*, *Lindernia*, *Papaver*, *Portulaca*, *Polygonum*, *Ranunculus*, *Rorippa*, *Rotala*, *Seneceio*, *Sesbania*, *Solanum*, *Sonchus*, *Taraxacum*, *Trifolium*, *Urtica* e *Xanthium* é observado.

[0124] Se os compostos de Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção são aplicados na superfície da terra antes da germinação, então as sementes de ervas daninhas ou são totalmente impedidas de emergir ou as ervas daninhas crescem até o estágio de folha da semente, entretanto interrompem o seu crescimento e finalmente morrem completamente após o decurso de três a quatro semanas.

[0125] Com a aplicação da substância ativa da Fórmula Geral (I) nas partes verdes das plantas no processo de pós-emergência, o crescimento é muito drasticamente interrompido após o tratamento e as plantas daninhas permanecem no estágio de crescimento existente no momento da aplicação, ou elas morrem completamente após um

certo tempo, de modo que desta maneira uma competição de ervas daninhas danosas para as plantas de cultura é eliminada muito cedo e de uma maneira duradoura.

[0126] Apesar dos compostos de Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção apresentarem uma excelente atividade herbicida no que se refere a ervas daninhas monocotiledôneas e dicotiledôneas, plantas de cultura de culturas economicamente importantes, tais como, por exemplo, trigo, cevada, centeio, arroz, milho, beterraba, algodão, colza e soja, só são muito pouco danificadas, se de todo o forem. Os compostos presentes são muito bem apropriados, por essas razões, para o controle seletivo do crescimento de plantas indesejadas nas plantações agrícolas de plantas úteis.

[0127] Além disso, as substâncias de acordo com a invenção da Fórmula Geral (I) apresentam excelentes propriedades reguladoras do crescimento em plantas de cultura. Elas intervêm no metabolismo próprio das plantas e podem assim ser empregadas para influenciar objetivamente as substâncias vegetais e para facilitar a safra como, por exemplo, iniciando a dissecação e crescimento atrofiado. Além disso, elas também são apropriadas para controle geral e inibição do crescimento vegetativo indesejado, sem matar as plantas. Uma inibição do crescimento vegetativo desempenha um grande papel em muitas culturas monocotiledôneas e dicotiledôneas, já que o armazenamento pode assim ser reduzido ou totalmente impedido.

[0128] Devido às suas propriedades herbicidas e reguladoras do crescimento das plantas, os ingredientes ativos também podem ser usados para o controle de plantas daninhas em culturas de plantas conhecidas ou que ainda serão modificadas geneticamente. As plantas transgênicas distinguem-se em regra por propriedades particularmente vantajosas, por exemplo, por resistências perante determinados pesticidas, sobretudo determinados herbicidas, resistências perante doen-

ças de plantas ou patógenos de plantas, tais como insetos ou micro-organismos tais como fungos, bactérias ou vírus. Outras propriedades particulares referem-se, por exemplo, ao bem de safra tendo em vista a quantidade, qualidade, armazenabilidade, composição e conteúdo específico. Por exemplo, são conhecidas plantas transgênicas com elevado teor de amido, ou qualidade de amido modificada, ou aquelas com outra composição de ácido graxo do bem de safra. Outras propriedades particulares podem estar em uma tolerância ou resistência a fatores de tensão abióticos, por exemplo, calor, frio, seca, sal e radiação ultravioleta.

[0129] É dada preferência ao uso dos compostos de Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção ou seus sais em safras transgênicas economicamente importantes de plantas úteis e plantas ornamentais, por exemplo, cereais, tais como, trigo, cevada, centeio, aveias, painço, arroz, mandioca e milho, ou outras safras de beterraba, algodão, soja, colza, batatas, tomates, ervilhas e outras variedades de vegetais.

[0130] De preferência os compostos da Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção são empregados como herbicidas em culturas de plantas úteis, que são resistentes aos efeitos fitotóxicos dos herbicidas ou tornados geneticamente resistentes.

[0131] Maneiras convencionais de produção de novas plantas que apresentam, em comparação às plantas até agora existentes, propriedades modificadas, comparadas às plantas existentes consistem, por exemplo, em métodos de cultivo clássicos e a geração de mutantes. Alternativamente, novas plantas com propriedades modificadas podem ser preparadas por processos de engenharia genética (vide, por exemplo EP 0221044, EP0131624). Foram descritos, por exemplo, em muitos casos, o seguinte:

a) Modificações genéticas de plantas de safra para os propósitos de modificação do amido sintetizado nas plantas (por exemplo,

WO 92/011376, WO 92/014827, WO 91/019806),

b) plantas de cultura transgênicas, que são resistentes a certos herbicidas do tipo glufosinato (vide, por exemplo, EP 0242236, EP 0242246) ou do tipo glifosato (WO 92/000377) ou do tipo sulfonilureia (EP 0257993, US 5013659),

c) plantas de cultura transgênicas, por exemplo, algodão, com a capacidade de produzir a toxina do *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que torna as plantas resistentes a certas pestes (EP 0142924, EP 0193259),

d) plantas de cultura transgênicas com uma composição de ácido graxo modificada (WO 91/013972),

e) plantas de cultura geneticamente modificadas com novos ingredientes ou substâncias secundárias, por exemplo, novas fitoalexinas, que causam uma elevada resistência a doenças (EP 0309862, EP 0464461),

f) plantas geneticamente modificadas com fotorrespiração reduzida que possuem altos rendimentos e alta tolerância a stress (EP 0305398),

g) plantas de cultura transgênicas que produzem proteínas farmacêuticamente ou diagnosticamente importantes ("molecular pharming"),

h) plantas de cultura transgênicas distinguidas por um alto rendimento ou melhor qualidade,

i) plantas de cultura transgênicas distinguidas por uma combinação, por exemplo, das novas propriedades acima mencionadas ("gene stacking").

[0132] Numerosas técnicas de biologia molecular, com as quais novas plantas transgênicas com propriedades modificadas podem ser preparadas, são a princípio conhecidas; vide, por exemplo, I. Potrykus e G. Spangenberg (eds.) *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manu-

al (1995), editora Springer Berlim, Heidelberg ou Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431.

[0133] Para este tipo de manipulações genéticas, moléculas de ácido nucleico, que permitem uma mutagênese ou sequência de modificação por recombinação de sequências de DNA, podem ser introduzidas em plasmídeos. Por exemplo, com o auxílio de processos-padrão, por exemplo, pode-se realizar mudanças de base para remover sequências parciais ou para adicionar sequências naturais ou sintéticas. Para a ligação dos fragmentos de DNA entre si podem ser adicionados aos fragmentos, adaptadores ou aglutinantes, vide, por exemplo, Sambrook *et al.*, 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2ª edição, Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; ou Winnacker "Genes e Clones [Genes and Clones]", VCH Weinheim 2ª edição 1996.

[0134] A preparação de células vegetais com uma atividade reduzida de um produto genético pode, por exemplo, ser obtida, através da expressão de pelo menos um RNA antissenso correspondente, e um RNA no sentido para atingir um efeito de cossupressão ou a expressão de pelo menos uma ribozima correspondentemente construída, que especificamente cliva o produto genético acima mencionado.

[0135] Para este fim por um lado é possível usar primeiramente moléculas de DNA que abrangem toda a sequência de codificação de um produto genético incluindo quaisquer sequências flanqueadoras que possam estar presentes, e também moléculas de DNA que abrangem somente partes da sequência de codificação, sendo necessário que essas partes sejam longas o bastante para trazer um efeito antissenso nas células. Também é possível o uso das sequências de DNA que apresentam um alto grau de homologia com as sequências de um produto genético, mas não são inteiramente idênticas a elas. Durante a expressão de moléculas de ácido nucleico em plantas, a proteína

sintetizada pode estar localizada em qualquer compartimento da célula da planta. Entretanto, para obter a localização em um certo compartimento, é possível, por exemplo, ligar a região codificadora com sequências de DNA que asseguram a localização em um certo compartimento. Sequências deste tipo são conhecidas dos especialistas na técnica (vide, por exemplo, Braun *et al.*, EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter *et al.*, Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald *et al.*, Plant J. 1 (1991), 95-106). A expressão das moléculas de ácido nucleico também pode ocorrer nas organelas das células das plantas.

[0136] As células vegetais transgênicas podem ser regeneradas por técnicas conhecidas para produzir plantas completas. A princípio, as plantas transgênicas podem ser plantas de quaisquer espécies desejadas, isto é, tanto plantas monocotiledôneas como também dicotiledôneas.

[0137] Assim são obteníveis plantas transgênicas que apresentam propriedades modificadas por superexpressão, supressão ou inibição de gens homólogos (= naturais) ou sequências genéticas ou expressão heteróloga (= estranha) ou sequências genéticas.

[0138] Os compostos da Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção podem ser empregados de preferência em culturas transgênicas, que são resistentes a reguladores do crescimento, tais como, por exemplo, dicamba, ou a herbicidas que inibem enzimas essenciais de plantas, por exemplo, sintases de acetolactato (ALS), sintases de EPSP, sintases de glutamina (GS) ou dioxigenases de hidroxifenilpiruvato (HPPD), ou a herbicidas do grupo das sulfonilureias, glifosatos, glufosinatos ou benzoilsoxazolas e ingredientes ativos análogos.

[0139] No uso dos ingredientes ativos da Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção em culturas transgênicas, além dos efeitos observados em outras culturas contra plantas daninhas, ocorrem fre-

quentemente efeitos que são específicos para a aplicação nas respectivas culturas transgênicas, por exemplo, um espectro de ervas daninhas ampliado especial que pode ser controlado, quantidades de aplicação modificadas que podem ser empregadas para a aplicação, de preferência boa combinabilidade com os herbicidas, perante aos quais a cultura transgênica é resistente, assim como a influência do crescimento e produção das plantas de cultura transgênicas.

[0140] Objeto da invenção, portanto, é também o uso dos compostos de acordo com a invenção da Fórmula Geral (I) como herbicidas para o controle de plantas daninhas em plantas de cultura transgênicas.

[0141] Os compostos de Fórmula Geral (I) podem ser formulados de diferentes maneiras, dependendo de quais parâmetros biológicos e/ou químico-físicos são prescritos. Como possibilidades de formulação interessam, por exemplo: pós de borriço (WP), pós solúveis em água (SP), concentrados solúveis em água, concentrados emulsificantes (EC), emulsões (EW), tais como emulsões óleo-em-água e água-em-óleo, soluções borrifáveis, concentrados em suspensão (SC), dispersões à base de óleo ou água, soluções miscíveis em óleo, suspensões em cápsulas (CS), agentes de empoeiramento (DP), infusões para sementes, grânulos para polvilhamento e aplicação no solo, grânulos (GR) na forma de microgrânulos, grânulos em spray, grânulos revestidos e grânulos de adsorção, grânulos dispergíveis em água (WG), grânulos solúveis em água (SG), formulações ULV, microcápsulas e ceras.

[0142] Esses tipos de formulação individuais são conhecidos a princípio e são descritos, por exemplo, em: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie [Tecnologia Química]", volume 7, editora C. Hanser Munique, 4ª edição 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Hand-

book, 3^a ed. 1979, G. Goodwin Ltd. Londres.

[0143] Os coadjuvantes de formulação necessárias, tais como, materiais inertes, agentes tensoativos, solventes e outros aditivos, são igualmente conhecidos e são descritos, por exemplo, em: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2^a ed., Darland Books, Caldwell N.J.; H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2^a ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide", 2^a ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte [Adutos de óxido de etileno tenso ativos]", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie [Tecnologia Química]", volume 7, editora C. Hanser Munique, 4^a edição, 1986.

[0144] Com base nessas formulações, também podem ser preparadas combinações com outras substâncias pesticidas eficazes como, por exemplo, inseticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, assim como fitoprotetores, fertilizantes e/ou outros reguladores do crescimento, também podem ser preparadas, por exemplo, na forma de uma formulação pronta ou como mistura tanque.

[0145] Pós de pulverização são preparados homogeneamente dispersíveis em água, que além da substância ativa, além de um diluente ou da substância inerte, ainda contêm agentes tensoativos iônicos e/ou do tipo não iônico (reticulantes, dispersantes), por exemplo, alquilfenóis polioxietilados, alcoóis graxos polioxietilados, aminas graxas polioxietiladas, poliglicoléter sulfatos de álcool graxo, alcanossulfonatos, alquilbenzenossulfonatos, ligninossulfonato de sódio, 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-dissulfonato de sódio, dibutilnaftalenossulfonato de sódio e também oleoilmetilaurato de sódio. Para preparar os pós de borifo, os ingredientes ativos herbicidas são finamente triturados, por

exemplo, em um aparelho usual, tal como moinhos de martelo, moinhos de sopro, e moinhos de jato de ar, e são misturados simultaneamente ou subsequentemente com os coadjuvantes de formulação.

[0146] Concentrados emulsificáveis são preparados por dissolução do ingrediente ativo em um solvente orgânico, por exemplo, butanol, ciclo-hexanona, dimetilformamida, xileno ou ainda aromáticos de ponto de ebulição mais elevado, ou hidrocarbonetos ou misturas dos solventes orgânicos com a adição de um ou mais agentes tensoativos de um tipo iônico e/ou não iônico (emulsificantes). Emulsificantes que podem ser empregados são, por exemplo: sais de cálcio alquilarilssulfônicos, tais como dodecilbenzenossulfonato de Ca, ou emulsificantes não iônicos, tais como poliglicol ésteres de ácido graxo, alquilarilpoliglicol éteres, poliglicol éteres de álcool graxo, produtos da condensação de óxido de propileno-óxido de etileno, alquil poliéteres, ésteres de sorbitano, tais como ésteres de ácido sorbitano graxo, ou ésteres de polioxietileno sorbitano, tais como, por exemplo, ésteres de ácido polioxietileno sorbitano graxo.

[0147] Composições em pó são obtidas por trituração dos ingredientes ativos com substâncias sólidas finamente divididas, por exemplo, talco, argilas naturais, tais como caulim, bentonita ou pirofillita, ou terras diatomáceas.

[0148] Concentrados em suspensão podem ser à base de água ou à base de óleo. Eles podem ser preparados, por exemplo, por moagem úmida por meio de moinhos de pérola comercialmente disponíveis e se apropriado adição de agentes tensoativos, como eles já foram indicados acima, por exemplo, nos outros tipos de formulação.

[0149] Emulsões, por exemplo, emulsões óleo-em-água (EW), podem ser preparadas, por exemplo, por meio de agitadores, moinhos coloides e/ou misturadores estáticos com uso de solventes orgânicos aquosos e se apropriado agentes tensoativos, como eles já foram

mencionados acima, por exemplo, nos outros tipos de formulação.

[0150] Grânulos podem ser preparados por atomização do ingrediente ativo em material inerte granulado que é capaz de adsorção ou por aplicação de concentrados de ingrediente ativo por meio de adesivos, por exemplo, álcool polivinílico, poliacrilato de sódio ou outros óleos minerais, na superfície de substâncias carreadoras, tais como, areia, caulinita ou material inerte granulado. Ingredientes ativos granulados também podem ser granulados da maneira usual para preparação de grânulos de fertilizante – se desejado em uma mistura com fertilizantes.

[0151] Grânulos dispersíveis em água são normalmente preparados por processos usuais, tais como secagem por borrifio, granulação de leite fluidizado, granulação Teller, misturação com misturadores de alta velocidade e extrusão sem material inerte sólido.

[0152] Para a preparação de grânulos Teller, grânulos de leite fluidizado, grânulos de extrusores e grânulos em spray, vide, por exemplo, processos em "Spray-Drying Handbook" 3ª ed. 1979, G. Goodwin Ltd., Londres; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, páginas 147 em diante; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5ª ed., McGraw-Hill, New York 1973, págs. 8-57.

[0153] Para maiores detalhes quanto à formulação de composições de proteção de plantas vide, por exemplo, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., Nova Iorque, 1961, páginas 81-96 e J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5ª ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

[0154] Os preparados agroquímicos compreendem em regra de 0,1 até 99 % em peso, em particular de 0,1 até 95% em peso de ingrediente ativo da Fórmula (I).

[0155] Em pós de pulverização, a concentração de ingrediente ativo é, por exemplo, de cerca de 10 até 90 % em peso, o remanescente

de até 100% em peso consiste em constituintes de formulação usuais. Nos concentrados emulsificáveis, a concentração do ingrediente ativo pode ser de cerca de 1 até 90, de preferência de 5 até 80% em peso. Formulações em peso compreendem de 1 até 30 % em peso de composto ativo. Formulações em pó compreendem de 1 até 30% em peso de ingrediente ativo, de preferência na maioria dos casos 5 até 20% em peso do ingrediente ativo, soluções borrifáveis compreendem cerca de 0,05 até 80, de preferência 2 até 50% em peso do ingrediente ativo. No caso de grânulos dispersíveis em água, o teor de ingrediente ativo depende parcialmente de se o composto ativo está presente na forma líquida ou na forma sólida e que coadjuvantes de granulação, preenchedores etc. são empregados. No caso de grânulos dispersíveis em água, o teor de ingrediente ativo está, por exemplo, entre 1 e 95% em peso, de preferência entre 10 e 80% em peso.

[0156] Além disso, as formulações de ingrediente ativo mencionadas compreendem, opcionalmente, os adesivos, agentes de umectação, dispersantes, emulsificantes, agentes de penetração, conservantes, anticongelantes e solventes, preenchedores, carreadores e corantes, antiespumantes, inibidores de evaporação e agentes que influenciam o pH e a viscosidade que são usuais em cada caso.

[0157] Os compostos de Fórmula (I) ou seus sais podem ser empregados como tal ou combinados na forma de suas preparações (formulações) com outras substâncias pesticidamente ativas, tais como, por exemplo, inseticidas, acaricidas, nematocidas, herbicidas, fungicidas, fitoprotetores, fertilizantes e/ou reguladores do crescimento.

[0158] Como parceiros de combinação para os compostos de acordo com a invenção em formulações de mistura, ou na mistura tanque, são empregáveis, por exemplo, ingredientes ativos conhecidos, os quais se baseiam em uma inibição de, por exemplo, acetolactato sintase, acetil-coenzima-A-carboxilase, celulose sintase, enolpiru-

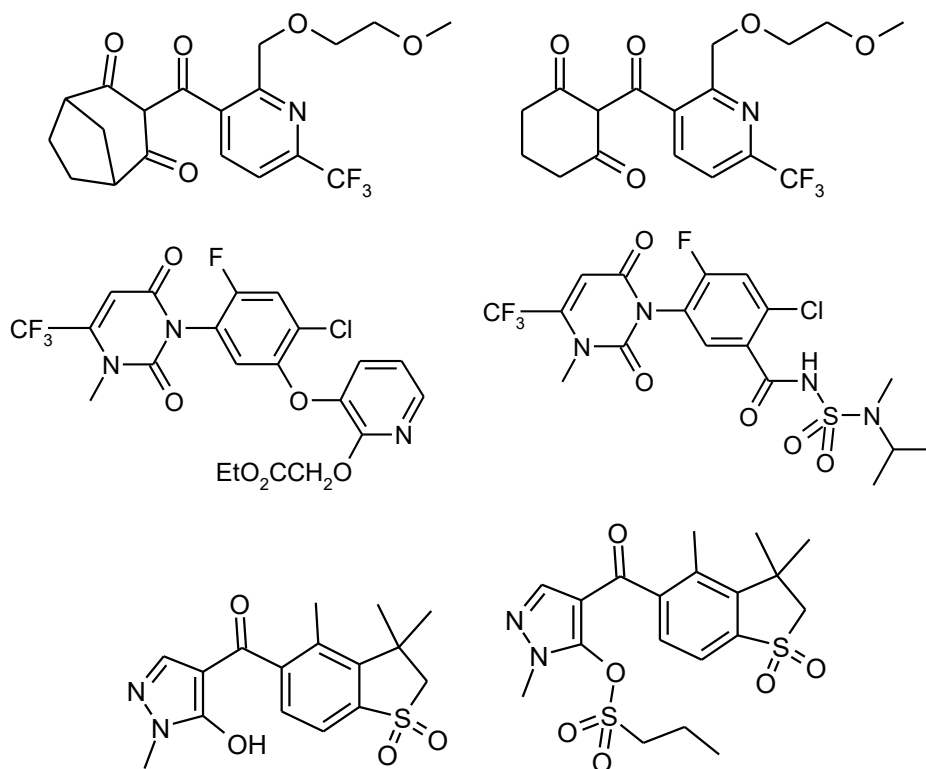
vilshiquimato-3-fosfato sintase, glutamina sintetase, p-hidroxifenilpiruvato dioxigenase, fitoeno desaturase, fotossistema I, fotossistema II, protoporfirinogênio oxidase, conforme descrito, por exemplo, em Weed Research 26 (1986) 441-445 ou "The Pesticide Manual", 13ª edição, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2003 e na literatura lá citada. Com herbicidas ou reguladores do crescimento de plantas conhecidos, que podem ser combinados com os compostos de acordo com a invenção podem ser mencionados os seguintes compostos ativos (os compostos podem ser designados ou por seu "common name" de acordo com a International Organization for Standardization (ISO) ou pelo seu nome químico ou pelo seu número de código) e abrangem sempre todas as formas de uso, tais como ácidos, sais, ésteres e isômeros tais como estereoisômeros e isômeros óticos. Aqui por exemplo podem ser mencionados uma ou algumas vezes também diversas formas de uso:

[0159] acetocloro, acibenzolar, S-metil acibenzolar, acifluorfen, sódio acifluorfen, aclonifen, alacloro, alidocloro, aloxidima, sódio aloxidima, ametrina, amicarbazona, amidoacloro, amidosulfurona, aminopiridina, amitrola, sulfamato de amônio, ancimidol, anilofos, asulam, atrazina, azafenidina, azimsulfurona, aziprotrina, BAH-043, BAS-140H, BAS-693H, BAS-714H, BAS-762H, BAS-776H, BAS-800H, beflubutamida, benazolina, etil benazolina, bencarbazona, benfluralina, benfuresato, bensulida, metilbensulfurona, bentazona, benzofendizona, ben-zobicyclo n, benzofenap, benzoflúor, benzoilprop, bifenox, bilanafos, sódio bilanafos, bispiribac, sódio bispiribac, bromacil, bromobutide, bromofenoxim, bromoxinil, bromurona, buminafos, busoxinona, butacloro, butafenacil, butamifos, butenaclor, butralina, butroxidima, butilato, cafenstrola, carbetamida, carfentrazone, etil carfentrazonal, clo-metoxifeno, clorambeno, clorazifop, butil clorazifop, clorobromurona, clorbufam, clorfenac, sódio clorfenac, clorfenprop, clorflurenol, metil

clorflurenol, cloridazona, clorimurona, etil clorimurona, cloreto de clor-
mequat, cloronitrofenol, cloroftalim, dimetil clortal, clorotolurona, cloros-
sulfurona, cinidona, etil cinidonol, cinmetilina, cinossulfurona, cletodim,
clodinafop, clodinafop-propargil, clofencet, clomazona, clomeprop, clo-
prop, clopiralid, cloransulam, metil cloransulam, cumilurona, cianami-
da, cianazina, ciclanilida, cicloato, ciclo sulfamurona, ciclooxidima, ciclu-
rona, ci-halofof, butil ci-halofof, ciperquat, ciprazina, ciprazola, 2,4-D,
2,4-DB, daimurona/dimrona, dalapon, daminozida, dazomet, n-
decanol, desmedifam, desmetrina, detosil-pirazolato (DTP), dialato,
dicamba, diclobenil, dicloroprop, P dicloroprop, diclofop, metil diclofop,
P-metil diclofop, diclosulam, dietatil, etil dietatil, difenoxurona, difen-
zoquat, diflufenican, diflufenzopir, sódio diflufenzopir, dimefurona, só-
dio dikegulac, dimefurona, dimepiperato, dimetacloro, dimetametrina,
dimetenamida, P-dimetenamida, dimetipina, dimetrassulfurona, dini-
tramina, dinoseb, dinoterb, difenamida, dipropetrina, diquat, dibrometo
de diquat, ditiopir, diurona, DNOC, etil eglinazina, endotal, EPTC, es-
procarb, etalfluralina, metil etametsulfurona, etefona, etidimurona, etio-
zina, etofumesato, etóxifeno, etil etóxifeno, etoxisulfurona, etobenzani-
da, F-5331, isto é N-[2-cloro-4-fluor-5-[4-(3-fluorpropil)-4,5-di-hidro-5-
oxo-1H-tetrazol-1-il]fenil]etanosulfonamida, fenoprop, fenoxaprop, P-
fenoxaprop, etil fenoxaprop, P-etil fenoxaprop, fentrazamida, fenurona,
flamprop, M-isopropil flamprop, M-metil flamprop, flazassulfurona, flo-
rasulam, fluazifop, P fluazifop, butil fluazifop, P-butil fluazifop, fluazola-
to, flucarbazona, sódio flucarbazona, flucetossulfurona, flucloralina,
flufenacet (tiafluamida), flufenpir, etil flufenpir, flumetralina, flumetsu-
lam, flumiclorac, pentil flumiclorac, flumioxazina, flumipropina, fluome-
turon, fluordifen, fluorglicofen, etil fluorglicofen, flupoxam, flupropacil,
flupropanato, flupirsulfuron, metil-sódio flupirsulfurona, flurenol, butil
flurenol, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, meptil fluroxipir, flurprimidol,
flurtamona, flutiacet, metil flutiacet, flutiamida, fomesafen, foramsulfu-

rona, forclorfenurona, fosamina, furiloxifen, ácido giberelico, glufosinato, L-glufosinato, L-amônio glufosinato, amônio glufosinato, glifosato, isopropilamônio glifosato, H-9201, halosafeno, halossulfurona, metil halossulfurona, haloxifop, P-haloxifop, etóxietil haloxifop, P-etóxietil haloxifop, metil haloxifop, P-metil haloxifop, hexazinona, HNPC-9908, HOK-201, HW-02, imazametabenz, metil imazametabenz, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquina, imazetapir, imazossulfurona, inabenfide, indanofan, ácido indola acético (IAA), ácido 4-indol-3-ilbutírico (IBA), iodossulfurona, metil-sódio iodossulfurona, ioxinil, isocarbamida, isopropalina, isoproturona, isourona, isoxabeno, isoxaclortola, isoxaflutola, isoxapirifop, IDH-100, KUH-043, KUH-071, etil e sódio carbutilato, mecoprop, sódio mecoprop, butotil mecoprop, P-butotil mecoprop, P-dimetilamônio mecoprop, P-2-etil-hexil mecoprop, P-potássio mecoprop, mefenacet, mefluidide, cloreto de mepiquat, mesossulfurona, metil mesossulfurona, mesotriona, metabenzotiazurona, metam, metamifop, metamitron, metazaclor, metazola, metoxifenona, metildimrona, 1-metilciclo propeno, metil isotiocianato, metobenzurona, metobromurona, metolaclor, S-metolaclor, metosulam, metoxurona, metribuzina, metsulfurona, metil metsulfurona, molinato, monalida, monocarbamida, di-hidrogenossulfato de monocarbamida, cetospiradox, lactofeno, lenacil, linurona, hidrazida maleica, MCPA, MCPB, metil MCPB, monolinurona, monossulfurona, monurona, MT 128, MT-5950, isto é N-[3-cloro-4-(1-metiletil)fenil]-2-metilpentanamida, NGGC-011, naproanilida, napropamida, naptalam, NC-310, i.e. 4-(2,4-diclorobenzoil)-1-metil-5-benziloxipirazola, neburona, nicossulfurona, nipiraclofeno, nitralina, nitrofeno, sódio nitrofenolato (mistura de isômeros), nitrofluorfeno, ácido nonanoico, norflurazona, orbencarb, ortossulfamurona, orizalina, oxadiargil, oxadiazona, oxasulfurona, oxaziclomefona, oxifluorfeno, paclobutrazol, paraquat, dicloreto de paraquat, ácido pelargônico (ácido nonanoico), pendimetalina, pendralina, penoxsulam, pentanocloro,

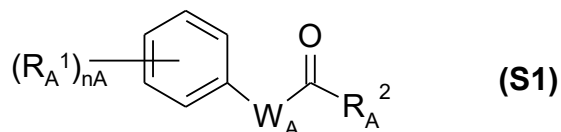
pentoxazona, perfluidona, petoxamida, fenisofam, fenmedifam, etil fenmedifam, picloram, picolinafen, pinoxadeno, piperofos, pirifenop, butil pirifenop, pretilaclor, primissulfurona, metil primissulfurona, probe-nazola, profluazol, prociazina, prodiamina, prifluralina, profoxidima, pro-hexadiona, cálcio pro-hexadiona, pro-hidrojasmona, prometona, prometrina, propacloro, propanil, propaquizafof, propazina, profam, propisocloro, propoxicarbazona, sódio propoxicarbazona, propizamida, prossulfalina, prossulfocarb, prossulfurona, prinaclor, piraclonil, piraflu-feno, etil piraflufeno, pirassulfotola, pirazolinato (pirazolato), etil pira-zossulfurona, pirazoxifeno, piribambenz, isopropil piribambenz, piri-benzoxima, piributicarb, piridafol, piridato, piriftalida, piriminobac, metil piriminobac, pirimissulfano, piritiobac, sódio piritiobac, piroxassulfona, piroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinoclamina, quizalofop, etil quiza-lofop, P-quizalofop, P-etil quizalofop, P-tefuril quizalofop, rimsulfurona, secbumetona, setoxidima, sidurona, simazina, simetrina, SN-106279, sulcotriona, sulfalato (CDEC), sulfentrazona, sulfometurona, metil sul-fometurona, sulfosato (trimésio glifosato), sulfossulfurona, SYN-523, SYP-249, SYP-298, SYP-300, tebutam, tebutiurona, tecnazeno, tefuril-triona, tembotriona, tepraloxidima, terbacil, terbucarb, terbucloro, ter-bumetona, terbutilazina, terbutrina, TH-547, tenilcloro, tiafluamida, tia-zaflurona, tiazopir, tidiazimina, tidiazurona, tienocarbazona, metil tie-nocarbazona, tifensulfurona, metil tifensulfurona, tiobencarb, tiocarpa-zil, topramezona, tralcoxidima, trialato, triassulfurona, triaziflam, triazo-fenamida, tribenurona, metil tribenurona, ácido tricloroacético (TCA), triclopir, tridifano, trietazina, trifloxissulfurona, sódio trifloxissulfurona, trifluralina, triflussulfurona, metil triflussulfurona, trimeturona, trinexa-pac, etil trinexapac, tritossulfurona, tsitodef, uniconazola, P-uniconazola, vernolato, ZJ-0166, ZJ-0270, ZJ-0543, ZJ-0862 e os se-guintes compostos



[0160] O controle seletivo de plantas daninhas em culturas de plantas úteis e ornamentais é de particular interesse. Apesar dos compostos de Fórmula Geral (I) de acordo com a invenção apresentarem uma seletividade muito boa até adequada em algumas culturas, em princípio é possível e, sobretudo, também no caso de misturas com outros herbicidas que são menos seletivos, ocorrer fitotoxicidades nas plantas de cultura. Neste contexto, combinações de compostos da Fórmula (I) de acordo com a invenção são de particular interesse que compreendem os compostos de Fórmula (I) ou suas combinações com outros herbicidas ou pesticidas e fitoprotetores. Os fitoprotetores que são usados em um teor antidoticamente eficaz reduzem os efeitos colaterais fitotóxicos dos herbicidas/pesticidas usados, por exemplo, em culturas economicamente importantes, tais com cereais (trigo, cevada, centeio, milho, arroz, painço), beterraba, cana de açúcar, colza, algodão e soja, de preferência cereais.

[0161] Os fitoprotetores são de preferência selecionados do grupo que consiste em:

S1) compostos de Fórmula (S1),

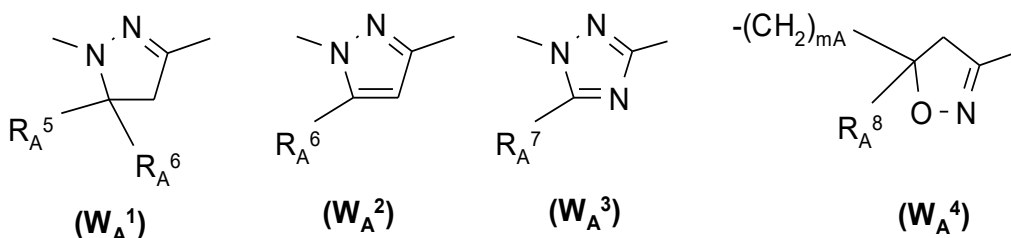


[0162] sendo que os símbolos e índices apresentam os significados seguintes:

[0163] n_A representa um número natural de 0 a 5, de preferência 0 a 3;

[0164] R_A^1 representa halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcóxi, nitro ou (C₁-C₄)-haloalquila;

[0165] W_A representa um radical divalente heterocíclico não substituído ou substituído do grupo dos heterociclos de cinco membros parcialmente insaturados ou aromáticos contendo de 1 a 3 heteroátomos no anel do grupo que consiste em N e O, onde pelo menos um átomo de N e no máximo um átomo de O está presente no anel, de preferência um radical do grupo (W_A^1) a (W_A^4),



[0166] m_A representa 0 ou 1;

[0167] R_A^2 representa OR_A^3 , SR_A^3 ou $NR_A^3R_A^4$ ou um heterociclo de 3 a 7 membros saturado ou insaturado com pelo menos um átomo de N e até 3 heteroátomos, de preferência do grupo que consiste em O e S, que está ligado ao grupo carbonila em (S1) através do átomo de N e é não substituído ou substituído por radicais do grupo que consiste em (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcóxi ou fenila opcionalmente substituída, de preferência um radical de Fórmula OR_A^3 , NHR_A^4 ou $N(CH_3)_2$, em particular de Fórmula OR_A^3 ;

[0168] R_A^3 representa hidrogênio ou um radical hidrocarboneto ali-

fático não substituído ou substituído, de preferência contendo no total 1 a 18 átomos de carbono;

[0169] R_A^4 representa hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alcóxi ou fenila substituída ou não substituída;

[0170] R_A^5 representa H, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₄)-alcóxi-(C₁-C₈)-alquila, ciano ou COOR_A⁹, em que R_A^9 representa hidrogênio, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₄)-alcóxi-(C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₆)-hidroxialquila, (C₃-C₁₂)-cicloalquila ou tri-(C₁-C₄)-alquilsilila;

[0171] R_A^6 , R_A^7 , R_A^8 são, iguais ou diferentes, hidrogênio, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₃-C₁₂)-cicloalquila ou fenila substituída ou não substituída;

[0172] de preferência:

a) compostos de tipo ácido diclorofenilpirazolina-3-carboxílico (S1^a), de preferência compostos tais como ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-(etoxicarbonil)-5-metil-2-pirazolina-3-carboxílico, 1-(2,4-diclorofenil)-5-(etoxicarbonil)-5-metil-2-pirazolina-3-carboxilato de etila (S1-1) ("mefenpir-dietil"), e compostos correlatos, conforme descrito em WO-A-91/07874;

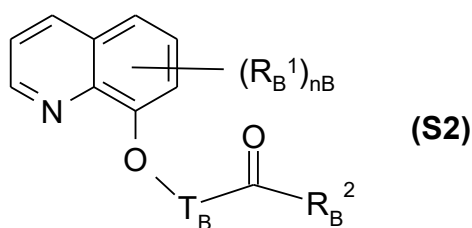
b) derivados de ácido diclorofenilpirazolacarboxílico (S1^b), de preferência compostos tais como 1-(2,4-diclorofenil)-5-metilpirazola-3-carboxilato de etila (S1-2), 1-(2,4-diclorofenil)-5-isopropilpirazola-3-carboxilato de etila (S1-3), 1-(2,4-diclorofenil)-5-(1,1-dimetiletil)pirazola-3-carboxilato de etila (S1-4) e compostos correlatos, conforme descrito em EP-A-333 131 e EP-A-269 806;

c) derivados de ácido 1,5-difenilpirazola-3-carboxílico (S1^c), de preferência compostos tais como 1-(2,4-diclorofenil)-5-fenilpirazola-3-carboxilato de etila (S1-5), 1-(2-clorofenil)-5-fenilpirazola-3-carboxilato de metila (S1-6) e compostos correlatos, conforme descritos, por exemplo, em EP-A-268554;

d) compostos do tipo do ácido triazolacarboxílico (S1^d), de preferência compostos tais como fenclofazola(etila), isto é 1-(2,4-diclorofenil)-5- triclorometil-(1H) -1,2,4-triazola-3-carboxilato de etila (S1-7), e compostos correlatos, conforme descritos em EP-A-174 562 e EP-A-346 620;

e) compostos do tipo do ácido 5-benzil-2-isoxazolina-3-carboxílico ou do ácido 5-fenil-2-isoxazolina-3-carboxílico ou do tipo do ácido 5,5-difenil-2-isoxazolina-3-carboxílico (S1^e), de preferência compostos tais como 5-(2,4-diclorobenzil)-2-isoxazolina-3-carboxilato de etila (S1-8) ou 5-fenil-2-isoxazolina-3-carboxilato de etila (S1-9) e compostos correlatos, conforme descritos na WO-A-91/08202, ou ácido 5,5-difenil-2-isoxazolina-carboxílico (S1-10) ou 5,5-difenil-2-isoxazolina-carboxilato de etila (S1-11) ("etil isoxadifeno") ou 5,5-difenil-2-isoxazolina-carboxilato de n-propila (S1-12) ou do tipo do 5-(4-fluorfenil)-5-fenil-2-isoxazolina-3-carboxilato de etila (S1-13), conforme descrito no pedido de patente WO-A-95/07897.

S2) Derivados de quinolina de Fórmula (S2),



[0173] sendo que os símbolos e índices têm os seguintes significados:

[0174] R_B^1 representa halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcóxi, nitro ou (C₁-C₄)-haloalquila;

[0175] n_B representa um número natural de 0 a 5, de preferência de 0 a 3;

[0176] R_B^2 representa OR_B^3 , SR_B^3 ou $NR_B^3R_B^4$ ou um heterociclo de 3 a 7 membros saturado ou insaturado com pelo menos um átomo de N e até 3 heteroátomos, de preferência do grupo que consiste em

O e S, que está ligado ao grupo carbonila em (S2) através do átomo de N e é não substituído ou substituído por radicais do grupo que consiste em (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcóxi ou fenila opcionalmente substituída, de preferência um radical de Fórmula OR_B³, NHR_B⁴ ou N(CH₃)₂, em particular de Fórmula OR_B³;

[0177] R_B³ representa hidrogênio ou um radical hidrocarboneto alifático não substituído ou substituído, de preferência com no total 1 a 18 átomos de carbono;

[0178] R_B⁴ representa hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alcoxi ou fenila substituída ou não substituída;

[0179] T_B representa uma cadeia (C₁ ou C₂)-alcanodi-ila que é não substituída ou substituída por um ou dois radicais (C₁-C₄)-alquila ou por [(C₁-C₃)-alcóxi] carbonila;

[0180] de preferência:

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

[0181] (5-cloro-8-quinolinóxi) acetato de 1-metil-hexila ("cloquinto-cet-mexil") (S2-1),

[0182] (5-cloro-8-quinolinóxi) acetato de 1,3-dimetilbut-1-ila (S2-2),

[0183] (5-cloro-8-quinolinóxi) acetato de 4-aliloxibutila (S2-3),

[0184] (5-cloro-8-quinolinóxi) acetato de 1-aliloxiprop-2-ila (S2-4),

[0185] (5-cloro-8-quinolinóxi) acetato de etila (S2-5),

[0186] (5-cloro-8-quinolinóxi) acetato de metila (S2-6),

[0187] (5-cloro-8-quinolinóxi) acetato de alila (S2-7),

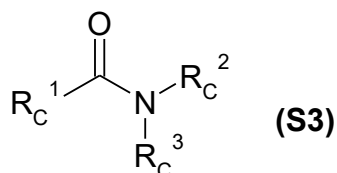
[0188] (5-cloro-8-quinolinóxi) acetato de 2-(2-propilideneiminóxi)-1-etila (S2-8),

[0189] (5-cloro-8-quinolinóxi) acetato de 2-oxoprop-1-ila (S2-9) e compostos correlatos, conforme descrito em EP-A-86 750, EP-A-94 349 e EP-A-191 736 ou EP-A-0 492 366, e também ácido (5-cloro-8-quinolinóxi) acético (S2-10), seus hidratos e sais, por exemplo seus

sais de lítio, sódio, potássio, cálcio, magnésio, alumínio, ferro, amônio, amônio quaternário, sulfônio ou fosfônio, conforme descrito em WO-A-2002/34048;

b) compostos do tipo do ácido (5-cloro-8-quinolinóxi) malônico (S2^b), de preferência compostos tais como (5-cloro-8-quinolinóxi) malonato de dietila, (5-cloro-8-quinolinóxi) malonato de dialila, (5-cloro-8-quinolinóxi)malonato de metil etila e compostos correlatos, conforme descrito em EP-A-0 582 198.

S3) Compostos de Fórmula (S3)



[0190] sendo que os símbolos e índices têm os seguintes significados:

[0191] R_C¹ representa (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₂-C₄)-alquenila, (C₂-C₄)-haloalquenila, (C₃-C₇)-cicloalquila, de preferência diclorometila;

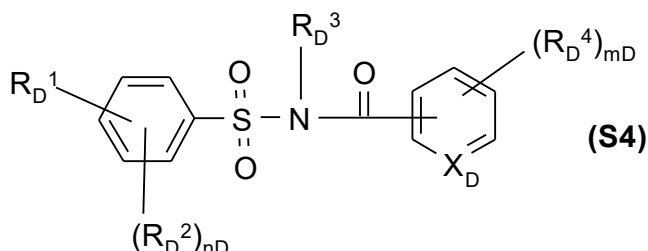
[0192] R_C², R_C³ são, iguais ou diferentes, hidrogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₂-C₄)-alquenila, (C₂-C₄)-alquinila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₂-C₄)-haloalquenila, (C₁-C₄)-alquilcarbamoil-(C₁-C₄)-alquila, (C₂-C₄)-alquenilcarbamoil-(C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcóxi-(C₁-C₄)-alquila, dioxolanil-(C₁-C₄)-alquila, tiazolila, furila, furilalquila, tienila, piperidila, fenila substituída ou não substituída, ou R_C² e R_C³ formam em conjunto um anel heterocíclico substituído ou não substituído, de preferência um anel oxazolidina, tiazolidina, piperidina, morfolina, hexa-hidropirimidina ou benzoxazina;

[0193] de preferência:

[0194] Ingredientes ativos do tipo dicloroacetamida, que são frequentemente empregados como fitoprotetores na pré-emergência (fitoprotetores atuantes sobre o solo), tais como, por exemplo,

- [0195] "diclormid" (N,N-dialil-2,2-dicloroacetamida) (S3-1),
- [0196] "R-29148" (3-dicloroacetil-2,2,5-trimetil-1,3-oxazolidina) de Stauffer (S3-2),
- [0197] "R-28725" (3-dicloroacetil-2,2-dimetil-1,3-oxazolidina) de Stauffer (S3-3),
- [0198] "benoxacor" (4-dicloroacetil-3,4-di-hidro-3-metil-2H-1,4-benzoxazina) (S3-4),
- [0199] "PPG-1292" (N-alil-N-[(1,3-dioxolan-2-il)metil] dicloroacetamida) de PPG Industries (S3-5),
- [0200] "DKA-24" (N-alil-N-[(alilaminocarbonil) metil] dicloroacetamida) de Sagro-Chem (S3-6),
- [0201] "AD-67" ou "MON 4660" (3-dicloroacetil-1-oxa-3-azaspiro[4,5]decano) de Nitroquemia ou Monsanto (S3-7),
- [0202] "TI-35" (1-dicloroacetilazepano) de TRI-Chemical RT (S3-8),
- [0203] "diclonon" (diciclonona) ou "BAS145138" ou "LAB145138" (S3-9) ((RS)-1-dicloroacetil-3,3,8a-trimetilper-hidropirrolo [1,2-a] pirimidin-6-ona) de BASF,
- [0204] "furilazola" ou "MON 13900" ((RS)-3-dicloroacetil-5-(2-furil)-2,2-dimetiloxazolidina) (S3-10); e também seu isômero-(R) (S3-11).

S4) N-acilsulfonamidas de Fórmula (S4) e seus sais,



- [0205] onde os símbolos e índices têm os seguintes significados:
- [0206] X_D representa CH ou N;
- [0207] R_D^1 representa $CO-NR_D^5R_D^6$ ou $NHCO-R_D^7$;
- [0208] R_D^2 representa halogênio, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -haloalcóxi, nitro, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi, (C_1-C_4) -alquilsulfonila,

(C₁-C₄)-alcoxicarbonila ou (C₁-C₄)-alquilcarbonila;

[0209] R_D³ representa hidrogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₂-C₄)-alquenila ou (C₂-C₄)-alquinila;

[0210] R_D⁴ representa halogênio, nitro, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₁-C₄)-haloalcóxi, (C₃-C₆)-cicloalquila, fenila, (C₁-C₄)-alcóxi, ciano, (C₁-C₄)-alquiltio, (C₁-C₄)-alquilsulfinila, (C₁-C₄)-alquilsulfonila, (C₁-C₄)-alcoxicarbonila ou (C₁-C₄)-alquilcarbonila;

[0211] R_D⁵ representa hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₂-C₆)-alquenila, (C₂-C₆)-alquinila, (C₅-C₆)-cicloalquenila, fenila ou heterocíclica com 3 a 6 membros compreendendo v_D heteroátomos do grupo que consiste em nitrogênio, oxigênio e enxofre, onde os sete radicais mencionados por último são substituídos por v_D substituintes do grupo que consiste em halogênio, (C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-haloalcóxi, (C₁-C₂)-alquilsulfinila, (C₁-C₂)-alquilsulfonila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₁-C₄)-alcoxicarbonila, (C₁-C₄)-alquilcarbonila e fenila e, no caso de radicais cíclicos, também (C₁-C₄)-alquila e (C₁-C₄)-haloalquila;

[0212] R_D⁶ representa hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₂-C₆)-alquenila ou (C₂-C₆)-alquinila, onde os três radicais mencionados por último são substituídos por v_D radicais do grupo que consiste em halogênio, hidróxi, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcóxi e (C₁-C₄)-alquiltio, ou

[0213] R_D⁵ e R_D⁶ juntamente com o átomo de nitrogênio que os carrega formam um radical pirrolidinila ou piperidinila;

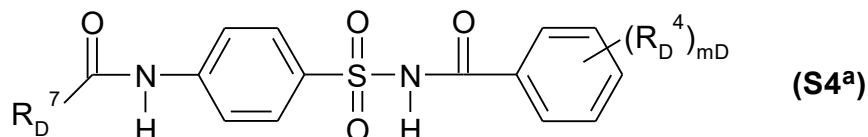
[0214] R_D⁷ representa hidrogênio, (C₁-C₄)-alquilamino, di(C₁-C₄)-alquilamino, (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, onde os 2 radicais mencionados por último são substituídos por v_D substituintes do grupo que consiste em halogênio, (C₁-C₄)-alcóxi, (C₁-C₆)-haloalcóxi e (C₁-C₄)-alquiltio e, no caso de radicais cíclicos, também (C₁-C₄)-alquila e (C₁-C₄)-haloalquila;

[0215] n_D representa 0, 1 ou 2;

[0216] m_D representa 1 ou 2;

[0217] v_D representa 0, 1, 2 ou 3;

[0218] dos quais é dada preferência a compostos do tipo N-acilsulfonamida, por exemplo, da seguinte Fórmula (S4^a), que são conhecidos, por exemplo, de WO-A-97/45016



onde

[0219] R_D^7 representa (C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, onde os 2 radicais mencionados por último são substituídos por v_D substituintes do grupo que consiste em halogênio, (C₁-C₄)-alcóxi, (C₁-C₆)-haloalcóxi e (C₁-C₄)-alquiltio e, no caso de radicais cíclicos, também (C₁-C₄)-alquila e (C₁-C₄)-haloalquila;

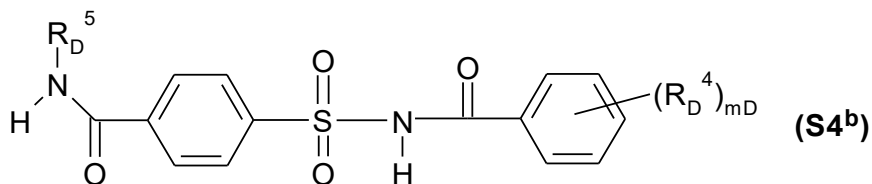
[0220] R_D^4 representa halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcóxi, CF₃;

[0221] m_D representa 1 ou 2;

[0222] v_D representa 0, 1, 2 ou 3;

[0223] assim como

[0224] acilsulfamoidbenzamidás, por exemplo, da seguinte Fórmula (S4^b), que são conhecidas, por exemplo, de WO-A-99/16744,



[0225] por exemplo, aquelas em que

[0226] R_D^5 = ciclopropila e (R_D^4) = 2-OMe ("ciprossulfamida", S4-1),

[0227] R_D^5 = ciclopropila e (R_D^4) = 5-Cl-2-OMe (S4-2),

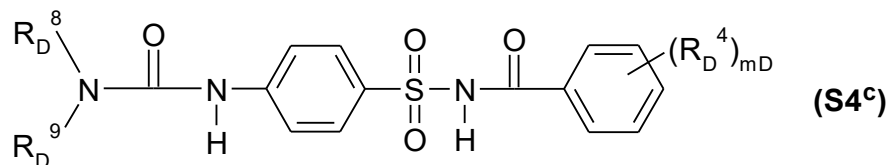
[0228] R_D^5 = etila e (R_D^4) = 2-OMe (S4-3),

[0229] R_D^5 = isopropila e (R_D^4) = 5-Cl-2-OMe (S4-4) e

[0230] R_D^5 = isopropila e (R_D^4) = 2-OMe (S4-5),

[0231] assim como

[0232] compostos do tipo N-acilsulfamoilfenilureia de Fórmula (S4^c), que são conhecidos, por exemplo, de EP-A-365484,



onde

[0233] R_D^8 e R_D^9 , independentemente um do outro, representam hidrogênio, (C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₆)-alquenila, (C₃-C₆)-alquinila,

[0234] R_D^4 representa halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcóxi, CF₃

[0235] m_D representa 1 ou 2;

[0236] por exemplo,

[0237] 1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3-metilureia,

[0238] 1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3,3-dimetilureia,

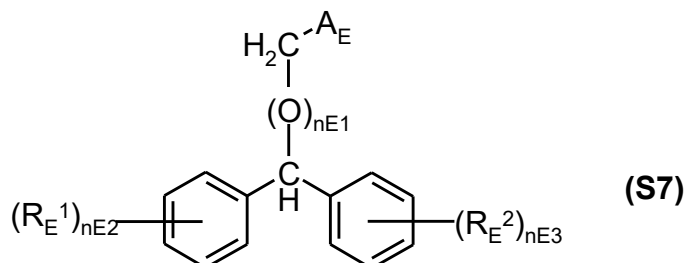
[0239] 1-[4-(N-4,5-dimetilbenzoilsulfamoil)fenil]-3-metilureia.

S5) Ingredientes ativos da classe dos derivados de ácidos carboxílicos hidroxiaromáticos e aromáticos-alifáticos (S5), por exemplo, 3,4,5-triacetoxibenzoato de etila, ácido 3,5-dimetóxi-4-hidroxibenzoico, ácido 3,5-di-hidroxibenzoico, ácido 4-hidroxisalicílico, ácido 4-fluorsalicílico, ácido 2-hidroxicinâmico, ácido 2,4-diclorocinâmico, conforme descrito na WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001.

S6) Ingredientes ativos da classe das 1,2-di-hidroquinoxalin-2-onas (S6), por exemplo 1-metil-3-(2-tienil)-1,2-di-hidroquinoxalin-2-ona, 1-metil-3-(2-tienil)-1,2-di-hidroquinoxalin-2-tiona, hidrocloreto de 1-(2-aminoetil)-3-(2-tienil)-1,2-di-hidro-quinoxalin-2-ona, 1-(2-metilsulfonilaminoetil)-3-(2-tienil)-1,2-di-hidroquinoxalin-2-ona,

conforme descrito na WO-A-2005/112630.

S7) Compostos da Fórmula (S7), conforme são descritas na WO-A-1998/38856



[0240] onde os símbolos e os índices têm os seguintes significados:

[0241] R_E^1 , R_E^2 independentemente um do outro representam halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcóxi, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₁-C₄)-alquilamino, di(C₁-C₄)-alquilamino, nitro;

[0242] A_E representa COOR_E³ ou COSR_E⁴

[0243] R_E^3 , R_E^4 independentemente um do outro representam hidrogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₂-C₆)-alquenila, (C₂-C₄)-alquinila, cianoalquila, (C₁-C₄)-haloalquila, fenila, nitrofenila, benzila, halobenzila, piridinilalquila e alquil amônio,

[0244] n_E^1 representa 0 ou 1

[0245] n_E^2 , n_E^3 independentemente um do outro representam 0, 1 ou 2,

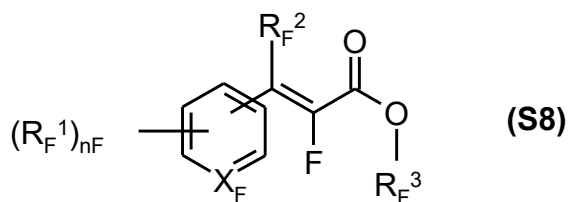
[0246] de preferência:

[0247] ácido difenilmetoxiacético,

[0248] éster de ácido difenilmetoxiacético,

[0249] metil éster de ácido difenilmetoxiacético (CAS Reg. No. 41858-19-9) (S7-1).

S8) Compostos de Fórmula (S8), conforme são descritos na WO-A-98/27049



onde

[0250] X_F representa CH ou N,

[0251] n_F se $X_F=N$, representa um inteiro de 0 a 4 e

[0252] se $X_F=CH$, representa um inteiro de 0 a 5,

[0253] R_F^1 representa halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₁-C₄)-alcóxi, (C₁-C₄)-haloalcóxi, nitro, (C₁-C₄)-alquiltio, (C₁-C₄)-alquilsulfonila, (C₁-C₄)-alcoxicarbonila, fenila opcionalmente substituída, fenóxi opcionalmente substituído,

[0254] R_F^2 representa hidrogênio ou (C₁-C₄)-alquila,

[0255] R_F^3 representa hidrogênio, (C₁-C₈)-alquila, (C₂-C₄)-alquenila, (C₂-C₄)-alquinila, ou arila, onde cada um dos radicais contendo C acima mencionados é não substituído ou substituído por um ou mais, de preferência até três radicais, iguais ou diferentes, do grupo que consiste em halogênio e alcóxi; ou seus sais,

[0256] de preferência compostos nos quais

[0257] X_F representa CH,

[0258] n_F representa um inteiro de 0 a 2,

[0259] R_F^1 representa halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₁-C₄)-alcóxi, (C₁-C₄)-haloalcóxi,

[0260] R_F^2 representa hidrogênio ou (C₁-C₄)-alquila,

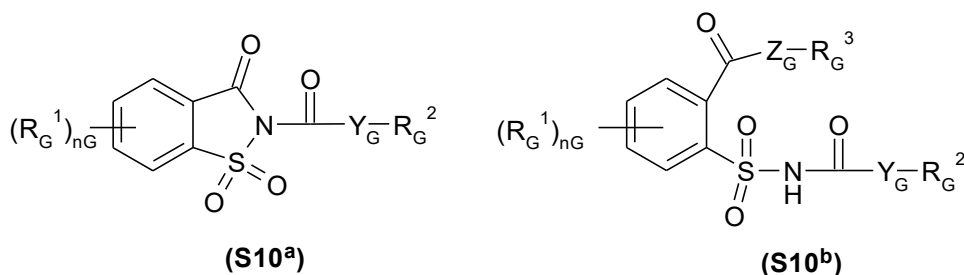
[0261] R_F^3 é hidrogênio, (C₁-C₈)-alquila, (C₂-C₄)-alquenila, (C₂-C₄)-alquinila, ou arila, onde cada um dos radicais contendo C mencionados acima é substituído por um ou mais, de preferência até três radicais iguais ou diferentes não substituídos ou substituídos, do grupo que consiste em halogênio e alcóxi, ou seus sais.

S9) Ingredientes ativos da classe das 3-(5-tetrazolilcarbonil)-2-quinolonas (S9),

[0262] por exemplo, 1,2-di-hidro-4-hidróxi-1-etil-3-(5-tetrazolilcarbonil)-2-quinolona (CAS Reg. No. 219479-18-2), 1,2-di-hidro-4-hidróxi-1-metil-3-(5-tetrazolil carbonil)-2-quinolona (CAS Reg. No. 95855-00-8), conforme descrito na WO-A-1999/000020.

S10) Compostos das Fórmulas (S10^a) ou (S10^b)

[0263] Conforme são descritas na WO-A-2007/023719 e WO-A-2007/023764



onde

[0264] R_G¹ representa halogênio, (C₁-C₄)-alquila, metóxi, nitro, ciano, CF₃, OCF₃

[0265] Y_G, Z_G independentemente um do outro representam O ou S,

[0266] n_G representa um inteiro de 0 a 4,

[0267] R_G² representa (C₁-C₁₆)-alquila, (C₂-C₆)-alquenila, (C₃-C₆)-cicloalquila, arila; benzila, halobenzila,

[0268] R_G³ representa hidrogênio ou (C₁-C₆)-alquila.

S11) Ingredientes ativos do tipo dos compostos de oxiimino (S11), que são conhecidos como infusões para sementes, tais como, por exemplo,

[0269] "oxabetrinil" ((Z)-1,3-dioxolan-2-ilmetóxi-imino(fenil) acetoni-trila) (S11-1), que é conhecida como infusão-fitoprotetor para painço contra dano por metolacoloro,

[0270] "fluxofenim" (1-(4-clorofenil)-2,2,2-trifluor-1-etanon-O-(1,3-dioxolan-2-il metil) oxima) (S11-2), que é conhecida como infusão-safener para painço contra dano por metolacoloro, e

[0271] "ciometrinil" ou "CGA-43089" ((Z)-cianometoxi-imino (fenil)

acetonitrila) (S11-3), que é conhecida como infusão-fitoprotetor para painço contra dano por metolacoloro.

S12) Ingredientes ativos da classe das isotiocromanonas (S12), tais como, por exemplo, [(3-oxo-1H-2-benzotiopiran-4(3H)-ilideno) metóxi] acetato de metila (CAS Reg. No. 205121-04-6) (S12-1) e compostos correlatos da WO-A-1998/13361.

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

[0272] "anidrido naftálico" (anidrido 1,8-naftaleno dicarboxílico) (S13-1), que é conhecido como infusão-fitoprotetor para milho contra danos por herbicida de tiocarbamato,

[0273] "fenclorim" (4,6-dicloro-2-fenil pirimidina) (S13-2), que é conhecido como fitoprotetor para pretilacoloro em arroz cultivado,

[0274] "flurazola" (2-cloro-4-trifluorometil-1,3-tiazola-5-carboxilato de benzila) (S13-3), que é conhecido como infusão-fitoprotetor para painço contra dano por alacoloro e metolacoloro,

[0275] "CL 304415" (CAS Reg. No. 31541-57-8)

[0276] (ácido 4-carbóxi-3,4-di-hidro-2H-1-benzopirran-4-acético) (S13-4) da American Cianamid, que é conhecido como fitoprotetor para milho contra dano por imidazolinona,

[0277] "MG 191" (CAS Reg. No. 96420-72-3) (2-diclorometil-2-metil-1,3-dioxolana) (S13-5) da Nitroquemia, que é conhecido como fitoprotetor para milho,

[0278] "MG-838" (CAS Reg. No. 133993-74-5)

[0279] (1-oxa-4-azaspiro [4.5] decano-4-carboditioato de 2-propenila) (S13-6) da Nitroquemia,

[0280] "dissulfotona" (fosforoditioato de O,O-dietil S-2-etiltioetila) (S13-7),

[0281] "dietolato" (fosforotioato de O,O-dietil O-fenila) (S13-8),

[0282] "mefenato" (metilcarbamato de 4-clorofenila) (S13-9).

S14) Ingredientes ativos que, além de um efeito herbicida

contra plantas nocivas, também apresentam um efeito fitoprotetor em plantas de cultura, tais como arroz, tais como, por exemplo,

[0283] "dimepiperato" ou "MY-93" (S-1-metil-1-feniletilpiperidina-1-carbotioato), que é conhecido como fitoprotetor para arroz contra dano por herbicida de molinato,

[0284] "daimurona" ou "SK 23" (1-(1-metil-1-feniletil)-3-p-tolilureia), que é conhecido como fitoprotetor para arroz contra dano por herbicida de imazossulfurona,

[0285] "cumilurona" = "JC-940" (3-(2-clorofenilmetil)-1-(1-metil-1-fenil etil) ureia, ver JP-A-60087254), que é conhecido como fitoprotetor para arroz contra danos por alguns herbicidas,

[0286] "metoxifenona" ou "NK 049" (3,3'-dimetil-4-metoxibenzofenona), que é conhecido como fitoprotetor para arroz contra danos por alguns herbicidas,

[0287] "CSB" (1-bromo-4-(clorometilsulfonil) benzeno) da Kumiai, (CAS Reg. Nº 54091-06-4), que é conhecido como fitoprotetor para arroz contra danos por alguns herbicidas.

S15) Ingredientes ativos que são principalmente empregadas como herbicidas, mas também apresentam efeito fitoprotetor em plantas de cultura, por exemplo

[0288] ácido (2,4-diclorofenóxi) acético (2,4-D),

[0289] ácido (4-clorofenóxi) acético,

[0290] ácido (R,S)-2-(4-cloro-o-tolilóxi) propiônico (mecoprop),

[0291] ácido 4-(2,4-diclorofenóxi) butírico (2,4-DB),

[0292] ácido (4-cloro-o-tolilóxi) acético (MCPA),

[0293] ácido 4-(4-cloro-o-tolilóxi) butírico,

[0294] ácido 4-(4-clorofenóxi) butírico,

[0295] ácido 3,6-dicloro-2-metoxi benzoico (dicamba),

[0296] 3,6-dicloro-2-metoxibenzoato de 1-(etoxicarbonil)etila (lacti-dicloro-etila).

[0297] Alguns dos fitoprotetores são já conhecidos como herbicidas e portanto, além do efeito herbicida com respeito a plantas nocivas, ao mesmo tempo também desenvolvem um efeito protetor com respeito a plantas de cultura.

[0298] As proporções de herbicida (mistura) para fitoprotetor geralmente dependem da taxa de aplicação do herbicida e da eficácia do fitoprotetor particular e pode variar dentro de limites amplos, por exemplo, na faixa de 200:1 a 1:200, de preferência de 100:1 a 1:100, em particular de 20:1 a 1:20. Os fitoprotetores podem ser formulados analogamente aos compostos de Fórmula (I) ou suas misturas com outros herbicidas/pesticidas e podem ser fornecidos e aplicados como mistura pronta ou mistura tanque com os herbicidas.

[0299] Para uso, as formulações presentes em forma comercial padrão são, caso apropriado, diluídas com água de uma maneira usual, por exemplo, em pós de borriço, concentrados emulsificáveis, dispersões e grânulos dispersáveis em água. Preparados em forma de pó, granulados para solo e espalhamento, e também soluções borrifáveis normalmente não são mais diluídas com outras substâncias inertes antes do uso.

[0300] A taxa de aplicação requerida dos compostos de Fórmula (I) varia entre outros com as condições externas, tais como temperatura, umidade, o tipo de herbicida empregado. Ele pode flutuar dentro de limites amplos, por exemplo, entre 0,001 e 10,0 kg/ha ou mais substâncias ativas, mas se situa de preferência entre 0,005 e 5 kg/ha.

[0301] A presente invenção é ilustrada em maior detalhe com referência aos exemplos abaixo, embora eles não limitem a invenção de nenhuma maneira.

A. Exemplos de síntese

Exemplos de preparação:

2-amino-4-indanil-1-amino-6-metilpirimidina (ex.: I-4)

[0302] Uma mistura de 2,9 g (20 mmols) de 2-amino-4-cloro-6-metilpirimidina, 2,9 g (22 mmols) de 1-aminoindano e 4,1 g (30 mmols) de carbonato de potássio em 30 mL de dimetilformamida é aquecida a 145°C por 3 horas. Após resfriamento, a mistura de reação é hidrolizada, a mistura aquosa é extraída com cloreto de metileno, a fase orgânica separada é seca com sulfato de sódio. Após remoção por filtração do agente de secagem e concentração da fase orgânica por evaporação, a mistura bruta é separada por meio de separação por cromatografia em coluna empregando acetato de etila /metanol/trietilamina 90/10/1 como eluente. A 2-amino-4-indanil-1-amino-6-metilpirimidina obtida dessa forma é dissolvida em acetato de etila /heptano 2:8 e tratada com carvão ativado. Após separação do carvão ativado e concentração do solvente por evaporação, 1 g de 2-amino-4-indanil-1-amino-6-metil pirimidina é obtida (sólido vítreo, p.f.: 53-54°C, 20% rendimento, 95% pureza).

N4-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-di-hidro-1H-inden-1-il]-6-(trifluormetil) pirimidina-2,4-diamina (ex.: I-27)

[0303] Uma mistura de 0,3 g (1,5 mmol) de 2-amino-4-cloro-6-trifluorometil-pirimidina, 0,3 g (1,5 mmol) de cloreto de (1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-di-hidro-1H-inden-1-amínio e 0,53 g (3,8 mmols) de carbonato de potássio em 3 mL de dimetilformamida é aquecida a 120°C por 5 horas. Após resfriamento, a mistura de reação é adsorvida em sílica-gel e purificada através de cromatografia em coluna empregando acetato de etila/heptano como eluente. Após concentração por evaporação obteve-se 0,24 g de N4-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-di-hidro-1H-inden-1-il] -6-(trifluormetil) pirimidina-2,4-diamina sólida (44% rendimento, 90% pureza).

[0304] 33,4 g (0,186 mol) de 4-hidróxi-6-trifluor metal pirimidin-2-ilamina são adicionados em porções (em cada caso cerca de 5 g) a uma mistura de 85 mL de oxicloreto de fósforo e 47,5 mL de dimetilani-

lina e a mistura é aquecida até o refluxo até que o sólido adicionado se tenha dissolvido. A mistura é então aquecida até o refluxo por mais 90 minutos. Após resfriamento, a mistura de reação é adicionada a água gelada enquanto as precauções de segurança para oxicloreto de fósforo são observadas. A fase aquosa é extraída com cloreto de metileno, a fase orgânica é separada e secada com sulfato de sódio, e o agente secante é removido por filtração. Após a concentração por evaporação, 47,8 g de uma mistura bruta são obtidas. Após separação por cromatografia em coluna empregando acetato de etila/ heptano como eluente, 8,5 g de 4-cloro-6-trifluorometilpirimidin-2-ilamina foram obtidas (sólido, 22% rendimento, pureza 95%).

5-cloro-N4-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-di-hidro-1H-inden-1-il]-6-(trifluorometil) pirimidina-2,4-diamina (ex.: I-38)

[0305] Uma mistura de 0,10 g (0,43 mmol) de 4,5-dicloro-6-(trifluorometil)pirimidin-2-amina, 0,08 g (0,51 mmol) de (1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-amina e 0,14 g (1,3 mmol) de carbonato de potássio em 1 mL de dimetil acetamida como solvente é aquecida a 125°C por 30 minutos em um equipamento de micro-ondas (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>). A mistura bruta é absorvida em sílica-gel e, após separação por cromatografia em coluna, 0,089 g de 5-cloro-N4-[(1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-di-hidro-1H-inden-1-il]-6-(trifluorometil)pirimidin-2,4-diamina é obtida (sólido, 55% rendimento, 95% pureza).

2-amino-4-fenil-6-[(1R)-1,2,3,4-tetra-hidronaftalen-1-ilamino] pirimidina-5-carbonitrila (ex.: I-53)

[0306] Uma mistura de 0,40 g (1,21 mmol) de 2-amino-4-cloro-6-fenil pirimidina-5-carbonitrila (mistura bruta como precursor, cerca de 70% pureza), 0,27 g (1,82 mmol) de (1R,2S)-2,6-dimetil-2,3-di-hidro-1H-inden-1-amina e 0,34 g (2,42 mmols) de carbonato de potássio é aquecida em 1 mL de N-metil pirrolidona como solvente a 150°C por

60 minutos em um aparelho de micro-ondas (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/DynPage.aspx?id=22001>). A mistura bruta é absorvida em sílica-gel e, após separação por cromatografia em coluna, 0,291 g de 2-amino-4-fenil-6-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilamino] pirimidina-5-carbonitrila é obtida (sólido, 67% rendimento, 95% pureza).

[0307] A uma mistura de 50 mL de oxiclreto de fósforo e 0,5 mL de dimetil anilina adiciona-se em porções (cada uma de cerca de 1 g) 6,6 g (31,1 mmols) de 2-amino-6-oxo-4-fenil-1,6-di-hidropirimidina-5-carbonitrila, e a mistura é aquecida até o refluxo e até que o sólido adicionado se tenha dissolvido. A mistura é então aquecida até o refluxo por mais 90 minutos. Após resfriamento, a mistura de reação é adicionada a água gelada enquanto são observadas as precauções de segurança para oxiclreto de fósforo. A fase aquosa é extraída com cloreto de metileno, a fase orgânica é separada e seca com sulfato de sódio, e o agente de secagem é removido por filtração. Após concentração por evaporação, 3,2 g de 2-amino-4-cloro-6-fenilpirimidina-5-carbonitrila são obtidos (sólido, cerca 70% pureza, contaminada com 2-amino-6-oxo-4-fenil-1,6-di-hidropirimidina-5-carbonitrila e dimetilani-
lina; a mistura bruta pode ser empregada na etapa subsequente sem maior purificação).

[0308] A uma mistura de 80 mL de metanol, 5,5 g (34,5 mmols) de N-cianobenzenocarboximidoato de metila e 2,9 g (34,5 mmols) de cianacetamida adiciona-se em gotas 7,6 mL (7,4 g, densidade 0,98 g/L, 41,2 mmols) de uma solução de metanolato de sódio 30% disponível comercialmente. A mistura de reação é aquecida até o refluxo por 120 minutos, a mistura é resfriada e concentrada por evaporação, e o resíduo que permanece é dissolvido em água. A fase aquosa é então neutralizada com ácido sulfúrico concentrado e o sólido precipitado é isolado. Após secagem, 6,78 g de 2-amino-6-oxo-4-fenil-1,6-di-

hidropirimidina-5-carbonitrila são obtidos (sólido, cerca 95% pureza).

N4-[(1R)-1,2,3,4-tetra-hidronaftalen-1-il]-5-(trifluormetil) pirimidina-2,4-diamina (ex.: 1-60)

[0309] Sob agitação, 1,0 g de 2,4-dicloro-5-(trifluor metil) pirimidina, Aldrich ordem no. 684864, é adicionado a uma solução de amônia metanólica (cerca 8 mol de amônia em metanol) resfriada a cerca de 5°C, a mistura é aquecida a 25°C e agitada por 2 horas a essa temperatura. A mistura é concentrada por evaporação e adicionada a água. Após filtração com sucção, obtém-se 0,56 g de uma mistura de 4-amino-2-cloro-5-trifluormetilpirimidina (cerca 45%) e 2-amino-4-cloro-5-trifluorometil pirimidina (cerca 45%).

[0310] Então, uma mistura de 0,25 g do sólido obtido acima e 0,224 g (1,47 mmol) de (R)-1,2,3,4-tetra-hidro-1-naftilamina e 0,35 g (2,53 mmols) de carbonato de potássio em 1 mL de N-metilpirrolidona como solvente é aquecida em uma célula fechada em um aparelho de micro-ondas (Biotage Initiator, <http://www.biotage.com/Dyn-Page.aspx?id=22001>) a 160°C por 60 minutos. A mistura bruta é absorvida em sílica-gel e, após separação por meio de cromatografia em coluna, obtém-se 0,190 g de N4-[(1R)-1,2,3,4-tetra-hidronaftalen-1-il]-5-(trifluormetil)pirimidina-2,4-diamina (ceroso, 95% pureza).

Dados físico-químicos:

Composto	Descrição
1.4	sólido, p.fus.: 53 - 55 °C; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 300 MHz, δ em ppm): 1,85 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂) 2,80 (m, 2H, CH ₂); 5,10 – 5,50 (m, 4H, CH, NH, NH ₂); 5,70 (s, 1H, PYR-H); 7,15 – 7,30 (m, 4H, Ar-H)
1.17	sólido, p.fus.: 184 – 185 °C;; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 300 MHz, δ em ppm): 1,70 – 2,00 (m, 2 * CH ₂); 2,20 (s, 3H, CH ₃); 2,25 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 2H, CH ₂); 4,80 – 5,40 (m, 4H, CH, NH ₂ , NH); 6,10 (s, 1H, PYR-H); 6,95 (br, 2H, Ar-H)

Composto	Descrição
1.18	sólido, p.fus.: 134 – 135 °C; 1H-NMR (CDCl ₃ , 300 MHz, δ em ppm): 1,90 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,60 (m, 1H, 1H de CH ₂) 2,90 (m, 2H, CH ₂); 5,10 – 5,50 (m, 4H, CH, NH, NH ₂); 6,10 (s, 1H, PYR-H); 7,15 - 7,30 (m, 4H, Ar-H)
1.19	sólido, p.fus.: 167 – 168 °C; 1H-NMR (CDCl ₃ , 300 MHz, δ em ppm): 1,90 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,60 (m, 1H, 1H de CH ₂) 2,90 (m, 2H, CH ₂); 3,70 (s, 3H, OCH ₃); 4,95 (br, 2H, NH ₂); 5,50 (d, 1H, NH); 5,70 (dd, 1H, CH); 7,15 - 7,30 (m, 4H, Ar-H)
1.24	sólido, p.fus.: 194 – 195 °C; 1H-NMR (CDCl ₃ , 300 MHz, δ em ppm): 1,70 – 2,00 (m, 2 * CH ₂); 2,20 (s, 3H, CH ₃); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 2H, CH ₂); 3,70 (s, 3H, OCH ₃); 4,95 (br, 2H, NH ₂); 5,30 (br, 1H, CH); 5,50 (d, 1H, NH); 6,95 (br, 2H, Ar-H)
1.25	sólido, p.fus.: 140 – 142 °C; 1H-NMR (CDCl ₃ , 300 MHz, δ em ppm): 1,70 – 2,00 (m, 2 * CH ₂); 2,20 (s, 3H, CH ₃); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,35 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 2H, CH ₂); 5,15 (br, 1H, CH); 5,30 (br, 2H, NH ₂); 6,50 (d, 1H, NH); 6,95 (br, 2H, Ar-H)
1.26	sólido, p.fus.: 156 – 158 °C; 1H-NMR (CDCl ₃ , 300 MHz, δ em ppm): 1,90 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,00 (s, 3H, CH ₃); 2,60 (m, 1H, 1H de CH ₂) 2,90 (m, 2H, CH ₂); 4,80 (br, 2H, NH ₂); 4,95 (d, 1H, NH); 5,75 (dd, 1H, CH); 7,15 - 7,30 (m, 4H, Ar-H)
1.27	sólido; logp (HCOOH): 2,77; 1H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,35 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 4,40 – 6,40 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 6,95 - 7,10 (m, 3H, Ar-H)

Composto	Descrição
1.30	sólido; p.fus.: 197,7 °C; logp (HCOOH): 1,39; 1H-NMR (DMSO, 400 MHZ, δ em ppm): 1,20 (d, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,20 (t, 1H, CH); 6,25 (br, 2H, NH ₂); 6,40 (t, 1H, CF ₂ H); 6,90 - 7,10 (m, 3H, Ar-H); 7,50 (br, 1H, NH);
1.35	sólido; logp (HCOOH): 1,18; 1H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ em ppm): 1,85 (m, 3H, 1H de CH ₂ ; CH ₂); 2,05 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, CH ₂); 4,70 – 5,50 (m, 3H, CH, NH ₂); 6,00 (br, 1H, NH); 6,20 (t, 1H, CF ₂ H); 7,05 - 7,30 (m, 4H, Ar-H)
1.36	ceroso; logp (HCOOH): 1,08; 1H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ em ppm): 1,85 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,65 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 und 2,95 (em cada caso m, 2H, 1H de CH ₂); 4,70 – 5,50 (m, 3H, CH, NH ₂); 6,20 (br, 1H, NH); 6,20 (t, 1H, CF ₂ H); 7,15 - 7,30 (m, 4H, Ar-H)
1.38	sólido; p.fus.: 169,2 °C; logp (HCOOH): 3,98; 1H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ em ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,30 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 3,10 (dd, 1H, CH); 4,95 (br, 2H, NH ₂); 5,30 (t, 1H, CH); 5,70 (br, 1H, NH); 6,95 (s, 1H, Ar-H); 7,05 (dd, 2H, Ar-H);
1.41	sólido; logp (HCOOH): 3,27; 1H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ em ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,30 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,55 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 3,10 (dd, 1H, CH); 3,75 (s, 3H, OCH ₃); 5,30 (t, 1H, CH); 5,80 (br, 2H, NH ₂); 5,70 (br, 1H, NH); 6,95 (s, 1H, Ar-H); 7,05 (dd, 2H, Ar-H);

Composto	Descrição
1.42	ceroso; logp (HCOOH): 2,60; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (dd, 1H, CH); 4,70 – 5,00 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 5,90 (br, 1H, PYR-H); 6,95 – 7,10 (m, 3H, Ar-H);
1.43	ceroso; logp (HCOOH): 2,16; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,85 (m, 3H, 3H de CH ₂); 2,05 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, CH); 4,70 – 5,00 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 5,80 (br, 1H, PYR-H); 7,05 – 7,30 (m, 4H, Ar-H);
1.44	ceroso; logp (HCOOH): 1,95; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,85 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,60 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,90 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (m, 1H, 1H de CH ₂); 4,70 – 5,00 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 5,90 (br, 1H, PYR-H); 7,15 – 7,30 (m, 4H, Ar-H);
1.45	ceroso; logp (HCOOH): 2,87; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,85 (m, 3H, 1H de CH ₂ ; CH ₂); 2,05 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, CH ₂); 4,80 (br, 2H, NH ₂); 5,35 (t, 1H, CH); 5,50 (br, 1H, NH); 7,05 - 7,30 (m, 4H, Ar-H)
1.47	ceroso; logp (HCOOH): 3,76; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,85 (m, 3H, 3H de CH ₂); 2,05 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, CH); 4,95 (br, 2H, NH ₂); 5,40 (br, 1H, CH); 5,80 (br, H, NH); 7,05 – 7,30 (m, 4H, Ar-H);

Composto	Descrição
1.51	sólido; p.fus.: 164 – 5 °C; logp (HCOOH): 3,27; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ em ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,35 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,35 (s, 3H, CH ₃); 2,55 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 3,10 (dd, 1H, CH); 5,25 (br, 2H, NH ₂); 5,45 (t, 1H, CH); 5,60 (br, 1H, NH); 6,95 (s, 1H, Ar-H); 7,05 (dd, 2H, Ar-H); 7,50 (m, 3H, Ar-H); 7,90 (m, 2H, Ar-H);
1.53	sólido; logp (HCOOH): 2,87; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ em ppm): 1,85 (m, 3H, 1H de CH ₂ ; CH ₂); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, CH ₂); 5,25 (br, 2H, NH ₂); 5,50 (t, 1H, CH); 5,70 (br, 1H, NH); 7,10 - 7,30 (m, 4H, Ar-H); 7,50 (m, 3H, Ar-H); 7,90 (m, 2H, Ar-H);
1.54	ceroso; logp (HCOOH): 1,71; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ em ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,35 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,35 (s, 3H, CH ₃); 2,40 (s, 3H, CH ₃); 2,55 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 3,10 (dd, 1H, CH); 5,10 (br, 2H, NH ₂); 5,40 (br, 2H, CH, NH); 6,95 (s, 1H, Ar-H); 7,05 (dd, 2H, Ar-H);
1.57	sólido, p.fus.: 144 – 145 °C; logp (HCOOH): 1,64; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ em ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,35 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,35 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, CH); 5,00 (br, 2H, NH ₂); 5,20 (br, 1H, NH); 5,45 (t, 1H, CH); 6,95 (s, 1H, Ar-H); 7,05 (dd, 2H, Ar-H); 8,15 (s, 1H, PYR-H)
1.58	sólido; logp (HCOOH): 1,49; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHZ, δ em ppm): 1,85 (m, 3H, 3H de CH ₂); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, CH); 4,95 (br, 2H, NH ₂); 5,20 (br, 1H, CH); 5,50 (br, H, NH); 7,05 – 7,30 (m, 4H, Ar-H); 8,05 (s, 1H, PYR-H);

Composto	Descrição
1.59	ceroso; logp (HCOOH): 1,16; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,85 (m, 3H, 1H de CH ₂ ; CH ₂); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,85 (m, 2H, CH ₂); 5,25 (br, 2H, NH ₂); 5,40 (br, 2H, NH, CH); 7,10 - 7,30 (m, 4H, Ar-H);
1.60	sólido, p.fus.: 120 – 121 °C; logp (HCOOH): 1,55; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,35 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,35 (s, 3H, CH ₃); 2,40 (s, 3H, CH ₃); 2,55 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 3,10 (dd, 1H, CH); 5,00 (br, 2H, NH ₂); 5,35 (t, 1H, CH); 5,60 (br, 1H, NH); 6,95 (s, 1H, Ar-H); 7,05 (dd, 2H, Ar-H);
1.62	ceroso; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,85 (m, 3H, 1H de CH ₂ ; CH ₂); 2,05 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,35 (s, 3H, CH ₃); 2,85 (m, 2H, CH ₂); 4,70 (br, 2H, NH ₂); 5,40 (m, 2H, NH, CH); 7,10 - 7,30 (m, 4H, Ar-H);
1.63	sólido, logp (HCOOH): 2,54; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,25 (d, 3H, CH ₃); 2,35 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,35 (s, 3H, CH ₃); 2,50 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 3,10 (dd, 1H, CH); 4,05 (s, 3H, OCH ₃); 5,00 – 5,60 (n, 4H, NH, CH, NH ₂); 6,80 (br, 1H, PYR-H); 6,95 (s, 1H, Ar-H); 7,05 (dd, 2H, Ar-H);
1.210	sólido, p.fus.: 168 – 169 °C; logp (HCOOH): 3,41; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,90 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,70 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,90 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (m, 1H, 1H de CH ₂); 4,95 (br, 2H, NH ₂); 5,65 (br, 1H, CH); 5,75 (br, H, NH); 7,15 – 7,30 (m, 4H, Ar-H);

Composto	Descrição
1.212	ceroso; logp (HCOOH): 1,64; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,20 (t, 3H, CH ₃); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,25 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,55 (m, 2H, 2H de CH ₂ CH ₃); 4,15 (m, 1H, 1H de CH ₂ O); 4,25 (m, 1H, 1H de CH ₂ O); 5,00 (br, 2H, NH ₂); 5,30 (br, H, NH); 5,45 (br, 1H, CH); 6,80 (d, 1H, Ar-H); 7,00 – 7,10 (m, 2H, Ar-H); 8,10 (s, 1H, PYR-H);
1.213	ceroso; logp (HCOOH): 1,25; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,35 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,70 (s, 3H, OCH ₃); 4,10 (m, 1H, 1H de CH ₂ O); 4,25 (m, 1H, 1H de CH ₂ O); 5,45 (br, 1H, CH); 5,80 (br, 2H, NH ₂); 6,00 (br, H, NH); 6,60 (s, 1H, Ar-H); 6,85 (m, 2H, Ar-H); 8,00 (s, 1H, PYR-H);
1.215	ceroso; logp (HCOOH): 2,03; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,35 (s, 3H, CH ₃); 1,40 (s, 3H, CH ₃); 2,00 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,40 (m, 1H, 1H de CH ₂); 5,00 – 5,10 (br, 3H, NH, NH ₂); 5,55 (br, 1H, CH); 6,80 (d, 1H, Ar-H); 6,95 (d, 1H, Ar-H); 8,10 (s, 1H, PYR-H);
1.216	ceroso; logp (HCOOH): 1,66; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 0,90 (d, 3H, CH ₃); 2,60 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,90 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 5,15 (br, 2H, NH ₂); 5,25 (br, H, NH); 5,80 (br, 1H, CH); 6,85 – 7,00 (m, 2H, Ar-H); 7,15 (m, 1H, Ar-H); 8,10 (s, 1H, PYR-H);
1.218	ceroso; logp (HCOOH): 1,60; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 2,00 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,65 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,90 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,05 (dd, 1H, 1H de CH ₂); 5,05 (br, 2H, NH ₂); 5,20 (br, H, NH); 5,75 (br, 1H, CH); 7,15 – 7,30 (m, 3H, Ar-H); 8,10 (s, 1H, PYR-H);

Composto	Descrição
1.220	ceroso; logp (HCOOH): 1,48; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,90 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,30 (s, 3H, CH ₃); 2,70 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,85 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (m, 1H, 1H de CH ₂); 5,70 – 6,00 (m, 4H, NH ₂ , NH, CH); 7,05 – 7,30 (m, 3H, Ar-H); 7,95 (s, 1H, PYR-H);
1.223	ceroso; logp (HCOOH): 1,78; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,20 – 2,10 (m, 14H); 2,50 (s, 3H, CH ₃); 2,80 (m, 2H, 2H de CH ₂); 4,85 (m, 1H, 1H de CHO); 5,00 (br, 2H, NH ₂); 5,50 (br, 1H, CH); 7,05 – 7,30 (m, 4H, Ar-H); 8,70 (br, 1H, NH);
1.224	sólido; logp (HCOOH): 3,83;
1.225	ceroso; logp (HCOOH): 3,83; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,80 (m, 3H, 3H de CH ₂); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 (m, 2H, 2H de CH ₂); 3,90 (s, 3H, OCH ₃); 4,80 (br, 2H, NH ₂); 5,45 (br, 1H, CH); 5,50 (br, 1H, NH); 7,05 – 7,30 (m, 4H, Ar-H);
1.225	sólido, p,fus.: 150 – 151 °C; logp (HCOOH): 0,83;
1.226	ceroso; logp (HCOOH): 1,48;
1.256	ceroso; logp (HCOOH): 3,56; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,85 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,65 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,85 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,00 (m, 1H, 1H de CH ₂); 3,90 (s, 3H, OCH ₃); 4,80 (br, 2H, NH ₂); 5,60 (br, 1H, NH); 5,65 (br, 1H, CH); 7,15 – 7,35 (m, 4H, Ar-H);

Composto	Descrição
1.257	ceroso; logp (HCOOH): 3,90; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,15 (t, 3H, CH ₃); 2,10 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,20 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,55 (q, 2H, 2H de CH ₂ CH ₃); 3,90 (s, 3H, OCH ₃); 4,15 (m, 1H, 1H de CH ₂ O); 4,25 (m, 1H, 1H de CH ₂ O); 4,85 (br, 2H, NH ₂); 5,35 (br, 1H, CH); 5,55 (br, H, NH); 6,75 (d, 1H, Ar-H); 7,00 (d, 2H, Ar-H);
1.259	ceroso; logp (HCOOH): 4,59; ¹ H-NMR (CDCl ₃ , 400 MHz, δ em ppm): 1,20 (d, 6H, 2*CH ₃); 1,85 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,65 (m, 1H, 1H de CH ₂); 2,80 – 3,00 (m, 3H, 1H de CH(CH ₃) ₂ , 2H de CH ₂); 4,85 (br, 2H, NH ₂); 5,55 (br, H, NH); 5,70 (br, 1H, CH); 7,15 – 7,35 (m, 3H, Ar-H);

B. Exemplos de formulação

a) Uma composição em pó é obtida por misturação de 10 partes em peso de um composto de Fórmula (I) e/ou seus sais e 90 partes em peso de talco como substância inerte, e por cominutação em um moinho de impacto.

b) Um pó umectável, facilmente dispersável em água, é obtido por misturação de 25 partes em peso de um composto de Fórmula (I) e/ou seus sais, 64 partes em peso de quartzo contendo caulim como substância inerte, 10 partes em peso de lignossulfonato de potássio e 1 parte em peso de oleoilmetiltaurato de sódio como agente umectante e dispersante, e por moagem em um moinho de pinos.

c) Um concentrado de dispersão facilmente dispersável em água é obtido por misturação de 20 partes em peso de um composto de Fórmula (I) e/ou seus sais com 6 partes em peso de alquilfenol poliglicol éter (®Triton X 207), 3 partes em peso de isotridecanol poliglicol éter (8 EO) e 71 partes em peso de óleo mineral parafínico (faixa de ebulição, por exemplo, cerca de 255 a mais do que 277°C), e por mo-

agem em um moinho de atrito de contas até uma finura abaixo de 5 microns.

d) Um concentrado emulsificável é obtido de 15 partes em peso de um composto de Fórmula (I) e/ou seus sais, 75 partes em peso de ciclo-hexanona como solvente e 10 partes em peso de nonilfenol oxetilado como emulsificante.

e) Um granulado dispersável em água é obtido por misturação de

75 partes em peso de um composto de Fórmula (I) e/ou seus sais,

10 partes em peso de lignosulfonato de cálcio,

5 partes em peso de lauril sulfato de sódio,

3 partes em peso de álcool polivinílico e

7 partes em peso de caulim,

[0311] Em um moinho de pinos e por granulação do pó em um leito fluidizado por borrafo em água como fluido granulador.

f) Um granulado dispersável em água é também obtida por homogeneização e precominutação de

25 partes em peso de um composto de Fórmula (I) e/ou seus sais,

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

2 partes em peso de oleoilmetiltaurato de sódio,

1 parte em peso de álcool polivinílico,

17 partes em peso de carbonato de cálcio e

50 partes em peso de água

em um moinho de coloide, em seguida moagem em um moinho de pérolas e atomização e secagem da suspensão obtida nessa maneira em uma torre de borrafinhos através de um bocal de um componente.

C. Exemplos biológicos

Descrição do experimento

1. Efeito herbicida e compatibilidade de plantas de cultura em sementes de pré-emergência

[0312] Sementes de ervas e plantas de cultura monocotiledôneas ou dicotiledôneas são plantadas em potes de fibra de madeira em argila arenosa e são cobertas com terra. Os compostos de acordo com a invenção, formulados na forma de pós umectáveis (WP) ou como concentrados em emulsão (EC), são então aplicados como suspensão aquosa ou emulsão a uma taxa de aplicação recalculada de água de 600 a 800 l/ha com a adição de 0,2% de agente umectante à superfície da terra de cobertura.

[0313] Em seguida ao tratamento, os potes são colocados em uma estufa e mantidos sob boas condições de crescimento para as plantas de teste. A avaliação visual do dano nas plantas de teste é efetuada após um tempo de experiência de 3 semanas em comparação com plantas de controle não tratadas (efeito herbicida em porcentagem (%): efeito 100% = as plantas morreram, efeito 0% = como as plantas de controle).

[0314] As seguintes abreviaturas são empregadas nas tabelas abaixo:

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

AMARE: *Amaranthus retroflexus* CHEAL: *Chenopodium album*

CIPES: *Cyperus esculentus* ECHCG: *Echinochloa crus-galli*

LOLMU: *Lolium multiflorum* MATIN: *Matricaria inodora*

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

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

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

Tabela 1: Efeito herbicida na pré-emergência

Ex. N°.	Dosagem	ALOMY	AMARE	CIPE	ECHCG	LOLMU	MATIN	POLCO	SETVI	STEME	VERPE	VIOTR
1.18	320		100					100			100	
1.17	320		100								100	
1.31	320	100		100		80		100	100			
1.27	320		100		100	80	100	100	100	100	100	100
1.30	320	100	100		100	100	100	100	100	100	100	100
1.35	320	80	100		80	100		100	90		100	100
1.42	320	100	100		100		100	100	100	100	100	100
1.44	320		100					100			100	100

[0315] Como os resultados mostram, os compostos de acordo com a invenção apresentam uma boa eficácia herbicida pré-emergência com respeito de um amplo espectro de ervas e gramíneas daninhas. Por exemplo, os compostos na tabela 1 apresentam um efeito herbicida muito bom com respeito a plantas nocivas tais como *Stellaria media*, *Echinocloa crus-galli*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis*, *Amaranthus retroflexus* e *Alopecurus myosuroides* no método de pré-emergência a uma taxa de aplicação de 0,32 kg e menos substância ativa por hectare.

2. Efeito herbicida pós-emergência e compatibilidade com plantas de cultura

[0316] Sementes de ervas ou de plantas de cultura monocotiledôneas ou dicotiledôneas são plantadas em potes de fibra de madeira em argila arenosa, coberta com terra e cultivadas em uma estufa sob boas condições de crescimento. 2 a 3 semanas após a semeadura, as plantas de teste são tratadas no estágio de uma folha. Os compostos de acordo com a invenção, formulados na forma de pós umectáveis (WP) ou como concentrados em emulsão (EC), são então borrifados sobre as partes verdes de plantas como suspensão aquosa ou emulsão a uma taxa de aplicação recalculada de 600 a 800 l/ha com a adição de 0,2% de agente umectante. Após cerca de 3 semanas de tempo de repouso das plantas de teste na estufa sob condições ótimas de

crescimento, o efeito dos preparados é avaliado visualmente em comparação com plantas de controle não tratadas (efeito herbicida em porcentagem (%):efeito 100% = as plantas morreram, efeito 0% = como as plantas de controle).

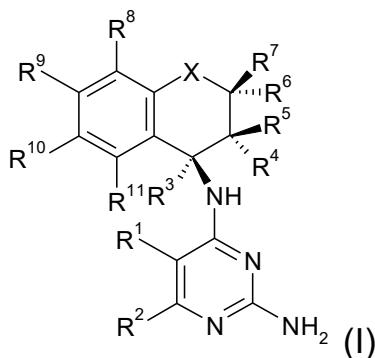
Tabela 2: Efeito herbicida pós-emergência

Ex. N°	Dosagem	ABUTH	AMARE	CHEAL	ECHCG	LOLMU	MATIN	PHBPU	POLCO	SETVI	STEME	VERPE	VIOTR
1.31	320	90	100	80			90					90	
1.27	320	90	100		85			85	80	80		85	85
1.30	320	85	95		87	80		90		80	80	90	85
1.35	320		90					80					80
1.36	320	80	100		90	90		80				90	90
1.42	320		100		90			100	80	80		80	90

[0317] Como os resultados mostram, compostos de acordo com a invenção apresentam uma boa eficácia herbicida pós-emergência com respeito a um amplo espectro de ervas e gramíneas daninhas. Por exemplo, os compostos na tabela 2 apresentam um efeito herbicida muito bom contra plantas nocivas tais como *Echinocloa crus-galli*, *Abutilon theophrasti* e *Amaranthus retroflexus* no método de pós-emergência a uma taxa de aplicação de 0,32 kg e menos substância ativa por hectare.

REIVINDICAÇÕES

1. Composto opticamente ativo, caracterizado pelo fato de que apresenta a Fórmula (I), e seus sais agroquimicamente compatíveis,



na qual

R^1 e R^2 , independentemente um do outro, são selecionados do grupo que consiste em

- hidrogênio, halogênio, hidróxi, ciano, nitro, amino, $C(O)OH$, $C(O)NH_2$;

- (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -halogenalquila, (C_1-C_6) -alquilcarbonila, (C_1-C_6) -haloalquilcarbonila, (C_1-C_6) -alquilcarbonilóxi, (C_1-C_6) -halogenalquilcarbonilóxi, (C_1-C_6) -alquilcarbonila- (C_1-C_4) -alquila;

- (C_1-C_6) -alcóxi, (C_1-C_6) -halogenalcóxi, (C_1-C_6) -alcoxycarbonila, (C_1-C_6) -haloalcoxycarbonila, (C_1-C_6) -alcoxycarbonila- (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -haloalcoxycarbonila- (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -alcoxycarbonila- (C_1-C_6) -halogenalquila, (C_1-C_6) -halogenalcoxycarbonila- (C_1-C_6) -halogenalquila;

- (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_6) -halogenalquenila, (C_2-C_6) -alquenilcarbonila, (C_2-C_6) -haloalquenilcarbonila, (C_2-C_6) -alquenilóxi, (C_2-C_6) -haloalquenilóxi, (C_2-C_6) -alqueniloxycarbonila, (C_2-C_6) -haloalqueniloxycarbonila;

- (C_2-C_6) -alquinila, (C_2-C_6) -halogenalquinila, (C_2-C_6) -alquinilcarbonila, (C_2-C_6) -haloalquinilcarbonila, (C_2-C_6) -alquinilóxi, (C_2-C_6) -haloalquinilóxi;

(C₆)-haloalquinilóxi, (C₂-C₆)-alquiniloxicarbonila, (C₂-C₆)-halogenalquiniloxicarbonila;

- tri(C₁-C₆)-alquilsilil-(C₂-C₆)-alquinila, di(C₁-C₆)-alquilsilil-(C₂-C₆)-alquinila, mono(C₁-C₆)-alquilsilil-(C₂-C₆)-alquinila, fenilsilil-(C₂-C₆)-alquinila;

- (C₆-C₁₄)-arila, (C₆-C₁₄)-arilóxi, (C₆-C₁₄)-arilcarbonila e (C₆-C₁₄)-aril oxicarbonila, que podem em cada caso ser substituídas na parcela arila por halogênio, (C₁-C₆)-alquila e/ou (C₁-C₆)-haloalquila;

- (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-alquila, (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-alcóxi, (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-alquil-carbonila, (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-alquil-carbonilóxi, (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-alcoxicarbonila, (C₆-C₁₄)-aril-(C₁-C₆)-alcoxicarbonilóxi;

- mono-((C₁-C₆)-alquil)-amino, mono-((C₁-C₆)-haloalquil)-amino, di((C₁-C₆)-alquil)-amino, di((C₁-C₆)-haloalquil)-amino, ((C₁-C₆)-alquil-(C₁-C₆)-haloalquil)-amino, N-((C₁-C₆)-alcanoil)-amino, N-((C₁-C₆)-haloalcanoil)-amino, aminocarbonil-(C₁-C₆)-alquila, di-(C₁-C₆)-alquilaminocarbonil-(C₁-C₆)-alquila;

- mono-((C₁-C₆)-alquil)-amino-carbonila, mono-((C₁-C₆)-haloalquil)-amino-carbonila, di-((C₁-C₆)-alquil)-amino-carbonila, di((C₁-C₆)-haloalquil)-amino-carbonila, ((C₁-C₆)-alquil-(C₁-C₆)-haloalquil)-amino-carbonila, N-((C₁-C₆)-alcanoil)-amino-carbonila, N-((C₁-C₆)-haloalcanoil)-amino-carbonila;

- (C₁-C₆)-alcóxi-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alcóxi-(C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-alcoxicarbonil-(C₁-C₆)-alcóxi;

- (C₃-C₈)-cicloalquila, que pode ser opcionalmente substituída no radical cicloalquila por (C₁-C₆)-alquila e/ou halogênio; (C₃-C₈)-cicloalcóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alcóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-haloalcóxi, (C₃-C₈)-cicloalquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalcoxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₃-C₈)-

cicloalquil-(C₁-C₆)-haloalquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alcoxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-haloalcoxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalcoxicarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-halogenalquilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alcoxicarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-haloalcoxicarbonilóxi;

- (C₃-C₈)-cicloalquenila, (C₃-C₈)-cicloalquenilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-halogenalquila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alcóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-halogenalcóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalqueniloxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-halogenalquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alcoxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-haloalcoxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalqueniloxicarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alquilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-halogenalquilcarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-alcoxicarbonilóxi, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₆)-haloalcoxicarbonilóxi;

- hidróxi-(C₁-C₆)-alquila, hidróxi-(C₁-C₆)-alcóxi, ciano-(C₁-C₆)-alcóxi, ciano-(C₁-C₆)-alquila;

- (C₁-C₆)-alquilsulfonila, (C₁-C₆)-alquiltio, (C₁-C₆)-alquilsulfinila, (C₁-C₆)-haloalquilsulfonila, (C₁-C₆)-halogenalquiltio, (C₁-C₆)-halogenalquilsulfinila, (C₁-C₆)-alquilsulfonil-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquilsulfinil-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquilsulfonil-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquiltio-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquilsulfinil-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquilsulfonil-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alquilsulfinil-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-haloalquil sulfonil-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-haloalquiltio-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-haloalquilsulfinil-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alquil sulfonilóxi, (C₁-C₆)-halogenalquilsulfonilóxi,

(C₁-C₆)-alquiltiocarbonila, (C₁-C₆)-haloalquiltiocarbonila, (C₁-C₆)-alquiltiocarbonilóxi, (C₁-C₆)-haloalquiltiocarbonilóxi, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₁-C₆)-alquiltio-(C₁-C₆)-alquilcarbonilóxi, (C₄-C₁₄)-arilsulfonila, (C₆-C₁₄)-ariltio, (C₆-C₁₄)-arilsulfinila, (C₃-C₈)-cicloalquiltio, (C₃-C₈)-alqueniltio, (C₃-C₈)-cicloalqueniltio, (C₃-C₆)-alquiniltio;

- os radicais R¹ e R² juntamente formam um grupo (C₂-C₆)-alquilenos, que podem compreender um ou mais átomos de oxigênio e/ou de enxofre, onde o grupo (C₂-C₆)-alquilenos pode ser monossubstituído ou polissubstituído por halogênio e os substituintes halogênio respectivos podem ser iguais ou diferentes;

R³ é selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila e (C₁-C₆)-haloalquila;

R⁴ é selecionado do grupo que consiste em (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila, hidróxi, (C₁-C₆)-alcóxi e (C₁-C₆)-haloalcóxi;

R⁵ é selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila, hidróxi, (C₁-C₆)-alcóxi e (C₁-C₆)-haloalcóxi;

R⁴ ou R⁵, juntamente com o átomo de carbono ao qual estão ligados, formam um anel de três a sete membros;

R⁶ e R⁷ em cada caso independentemente um do outro são selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-halogenalcóxi, (C₆-C₁₄)-arila, (C₆-C₁₄)-arilóxi, (C₆-C₁₄)-arilcarbonila e (C₆-C₁₄)-ariloxicarbonila; ou os radicais R⁶ e R⁷ juntamente formam um grupo (C₂-C₇)-alquilenos, que pode compreender um ou mais átomos de oxigênio e/ou de enxofre, onde o grupo (C₂-C₇)-alquilenos pode ser monossubstituído ou polissubstituído por halogênio e os substituintes halogênio respectivos podem ser iguais ou diferentes,

R⁸, R⁹ e R¹¹, independentemente um do outro são, em cada

caso, selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, halogênio, ciano, nitro, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₁-C₆)-alquiloxycarbonila, (C₁-C₆)-alquilaminocarbonila, (C₁-C₆)-dialquilaminocarbonila, (C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-haloalcóxi, (C₂-C₆)-alquinila, (C₂-C₆)-halogenalquinila, (C₂-C₆)-alquinilcarbonila, (C₂-C₆)-haloalquinilcarbonila, (C₂-C₆)-alquinilóxi, (C₂-C₆)-haloalquinilóxi, (C₂-C₆)-alquiniloxycarbonila e (C₂-C₆)-halogenalquiniloxycarbonila;

R¹⁰ é selecionado do grupo consistindo em halogênio, ciano, nitro, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₁-C₆)-alquiloxycarbonila, (C₁-C₆)-alquilaminocarbonila, (C₁-C₆)-dialquilaminocarbonila, (C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-haloalcóxi, (C₂-C₆)-alquinila, (C₂-C₆)-halogenalquinila, (C₂-C₆)-alquinilcarbonila, (C₂-C₆)-haloalquinilcarbonila, (C₂-C₆)-alquinilóxi, (C₂-C₆)-haloalquinilóxi, (C₂-C₆)-alquiniloxycarbonila e (C₂-C₆)-halogenalquiniloxycarbonila; e

X representa uma ligação;

R¹² e R¹³, em cada caso, independentemente um do outro, são selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila e (C₁-C₆)-haloalquila,

R¹⁴ é selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila,

com a condição de que:

(a) pelo menos um radical de R¹, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ ou R¹¹ representa é diferente de hidrogênio caso R² seja CF₃,

(b) R² representa é diferente de cloro caso R¹ seja NH₂.

2. Compostos de Fórmula Geral (I), de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que o radical R¹ é selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, halogênio, ciano, C(=O)NH₂, NO₂, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila, (C₃-C₆)-ciclopropila, (C₁-C₆)-alcóxi,

(C₁-C₆)-tioalquila, (C₁-C₆)-alquiltio, (C₂-C₆)-alquinila, mono(C₁-C₆)-alquilamino, di(C₁-C₆)-alquilamino e tri(C₁-C₆)-alquilsilila-(C₂-C₆)-alquinila.

3. Compostos de Fórmula Geral (I), de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizado pelo fato de que o radical R² é selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, halogênio, (C₁-C₆)-alquilfenila, (C₆-C₁₄)-arila, que pode ser substituída no radical arila por (C₁-C₆)-alquila, (C₆-C₁₄)-haloalquila e/ou halogênio; C₆-aril-(C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alcóxi, (C₁-C₆)-alcóxi-(C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, que podem ser substituídas no radical cicloalquila por (C₁-C₆)-alquila, (C₆-C₁₄)-haloarila e/ou halogênio; 1-(C₁-C₆)-alquilciclopropila, 1-((C₁-C₆)-alquil-C₆-aril)ciclopropila, 1-(mono-halogenofenil)ciclopropila, 1-(di-halogenofenil)ciclopropila, mono(C₁-C₆)-alquilamino, di(C₁-C₆)-alquilamino, (C₁-C₆)-tioalquila, (C₁-C₆)-alquiltio, (C₁-C₆)-alcóxi e amino.

4. Compostos de Fórmula Geral (I), de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que R¹ e R², juntamente com os átomos de carbono aos quais eles estão ligados, formam um anel com cinco ou seis membros, o qual pode ser interrompido por um ou dois heteroátomos selecionados do grupo que consiste em oxigênio e enxofre.

5. Compostos de Fórmula Geral (I), de acordo com uma das reivindicações 1 a 4, caracterizado pelo fato de que o radical R³ representa hidrogênio ou (C₁-C₆)-alquila.

6. Compostos de Fórmula Geral (I), de acordo com uma das reivindicações 1 a 5, caracterizado pelo fato de que:

o radical R⁴ é selecionado do grupo que consiste em (C₁-C₆)-alquila, hidróxi, ciclopropila e (C₁-C₆)-alcoxi; e

o radical R⁵ é selecionado do grupo consistindo em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, hidróxi, ciclopropila e (C₁-C₆)-alcoxi.

7. Compostos de Fórmula Geral (I), de acordo com uma das reivindicações 1 a 5, caracterizado pelo fato de que os radicais R^4 e R^5 juntamente formam um grupo (C₁-C₇)-alquilenos que pode compreender um ou mais átomos de oxigênio e/ou de enxofre, onde o grupo (C₁-C₇)-alquilenos pode ser monossustituído ou polissustituído por halogênio, e os respectivos substituintes halogênio podem ser iguais ou diferentes.

8. Compostos de Fórmula Geral (I), de acordo com uma das reivindicações 1 a 7, caracterizado pelo fato de que os radicais R^6 e R^7 , independentemente um do outro, são selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila e (C₆-C₁₄)-arila.

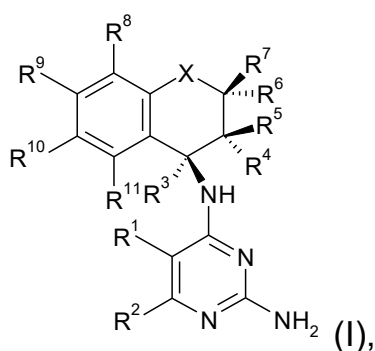
9. Compostos de Fórmula Geral (I), de acordo com uma das reivindicações 1 a 8, caracterizado pelo fato de que o radical R^8 é selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila e halogênio.

10. Compostos de Fórmula Geral (I), de acordo com uma das reivindicações 1 a 9, caracterizado pelo fato de que o radical R^9 é de preferência selecionado do grupo que consiste em hidrogênio e (C₁-C₆)-alquila.

11. Compostos de Fórmula Geral (I), de acordo com uma das reivindicações 1 a 10, caracterizado pelo fato de que o radical R^{10} é selecionado do grupo que consiste em (C₁-C₆)-alquila, di(C₁-C₆)-alquilamino, halogênio, (C₂-C₆)-alquenila, (C₂-C₆)-alquinila, (C₁-C₆)-alquil-(C₂-C₆)-alquinila, (C₁-C₆)-alcóxi-(C₁-C₆)-alquil-(C₂-C₆)-alquinila, ciano, (C₁-C₆)-alcoxicarbonila e aminocarbonila.

12. Compostos de Fórmula Geral (I), de acordo com uma das reivindicações 1 a 11, caracterizado pelo fato de que R^{11} é selecionado do grupo que consiste em hidrogênio e (C₁-C₆)-alquila.

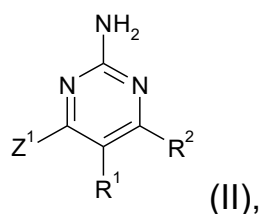
13. Processo para preparação de compostos opticamente ativos da Fórmula (I)



na qualos radicais R^1 a R^{11} e X apresentam os significados como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 12,

o referido processo sendo caracterizado pelo fato de que:

(1) um composto de Fórmula (II)

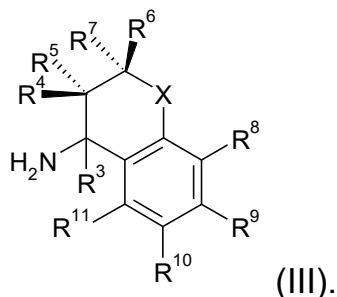


na qual

R^1 e R^2 apresentam os significados como definidos em uma das reivindicações 1 a 11, e

Z^1 representa um radical passível de troca ou um grupo de partida, tal como em particular cloro, triclорометилa, (C_1-C_4) -alquilsulfonila, fenil- (C_1-C_4) -alquilsulfonila ou (C_1-C_4) -alquilfenilsulfonila não substituídas ou substituídas,

são reagidas com uma amina de Fórmula (III), ou com um seu sal ácido de adição,



14. Composição herbicida ou reguladora do crescimento de plantas, caracterizado pelo fato de que compreende um ou mais com-

postos de Fórmula (I), ou seus sais, como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 12.

15. Processo para controle de plantas nocivas ou para regular o crescimento de plantas, caracterizado pelo fato de que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um ou mais compostos de Fórmula (I), ou seus sais, como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 12, a plantas, partes de plantas, sementes de plantas ou a uma área sob cultivo.

16. Uso dos compostos de Fórmula (I), ou de seus sais, como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 12, caracterizado pelo fato de que é como herbicidas ou reguladores do crescimento de plantas.

17. Uso, de acordo com a reivindicação 16, caracterizado pelo fato de que os compostos de Fórmula (I), ou seus sais, são empregados no controle de plantas nocivas ou para regular o crescimento de plantas em culturas de plantas úteis ou de plantas ornamentais.

18. Uso, de acordo com a reivindicação 17, caracterizado pelo fato de que as plantas de cultura são plantas de cultura transgênicas.

19. Uso, de acordo com a reivindicação 17 ou 18, caracterizado pelo fato de que as plantas de cultura são selecionadas de culturas de plantação.