



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

(11) PI 0817103-3 B1

(22) Data do Depósito: 12/09/2008

(45) Data de Concessão: 19/07/2016



* B R P I 0 8 1 7 1 0 3 B 1 *

(54) Título: COMPOSTO DE PIRIDAZINONA, HERBICIDA CONTENDO O MESMO, MÉTODO DE CONTROLE DE ERVA DANINHA, USO DO REFERIDO COMPOSTO, E SEU COMPOSTO INTERMEDIÁRIO

(51) Int.Cl.: C07D 237/16; A01N 43/58

(30) Prioridade Unionista: 14/09/2007 JP 2007-239162

(73) Titular(es): SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED

(72) Inventor(es): TAKAFUMI FUSAKA

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**COMPOSTO DE PIRIDAZINONA, HERBICIDA CONTENDO O MESMO, MÉTODO DE CONTROLE DE ERVA DANINHA, USO DO REFERIDO COMPOSTO, E SEU COMPOSTO INTERMEDIÁRIO**".

5 Campo Técnico

A presente invenção refere-se a um composto de piridazinona e a um herbicida contendo o mesmo.

Técnica Antecedente

10 O desenvolvimento de compostos que podem ser usados como os ingredientes ativos de herbicidas para controle de erva daninha tem sido amplamente avançado, e alguns compostos tendo um efeito de controle de erva daninha têm sido encontrados.

Um certo tipo de composto de piridazinona é conhecido em J. Heterocycl. Chem., vol. 42, pp. 427-435 (2005).

15 Contudo, o referido composto de piridazinona não tem suficiente efeito de controle de erva daninha.

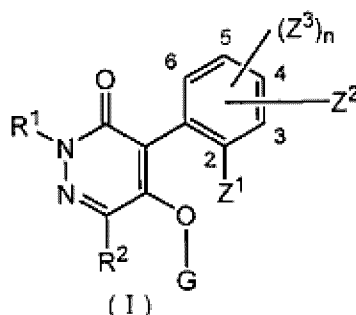
Descrição da Invenção

Um objetivo da presente invenção é proporcionar um composto tendo um excelente efeito de controle de erva daninha.

20 Após investigação extensiva, o presente inventor verificou que um composto de piridazinona representado pela seguinte fórmula (I) tem um excelente efeito de controle de erva daninha. Desse modo, a presente invenção foi completada.

A presente invenção proporciona:

25 (1) um composto de piridazinona representado pela fórmula (I) (daqui por diante referida como o composto da presente invenção):

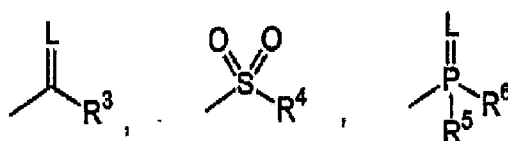


no qual

R^1 representa um grupo C_{1-6} alquila ou um grupo (C_{1-6} alquiloxi)
 C_{1-6} alquila;

R^2 representa um átomo de hidrogênio ou um grupo C_{1-6} alquila;

5 G representa um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



[no qual L representa um átomo de oxigênio ou de enxofre,

R^3 representa um grupo C_{1-6} alquila, um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{2-6} alquenila, um grupo C_{2-6} alquinila, um grupo C_{6-10} arila, um grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquila, um grupo C_{1-6} alquilóxi, um grupo C_{3-8} cicloalquilóxi, um grupo C_{2-6} alquenilóxi, um grupo C_{3-6} alquinilóxi, um grupo C_{6-10} arilóxi, um grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquilóxi, um grupo di (C_{1-6} alquil) amino, um grupo di (C_{2-6} alquenil) amino, um grupo (C_{1-6} alquil) (C_{6-10} aril) amino ou um grupo heterocíclico contendo nitrogênio de 3 a 8 membros,

15 R^4 representa um grupo C_{1-6} alquila, um grupo C_{6-10} arila ou um grupo di (C_{1-6} alquil) amino, e

R^5 e R^6 podem ser os mesmos como ou diferentes um do outro, e representam um grupo C_{1-6} alquila, um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{2-6} alquenila, um grupo C_{6-10} arila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{3-8} cicloalquiloxi, um grupo C_{5-10} ariloxi, um grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquiloxi; um grupo C_{1-6} alquiltio ou um grupo di(C_{1-6} alquil) amino, no qual qualquer grupo representado por R^3 , R^4 , R^5 e R^6 pode ser substituído com pelo menos um átomo de halogênio, e o grupo C_{3-8} cicloalquila, o grupo C_{6-10} arila, a porção arila do grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquila, o grupo C_{3-8} cicloalquiloxi, o grupo C_{6-10} ariloxi, a porção arila do grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquiloxi, a porção arila do grupo (C_{1-6} alquil) (C_{6-10} aril) amino e o grupo heterocíclico contendo nitrogênio de 3 a 8 membros podem ser substituídos com pelo menos um grupo C_{1-6} alquila;

Z^1 representa um grupo C_{1-6} alquila ou um grupo C_{1-6} alquiloxi;

Z^2 representa um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{2-6} alquinila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{1-6} haloalquila, um grupo C_{1-6} haloalquiloxi, um átomo de halogênio, um grupo C_{6-10} arila, um grupo heteroarila de 5 ou 6 membros, um grupo ciano ou um grupo nitro, e

5 Z^3 representa um grupo C_{1-6} alquila, um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{2-6} alquinila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{1-6} haloalquila, um grupo C_{1-6} haloalquiloxi, um átomo de halogênio, um grupo C_{6-10} arila, um grupo heteroarila de 5 ou 6 membros, um grupo ciano ou um grupo nitro,

em que o grupo C_{3-8} cicloalquila, o grupo C_{6-10} arila e o grupo
10 heteroarila de 5 ou 6 membros representado por Z^2 e Z^3 podem ser substituídos com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo C_{1-6} alquila; e

n representa 0, 1, 2 ou 3, e quando n for 2 ou 3, cada um de Z^3 possa ser o mesmo que ou diferente um do outro.

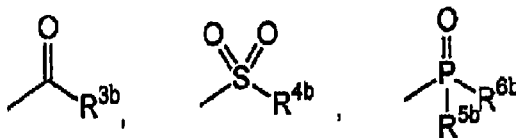
15 (2) o composto de piridazinona de acordo com o (1) acima, em que n é 1, 2 ou 3;

(3) o composto de piridazinona de acordo com o (1) ou (2) acima, em que Z^2 é fixado à posição 4 ou 6 no anel benzeno;

(4) o composto de piridazinona de acordo com qualquer um dos
20 (1) a (3) acima, em que n é 1, e Z^2 e Z^3 são respectivamente fixados às posições 4 e 6 ou às posições 6 e 4 no anel benzeno;

(5) o composto de piridazinona de acordo com qualquer um dos
25 (1) a (4) acima, em que Z^1 representa um grupo C_{1-3} alquila, Z^2 representa um grupo C_{3-6} cicloalquila, um grupo C_{2-3} alquinila, um grupo C_{1-3} alquiloxi, um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo fenila que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo C_{1-3} alquila, e Z^3 representa um grupo C_{1-3} alquila, um grupo C_{3-6} cicloalquila, um grupo C_{2-3} alquinila, um grupo C_{1-3} alquiloxi ou um átomo de halogênio.

30 (6) o composto de piridazinona de acordo com qualquer um dos (1) a (5) acima, em que G representa um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



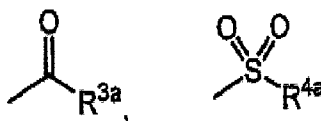
(em que R^{3b} representa um grupo C_{1-6} alquila, um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{2-6} alquenila, um grupo C_{2-6} alquinila, um grupo C_{6-10} arila, um grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{3-8} cicloalquiloxi, um grupo C_{6-10} ariloxi, um grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquiloxi ou um grupo di(C_{1-6} alquil) amino,

R^{4b} representa um grupo C_{1-6} alquila ou um grupo C_{6-10} arila, e

R^{5b} e R^{6b} podem ser os mesmos que ou diferentes um do outro, e representam um grupo C_{1-6} alquila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{6-10} ariloxi ou um grupo C_{1-6} alquiltio,

10 em que qualquer grupo representado por R^{3b} , R^{4b} , R^{5b} e R^{6b} pode ser substituído com pelo menos um átomo de halogênio, e o grupo C_{3-8} cicloalquila, o grupo C_{6-10} arila, a porção arila do grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquila, o grupo C_{3-8} cicloalquiloxi, o grupo C_{6-10} ariloxi, e a porção arila do grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquiloxi podem ser substituídos com pelo menos um grupo C_{1-6} alquila);

15 (7) o composto de piridazinona de acordo com qualquer um dos (1) a (5) acima, em que G representa um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



(em que R^{3a} representa um grupo C_{1-6} alquila, um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{6-10} arila, um grupo C_{1-6} alquiloxi ou um grupo di(C_{1-6} alquil) amino, e

20 R^{4a} representa um grupo C_{1-6} alquila, em que qualquer grupo representado por R^{3a} e R^{4a} pode ser substituído com pelo menos um átomo de halogênio, e o grupo C_{3-8} cicloalquila e o grupo C_{6-10} arila podem ser substituídos com pelo menos um grupo C_{1-6} alquila);

25 (8) o composto de piridazinona de acordo com qualquer um dos (1) a (7) acima, em que R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo C_{1-3} alqui-

la;

(9) o composto de piridazinona de acordo com qualquer um dos (1) a (7) acima, em que R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila;

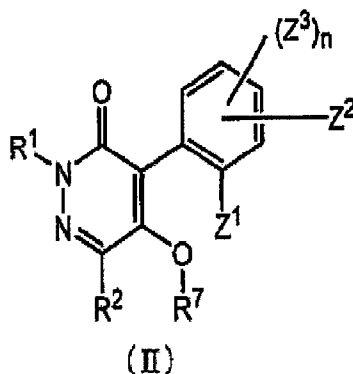
(10) o composto de piridazinona de acordo com qualquer um dos (1) a (9) acima, em que R^1 é um grupo C_{1-3} alquila ou um grupo (C_{1-3} alquiloxi) C_{1-3} alquila;

(11) um herbicida compreendendo o composto de piridazinona de acordo com qual quer um dos (1) a (10) acima como um ingrediente ativo;

(12) um método de controle de erva daninha que compreende aplicar uma quantidade eficaz do composto de piridazinona de acordo com qualquer um dos (1) a (10) acima a ervas daninhas ou solo onde ervas daninhas são desenvolvidas;

(13) uso do composto de piridazinona de acordo com qualquer dos (1) a (10) acima para controle de erva daninha;

(14) um composto representado pela fórmula (II):



em que

R^7 representa um grupo C_{1-6} alquila;

R^1 representa um grupo C_{1-6} alquila ou um grupo (C_{1-6} alquiloxi) C_{1-6} alquila;

R^2 representa um átomo de hidrogênio ou um grupo C_{1-6} alquila;

Z^1 representa um grupo C_{1-6} alquila ou um grupo C_{1-6} alquiloxi;

Z^2 representa um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{2-6} alquinila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{1-6} haloalquila, um grupo C_{1-6} haloalquiloxi, um átomo de halogênio, um grupo C_{6-10} arila, um grupo heteroarila de 5 ou 6 membros, um grupo ciano ou um grupo nitro, e

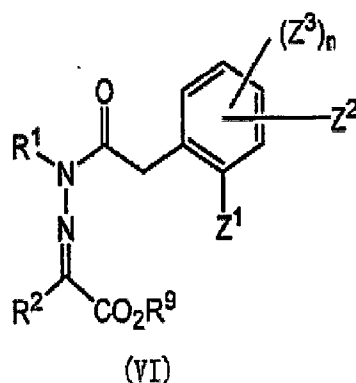
Z^3 representa um grupo C_{1-6} alquila, um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{2-6} alquinila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{1-6} haloalquila, um grupo C_{1-6} haloalquiloxi, um átomo de halogênio, um grupo C_{6-10} arila, um grupo heteroarila de 5 ou 6 membros, um grupo ciano ou um grupo nitro, em

5 que o grupo C_{3-8} cicloalquila, o grupo C_{6-10} arila e o grupo heteroarila de 5 ou 6 membros representados por Z^2 e Z^3 podem ser substituídos com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo C_{1-6} alquila; e

n representa 0, 1, 2 ou 3, e quando n for 2 ou 3, cada um de Z^3

10 possa ser o mesmo que ou diferente um do outro;

(15) um composto representado pela fórmula (VI):



em que

R^9 representa um grupo C_{1-6} alquila;

R^1 representa um grupo C_{1-6} alquila ou um grupo (C_{1-6} alquiloxi)

15 C_{1-6} alquila;

R^2 representa um átomo de hidrogênio ou um grupo C_{1-6} alquila;

Z^1 representa um grupo C_{1-6} alquila ou um grupo C_{1-6} alquiloxi;

Z^2 representa um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{2-6} alquinila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{1-6} haloalquila, um grupo C_{1-6} haloalquiloxi, um átomo de halogênio, um grupo C_{6-10} arila, um grupo heteroarila de 5

20 ou 6 membros, um grupo ciano ou um grupo nitro, e

Z^3 representa um grupo C_{1-6} alquila, um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{2-6} alquinila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{1-6} haloalquila, um grupo C_{1-6} haloalquiloxi, um átomo de halogênio, um grupo C_{6-10} arila, um

grupo heteroarila de 5 ou 6 membros, um grupo ciano ou um grupo nitro,

em que o grupo C_{3-8} cicloalquila, o grupo C_{6-10} arila e o grupo heteroarila de 5 ou 6 membros representado por Z^2 e Z^3 podem ser substituídos com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em

5 um átomo de halogênio e um grupo C_{1-6} alquila; e

n representa 0, 1, 2 ou 3, e quando n for 2 ou 3, cada um de Z^3 possa ser o mesmo que ou diferente um do outro.

O composto da presente invenção pode estar na forma de um sal agricolamente aceitável que é produzido por mistura de um composto de
 10 piridazinona representado pela fórmula (I) com uma base inorgânica ou similar. A presente invenção também inclui tais sais do composto de piridazinona.

O composto da presente invenção tem um efeito de controle de erva daninha.

15 Melhor Modo de Realizar a Invenção

O termo "grupo C_{1-6} alquila", conforme aqui usado, significa um grupo alquila de 1 a 6 átomos de carbono, e exemplos destes incluem metila, etila, propila, isopropila, butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, pentila, sec-pentila, isopentila, neopentila, hexila e iso-hexila.

20 O termo "grupo C_{3-8} cicloalquila", conforme aqui usado, significa um grupo cicloalquila de 3 a 8 átomos de carbono, e exemplos destes incluem ciclopropila, ciclopentila e ciclo-hexila.

O termo "grupo C_{2-6} alquenila", conforme aqui usado, significa um grupo alquenila de 2 a 6 átomos de carbono, e exemplos destes incluem
 25 alila, 1-buten-3-ila e 3-buten-1-ila.

O termo "grupo C_{2-6} alquinila", conforme aqui usado, significa um grupo alquinila de 2 a 6 átomos de carbono, e exemplos destes incluem propargila e 2-butinila.

O termo "grupo C_{6-10} arila", conforme aqui usado, significa um
 30 grupo arila de 6 a 10 átomos de carbono, e exemplos destes incluem fenila e naftila.

O termo "grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquila", conforme aqui usado,

significa um grupo C_{1-6} alquila substituído com um grupo C_{6-10} arila, e exemplos destes incluem benzila e fenetila.

O termo "grupo C_{1-6} alquiloxi", conforme aqui usado, significa um grupo alquiloxi de 1 a 6 átomos de carbono, e exemplos destes incluem metóxi, etóxi, propóxi e isopropóxi.

O termo "grupo C_{3-8} cicloalquiloxi", conforme aqui usado, significa um grupo cicloalquiloxi de 3 a 8 átomos de carbono, e exemplos destes incluem ciclopropilóxi e ciclopentilóxi.

O termo "grupo C_{2-6} alqueniloxi", conforme aqui usado, significa um grupo alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, e exemplos destes incluem vinilóxi e alilóxi.

O termo "grupo C_{3-6} alquiniloxi", conforme aqui usado, significa um grupo alquiniloxi de 3 a 6 átomos de carbono, e exemplos destes incluem propargiloxi e 2-butinilóxi.

O termo "grupo C_{6-10} ariloxi", conforme aqui usado, significa um grupo ariloxi de 6 a 10 átomos de carbono, e exemplos destes incluem fenoxi e naftilóxi.

O termo "grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquiloxi", conforme aqui usado, significa um grupo C_{1-6} alquiloxi substituído com um grupo C_{6-10} arila, e exemplos destes incluem benziloxi e fenetilóxi.

O termo "grupo di(C_{1-6} alquil) amino", conforme aqui usado, significa um grupo amino substituído com dois grupos C_{1-6} alquila iguais ou diferentes, e exemplos destes incluem dimetilamino, dietilamino e N-etil-N-metilamino.

O termo "grupo di(C_{2-6} alquenil) amino", conforme aqui usado, significa um grupo amino substituído com dois grupos C_{2-6} alquenila iguais ou diferentes, e exemplos destes incluem dialilamino e di(3-butenil) amino.

O termo "grupo (C_{1-6} alquil) (C_{6-10} aril) amino", conforme aqui usado, significa um grupo amino substituído com um grupo C_{1-6} alquila e um grupo C_{6-10} arila, e exemplos destes incluem metilfenilamino e etilfenilamino.

O termo "grupo C_{1-6} alquiltio", conforme aqui usado, significa um grupo alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, e exemplos destes incluem me-

tiltio, etiltio, propiltio e isopropiltio.

O termo "grupo (C_{1-6} alquiloxi) C_{1-6} alquila", conforme aqui usado, significa um grupo C_{1-6} alquila substituído com um grupo C_{1-6} alquiloxi, e exemplos destes incluem metoxietila e etoxietila.

5 O termo "grupo heterocíclico contendo nitrogênio de 3 a 8 membros", conforme aqui usado, significa um grupo heterocíclico aromático ou alicíclico de 3 a 8 membros contendo 1 a 3 átomos de nitrogênio e opcionalmente contendo 1 a 3 átomos de oxigênio e/ou átomos de enxofre, e exemplos destes incluem 1-pirazolila, 2-piridila, 2-pirimidinila, 2-tiazolila, pirro-
10 lidino, piperidino e morfolino.

O termo "grupo heterorila de 5 ou 6 membros", conforme aqui usado, significa um grupo heterocíclico aromático de 5 ou 6 membros contendo 1 a 3 heteroátomos selecionados de átomos de nitrogênio, oxigênio e enxofre, e exemplos destes incluem 3-piridila, 3-tienila e 1-pirazolila.

15 Exemplos do átomo de halogênio, conforme aqui usado, incluem átomos de flúor, cloro, bromo e iodo.

O "grupo C_{1-6} haloalquila" representado por Z^2 e Z^3 significa um grupo C_{1-6} alquila substituído com um átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo, átomo de iodo ou similares, e exemplos destes incluem trifluoro-
20 metila e 2,2,2-tricloroetila.

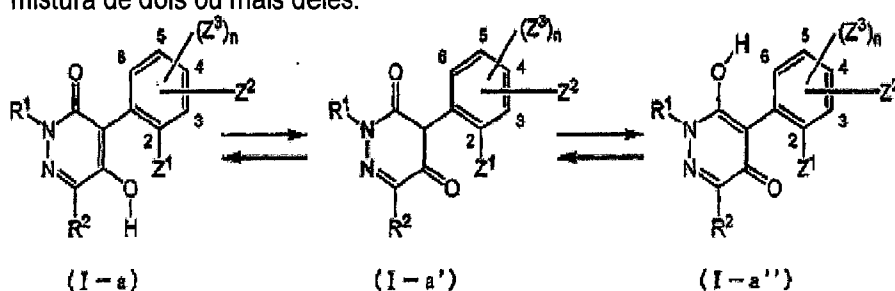
O "grupo C_{1-6} haloalquiloxi" representado por Z^2 e Z^3 significa um grupo C_{1-6} alquiloxi substituído com um átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo, átomo de iodo ou similares, e exemplos destes incluem trifluorometoxi e 2,2,2-trifluoroetóxi.

25 Entre grupos representados por R^3 , R^4 , R^5 e R^6 , o grupo C_{3-8} cicloalquila, o grupo C_{6-10} arila, a porção arila do grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquila, o grupo C_{3-8} cicloalquiloxi, o grupo C_{6-10} ariloxi, a porção arila do grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquiloxi, a porção arila do grupo (C_{1-6} alquil) (C_{6-10} aril) amino e o grupo heterocíclico contendo nitrogênio de 3 a 8 membros podem ser substituídos com pelo menos um grupo C_{1-6} alquila. Exemplos do grupo C_{1-6} alqui-
30 la tal como um substituinte incluem metila, etila, propila e butila.

Dentre grupos representados por Z^2 e Z^3 , o grupo C_{3-8} cicloalqui-

la, o grupo C₆₋₁₀ arila e o grupo heteroarila de 5 ou 6 membros podem ser substituídos com pelo menos um grupo C₁₋₆ alquila. Exemplos do grupo C₁₋₆ alquila tal como um substituinte incluem metila, etila, propila e butila.

Um composto representado pela fórmula (I-a), que é o composto da presente invenção em que G é um átomo de hidrogênio, pode existir em uma forma de tautômeros representada pelas fórmulas (I-a') e (I-a''). O composto representado pela fórmula (I-a) inclui todos de tais tautômeros e uma mistura de dois ou mais deles.



O composto representado pela fórmula (I-a) pode estar na forma de um sal agricolamente aceitável que é produzido por ser misturado com uma base inorgânica (por exemplo, hidróxido, carbonato, hidrogenocarbonato, acetato, ou hidreto de um metal alcalino (lítio, sódio, potássio, etc.); hidróxido ou hidreto de um metal alcalinoterroso (magnésio, cálcio, bário, etc.); amônia), uma base orgânica (por exemplo, dimetilamina, trietilamina, piperazina, pirrolidina, piperidina, 2-feniletilamina, benzilamina, etanolamina, dietanolamina, piridina, ou colidina), ou um alcóxido de metal (por exemplo, metóxido de sódio, terc-butóxido de potássio, ou metóxido de magnésio). O composto representado pela fórmula (I-a) inclui tais sais agricolamente aceitáveis do composto de piridazinona.

Quando o composto da presente invenção tem um ou mais centros assimétricos, existem dois ou mais estereoisômeros (por exemplo, enantiômero e diastereômero) do composto da presente invenção. O composto da presente invenção inclui todos tais estereoisômeros e uma mistura de dois ou mais deles.

Quando o composto da presente invenção tem isomerismo geométrico baseado em uma dupla ligação ou similares, existem dois ou mais isômeros geométricos (por exemplo, E/Z ou isômeros trans/cis, e isômeros

S-trans/S-cis) do composto da presente invenção. O composto da presente invenção inclui todos tais isômeros geométricos e uma mistura de dois ou mais deles.

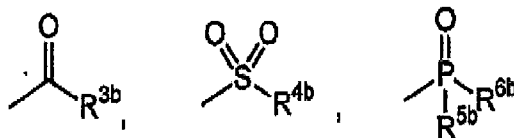
Exemplos preferidos do composto da presente invenção incluem os seguintes compostos.

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que n é 1, 2 ou 3.

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que Z^2 é fixado à posição 4 ou 6 no anel benzeno.

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que n é 1, e Z^2 e Z^3 são respectivamente fixado às posições 4 e 6 ou às posições 6 e 4 no anel benzeno.

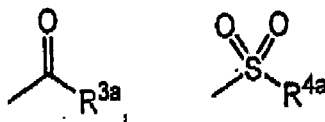
Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



(em que R^{3b} representa um grupo C_{1-6} alquila, um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{2-6} alquenila, um grupo C_{2-6} alquinila, um grupo C_{6-10} arila, um grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{3-8} cicloalquiloxi, um grupo C_{6-10} ariloxi, um grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquiloxi ou um grupo di (C_{1-6} alquil) amino;

R^{4b} representa um grupo C_{1-6} alquila ou um grupo C_{5-10} arila; e R^{5b} e R^{6b} podem ser os mesmos que ou diferentes um do outro, e representam um grupo C_{1-6} alquila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{6-10} ariloxi ou um grupo C_{1-6} alquiltio, em que qualquer grupo representado por R^{3b} , R^{4b} , R^{5b} e R^{6b} pode ser substituído com pelo menos um átomo de halogênio, e o grupo C_{3-8} cicloalquila, o grupo C_{6-10} arila, a porção arila do grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquila, o grupo C_{3-8} cicloalquiloxi, o grupo C_{6-10} ariloxi e a porção arila do grupo (C_{6-10} aril) C_{1-6} alquiloxi podem ser substituídos com pelo menos um grupo C_{1-6} alquila).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



(em que R^{3a} representa um grupo C₁₋₆ alquila, um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₆₋₁₀ arila, um grupo C₁₋₆ alquiloxi ou um grupo di (C₁₋₆ alquil) amino; e R^{4a} representa um grupo C₁₋₆ alquila, em que qualquer grupo representado por R^{3a} e R^{4a} pode ser substituído com pelo menos um átomo de halogênio, e o grupo C₃₋₈ cicloalquila e o grupo C₆₋₁₀ arila podem ser substituídos com pelo menos um grupo C₁₋₆ alquila).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R¹ é um grupo C₁₋₃ alquila ou um grupo (C₁₋₃ alquiloxi) C₁₋₃ alquila.

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R² é um átomo de hidrogênio ou um grupo C₁₋₃ alquila.

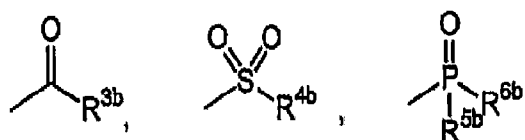
Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R² é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila.

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que Z¹ é um grupo C₁₋₃ alquila, Z² é um grupo C₃₋₆ cicloalquila, um grupo C₂₋₃ alquinila, um grupo C₁₋₃ alquiloxi, um grupo C₁₋₃ haloalquila, um grupo C₁₋₃ haloalquiloxi, um átomo de halogênio, um grupo ciano ou um grupo nitro, ou um grupo fenil que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo C₁₋₃ alquila, e Z³ é um grupo C₁₋₃ alquila, um grupo C₃₋₆ cicloalquila, um grupo C₂₋₃ alquinila, um grupo C₁₋₃ alquiloxi ou um átomo de halogênio.

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R¹ é um grupo C₁₋₃ alquila ou um grupo (C₁₋₃ alquiloxi) C₁₋₃ alquila, e R² é um átomo de hidrogênio ou grupo C₃₋₃ alquila.

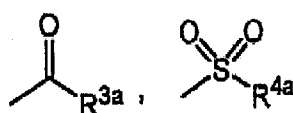
Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R¹ é a um grupo C₁₋₃ alquila ou um grupo (C₁₋₃ alquiloxi) C₁₋₃ alquila, e R² é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila.

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo C_{1-3} alquila, e G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



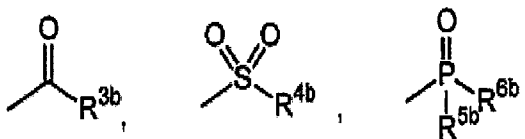
- 5 (em que R^{3b} , R^{4b} , R^{5b} e R^{6b} são conforme definidos acima).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo C_{1-3} alquila, e G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



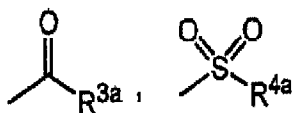
- 10 (em que R^{3a} e R^{4a} são conforme definidos acima).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, e G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



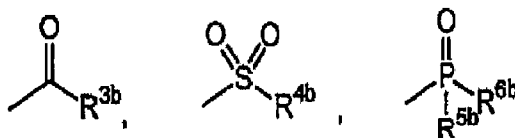
- 15 (em que R^{3b} , R^{4b} , R^{5b} e R^{6b} são conforme definidos acima).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, e G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



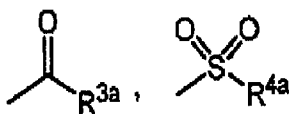
em que R^{3a} e R^{4a} são conforme definidos acima).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo C_{1-3} alquila ou um grupo (C_{1-3} alquiloxi) C_{1-3} alquila, R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo C_{1-3} alquila, e G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



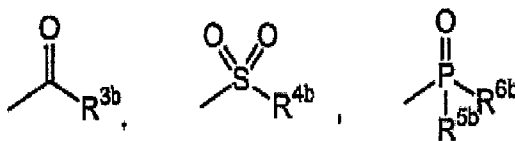
(em que R^{3b} , R^{4b} , R^{5b} e R^{6b} são conforme definidos acima).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo C_{1-3} alquila ou um grupo (C_{1-3} alquiloxi) C_{1-3} alquila, R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo C_{1-3} alquila, e G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



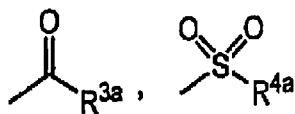
(em que R^{3a} e R^{4a} são conforme definidos acima).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo C_{1-3} alquila ou um grupo (C_{1-3} alquiloxi) C_{1-3} alquila, R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, e G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



(em que R^{3b} , R^{4b} , R^{5b} e R^{6b} são conforme definidos acima).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo C_{1-3} alquila ou um grupo (C_{1-3} alquiloxi) C_{1-3} alquila, R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, e G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:

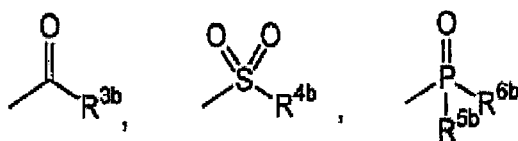


(em que R^{3a} e R^{4a} são conforme definidos acima).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R¹ é um grupo C₃₋₃ alquila ou um grupo (C₁₋₃ alquiloxi) C₁₋₃ alquila, R² é um átomo de hidrogênio ou um grupo C₁₋₃ alquila, n é 1, Z² e Z³ são respectivamente fixados às posições 4 e 6 ou às posições 6 e 4 no anel benzeno, Z¹ é um grupo C₁₋₆ alquila (mais preferivelmente um grupo C₁₋₃ alquila), Z² é um grupo C₃₋₈ cicloalquila (mais preferivelmente um grupo C₃₋₆ cicloalquila), um grupo C₂₋₆ alquinila (mais preferivelmente um grupo C₂₋₃ alquinila), um grupo C₁₋₆ alquiloxi (mais preferivelmente um grupo C₁₋₃ alquiloxi), um grupo C₁₋₆ haloalquila (mais preferivelmente um grupo C₁₋₃ haloalquila), um grupo C₁₋₆ haloalquiloxi (mais preferivelmente um grupo C₁₋₃ haloalquiloxi), um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo C₆₋₁₀ arila (mais preferivelmente um grupo fenila) que podem ser substituídos com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo C₁₋₆ alquila (mais preferivelmente um grupo C₁₋₃ alquila), e

Z³ é um grupo C₁₋₆ alquila (mais preferivelmente um grupo C₁₋₃ alquila), um grupo C₃₋₈ cicloalquila (mais preferivelmente um grupo C₃₋₆ cicloalquila), um grupo C₂₋₆ alquinila (mais preferivelmente um grupo C₂₋₃ alquinila), um grupo C₁₋₆ alquiloxi (mais preferivelmente um grupo C₁₋₃ alquiloxi) ou um átomo de halogênio.

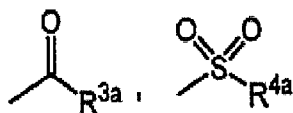
Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R¹ é um grupo C₁₋₃ alquila ou um grupo (C₁₋₃ alquiloxi) C₁₋₃ alquila, R² é um átomo de hidrogênio ou um grupo C₁₋₃ alquila, G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



em que R^{3b} , R^{4b} , R^{5b} e R^{6b} são conforme definidos acima), n é 1, Z^2 e Z^3 são respectivamente fixados às posições 4 e 6 ou às posições 6 e 4 no anel benzeno, Z^1 é um grupo C_{1-6} alquila (mais preferivelmente um grupo C_{1-3} alquila), Z^2 é um grupo C_{3-8} cicloalquila (mais preferivelmente um grupo C_{3-6} cicloalquila), um grupo C_{2-6} alquinila (mais preferivelmente um grupo C_{2-3} alquinila), um grupo C_{1-6} alquiloxi (mais preferivelmente um grupo C_{1-3} alquiloxi), um grupo C_{1-6} haloalquila (mais preferivelmente um grupo C_{1-3} haloalquila), um grupo C_{1-6} haloalquiloxi (mais preferivelmente um grupo C_{1-3} haloalquiloxi), um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo C_{6-10} arila (mais preferivelmente um grupo fenila) que podem ser substituídos com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em átomo de halogênio e um grupo C_{1-6} alquila (mais preferivelmente um grupo C_{1-3} alquila), e

Z^3 é um grupo C_{1-6} alquila (mais preferivelmente um grupo C_{3-3} alquila), um grupo C_{3-8} cicloalquila (mais preferivelmente um grupo C_{3-6} cicloalquila), um grupo C_{2-6} alquinila (mais preferivelmente um grupo C_{2-3} alquinila), um grupo C_{1-6} alquiloxi (mais preferivelmente um grupo C_{1-3} alquiloxi) ou um átomo de halogênio.

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo C_{1-3} alquila ou um grupo (C_{1-3} alquiloxi) C_{1-3} alquila, R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo C_{1-3} alquila, G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



(em que R^{3a} e R^{4a} são conforme definidos acima),

n é 1, Z^2 e Z^3 são respectivamente fixados às posições 4- e 6- ou às posições 6 e 4 no anel benzeno, Z^1 é um grupo alquila C_{1-5} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}), Z^2 é um grupo cicloalquila C_{3-8} (mais preferivelmente um grupo cicloalquila C_{3-6}), um grupo alquinila C_{2-6} (mais preferivelmente um grupo alquinila C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquiloxi C_{1-3}), um grupo haloalquila C_{1-6} (mais preferivel-

mente um grupo haloalquila C₁₋₃), um grupo haloalquiloxi C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo haloalquiloxi C₁₋₃), um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo arila C₆₋₁₀ (mais preferivelmente grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquila C₁₋₃), e

Z³ é um grupo alquila C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquila C₁₋₃), um grupo cicloalquila C₃₋₈ (mais preferivelmente um grupo cicloalquila C₃₋₆), um grupo alquinila C₂₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquinila C₂₋₃), um grupo alquiloxi C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquiloxi C₃₋₃) ou um átomo de halogênio. Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R¹ é um grupo alquila C₁₋₃ ou um grupo alquiloxi C₁₋₃) grupo alquila C₁₋₃, R² é um átomo de hidrogênio ou a grupo metila, n é 1, Z² e Z³ são respectivamente fixados às posições 4- e 6 ou às posições 6 e 4 no

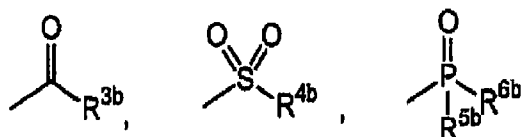
anel benzeno,

Z¹ é um grupo alquila C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquila C₁₋₃), Z² é um grupo cicloalquila C₃₋₈ (mais preferivelmente um grupo cicloalquila C₃₋₆), um grupo alquinila C₂₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquinila C₂₋₃), um grupo alquiloxi C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquiloxi C₁₋₃), um grupo haloalquila C₁₋₅ (mais preferivelmente um grupo haloalquila C₁₋₃), um grupo haloalquiloxi C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo haloalquiloxi C₃₋₃), um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo arila C₆₋₁₀ (mais preferivelmente um grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquila C₁₋₃), e

Z³ é um grupo alquila C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquila C₁₋₃), um grupo cicloalquila C₃₋₈ (mais preferivelmente um grupo cicloalquila C₃₋₆), um grupo alquinila C₂₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquinila C₂₋₃), um grupo alquiloxi C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquiloxi C₁₋₃) ou um átomo de halogênio.

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em

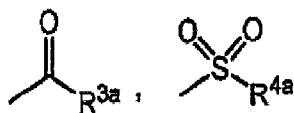
que R^1 é um grupo alquila C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquila C_{1-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



(em que R^{3b} , R^{4b} , R^{5b} e R^{6b} são conforme definidos acima), n é 1, Z^2 e Z^3 são
 5 respectivamente fixados às posições 4- e 6-ou às posições 6 e 4 no anel benzeno, Z^1 é um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}), Z^2 é um grupo cicloalquila C_{3-8} (mais preferivelmente um grupo cicloalquila C_{3-6}), um grupo alquinila C_{2-6} (mais preferivelmente um grupo alquinila C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquiloxi C_{1-3}),
 10 um grupo haloalquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo haloalquila C_{1-3}), um grupo haloalquiloxi C_{1-5} (mais preferivelmente um grupo haloalquiloxi C_{1-3}), um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo arila C_{6-10} (mais preferivelmente um grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um
 15 átomo de halogênio e um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}), e

Z^3 é um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}), um grupo cicloalquila C_{3-8} (mais preferivelmente um grupo cicloalquila C_{3-6}), um grupo alquinila C_{2-6} (mais preferivelmente um grupo alquinila C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquiloxi C_{1-3}) ou
 20 um átomo de halogênio.

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo alquila C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquila C_{1-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, G é um átomo de hidrogênio ou
 25 um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



em que R^{3a} e R^{4a} são conforme definidos acima),

n é 1, Z^2 e Z^3 são respectivamente fixados às posições 4- e 6- ou às posições 6 e 4 no anel benzeno, Z^1 é um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}), Z^2 é um grupo cicloalquila C_{3-8} (mais preferivelmente um grupo cicloalquila C_{3-6}), um grupo alquinila C_{2-6} (mais preferivelmente um grupo alquinila C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquiloxi C_{1-3}), um grupo haloalquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo haloalquila C_{1-3}), um grupo haloalquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo haloalquiloxi C_{1-3}), um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo arila C_{6-10} (mais preferivelmente um grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}), e

Z^3 é um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}), um grupo cicloalquila C_{3-8} (mais preferivelmente um grupo cicloalquila C_{3-6}), um grupo alquinila C_{2-6} (mais preferivelmente um grupo alquinila C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquiloxi C_{1-3}) ou um átomo de halogênio.

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que n é 0 e Z^2 é fixado à posição 5- no anel benzeno.

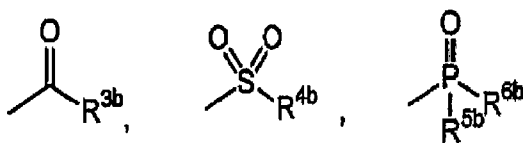
A composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo alquila C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquila C_{1-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C_{1-3} , n é 0, Z^2 é fixado à posição 5 no anel benzeno,

Z^1 é um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}), e

Z^2 é um grupo arila C_{6-10} (mais preferivelmente um grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo alquila C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquila C_{1-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C_{1-3} , G é um átomo de hidro-

gênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



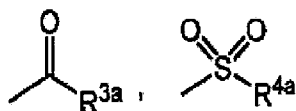
(em que R^{3b} , R^{4b} , R^{5b} e R^{6b} são conforme definidos acima), n é 0, Z^2 é fixado à posição 5 no anel benzeno,

5 Z^1 é a um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}),

e

10 Z^2 é um grupo arila C_{6-10} (mais preferivelmente um grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo alquila C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquila C_{1-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C_{1-3} , G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



15 (em que R^{3a} e R^{4a} são conforme definidos acima),

n é 0, Z^2 é fixado à posição 5 no anel benzeno,

Z^1 é um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}),

e

20 Z^2 é um grupo arila C_{6-10} (mais preferivelmente um grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}).

25 Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo alquila C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquila C_{1-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, n é 0, Z^2 é fixado à posição 5

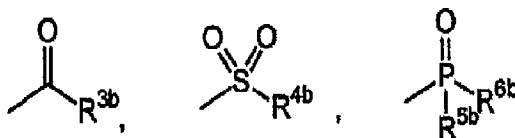
no anel benzeno,

Z^1 é um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}),

e

- 5 Z^2 é um grupo arila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}).

- 10 Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo alquila C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquila C_{1-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



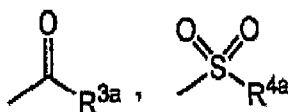
(em que R^{3b} , R^{4b} , R^{5b} e R^{6b} são conforme definidos acima),

n é 0, Z^2 é fixado à posição 5 no anel benzeno,

- 15 Z^1 é um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}), e

- 20 Z^2 é um grupo arila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquila C_{1-3}).

Um composto de piridazinona representado pela fórmula (I), em que R^1 é um grupo alquila C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquila C_{1-3} , R é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, G é um átomo de hidrogênio ou um grupo representado por qualquer uma das seguintes fórmulas:



- 25 (em que R^{3a} e R^{4a} são conforme definidos acima),

n é 0, Z^2 é fixado à posição 5 no anel benzeno, Z^1 é um grupo

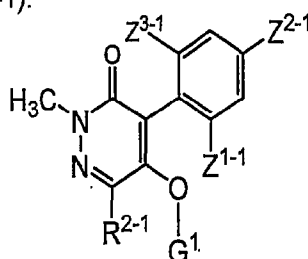
alquila C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquila C₁₋₃),

e

Z² é um grupo arila C₆₋₁₀ (mais preferivelmente um grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C₁₋₆ (mais preferivelmente um grupo alquila C₁₋₃).

Exemplos preferidos do composto da presente invenção include adicionalmente compostos de piridazinona representados pelas seguintes fórmulas (1-1), (1-2) e (1-3).

10 A fórmula (1-1):



(1-1)

em que R²⁻¹ representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C₁₋₃, G¹ representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquilcarbonila C₁₋₃ que pode ser substituído com pelo menos um átomo de halogênio, um grupo alcoxi-carbonila C₁₋₃ ou um grupo arilcarbonila C₆₋₁₀,

Z¹⁻¹ representa um grupo alquila C₁₋₃,

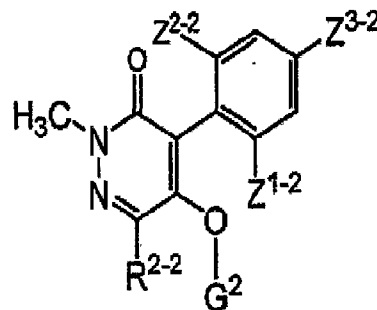
Z²⁻¹ representa um grupo cicloalquila C₃₋₆, um grupo alquinila C₂₋₃, um grupo alquiloxi C₁₋₃, um grupo haloalquila C₁₋₃, um grupo haloalquiloxi C₁₋₃, um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo fenila que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C₁₋₃,

e

Z³⁻¹ representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila C₁₋₃, um grupo cicloalquila C₃₋₆, um grupo alquinila C₂₋₃, um grupo alquiloxi C₁₋₃ ou um átomo de halogênio.

Na fórmula (1-1), R²⁻¹ é preferivelmente um átomo de hidrogênio, um grupo metila ou um grupo etila, G¹ é preferivelmente um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo propionila, um grupo metoxicarbonila, um

grupo etoxicarbonila ou um grupo benzoila, Z^{1-1} é preferivelmente um grupo metila ou um grupo etila, Z^{2n1} é preferivelmente um grupo ciclopropila, um grupo etinila, um grupo metóxi, um grupo trifluorometila, um grupo trifluorometóxi, um átomo de cloro, um átomo de bromo, um grupo fenila, um grupo
 5 4-metilfenila, um grupo ciano ou um grupo nitro, e Z^{3-1} é preferivelmente um átomo de hidrogênio, um grupo metila, um grupo etila, um grupo ciclopropila, um grupo etinila, um grupo metóxi, um átomo de cloro ou um átomo de bromo. A fórmula (1-2):



(I-2)

em que R^{2n2} representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquil C_{1-3} ,

10 G^2 representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquilcarbonil C_{1-3} que pode ser substituído com pelo menos um átomo de halogênio, um grupo alcoxicarbonil C_{1-3} ou um grupo arilcarbonila C_{6-10} ,

Z^{1-2} representa um grupo alquila C_{1-3} ,

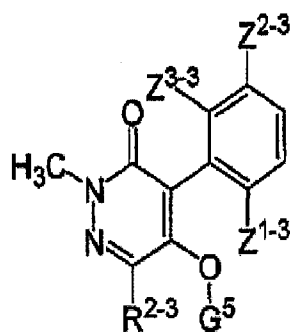
Z^{2n2} representa um grupo cicloalquila C_{3-6} , um grupo alquinila C_{2-3} , um grupo alquiloxi C_{1-3} , um átomo de halogênio, um grupo ciano ou um grupo nitro, e

15 Z^{3-2} representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila C_{1-3} , um grupo cicloalquila C_{6-3} , um grupo alquinila C_{2-3} , um grupo alquiloxi C_{1-3} ou um átomo de halogênio.

20 Na fórmula (1-2), R^{2-2} é preferivelmente um átomo de hidrogênio, um grupo metila ou um grupo etila, G^2 é preferivelmente um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo propionila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila ou um grupo benzoila, Z^{1-2} é preferivelmente um grupo metila ou um grupo etila,

Z^{2-2} é preferivelmente um grupo ciclopropila, um grupo etinila, um grupo metóxi, um átomo de cloro, um átomo de bromo, um grupo ciano ou grupo nitro, e Z^{3n2} é preferivelmente um átomo de hidrogênio, um grupo metila, um grupo etila, um grupo ciclopropila, um grupo etinila, um grupo metóxi, um átomo de cloro ou um átomo de bromo.

A fórmula (I-3):



(I-3)

em que R^{2n3} representa um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C₁₋₃,

G^5 representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquilcarbonila C₁₋₃ que pode ser substituído com pelo menos um átomo de halogênio, um grupo alcóxicarbonila C₁₋₃ ou um grupo arilcarbonila C₆₋₁₀,

Z^{1-3} representa um grupo alquila C₁₋₃,

Z^{2-3} representa um grupo fenila que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C₁₋₃, e

Z^{3-3} representa um átomo de hidrogênio, um grupo alquila C₁₋₃ ou um átomo de halogênio.

Na fórmula (I-3), R^{2-3} é preferivelmente um átomo de hidrogênio, um grupo metila ou um grupo etila, G^5 é preferivelmente um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo propionila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila ou um grupo benzoíla, Z^{1-3} é preferivelmente um grupo metila ou um grupo etila, Z^{2-3} é preferivelmente um grupo fenila, um grupo 4-fluorofenila ou um grupo 4-clorofenila, e Z^{3-3} é preferivelmente um átomo de hidrogênio, um grupo metila ou um átomo de cloro.

O composto da presente invenção tem um excelente efeito de

controle de erva daninha, e pode ser usado como um ingrediente ativo de um herbicida. Alguns dos compostos da presente invenção têm excelente seletividade entre plantas de colheita e ervas daninhas.

Outro aspecto da presente invenção é um herbicida compreendendo o composto da presente invenção como um ingrediente ativo.

Exemplos de ervas daninhas que o composto da presente invenção pode controlar incluem: ervas daninhas que crescem em campos tais como *Digitaria adscendens*, *Eleusine indica*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi*, *Setaria glauca*, *Echinochloa crus-galli*, *Panicum dichotomiflorum*, *Panicum texanum*, *Brachiaria platyphylla*, *Sorghum halepense*, *Sorghum bicolor*, *Cynodon dactylon*, *Avena fatua*, *Lolium multiflorum*, *Alopecurus myosuroides*, *Bromus tectorum*, *Bromus sterilis*, *Phalaris minor*, *Apera spica-venti*, *Poa annua*, *Agropyron repens*, *Cyperus iria*, *Cyperus rotundus*, *Cyperus esculentus*, *Portulaca oleracea*, *Amaranthus retroflexus*, *Amaranthus hybridus*, *Abutilon theophrasti*, *Sida spinosa*, *Polygonum convolvulus*, *Polygonum lapathifolium*, *Polygonum pennsylvanicum*, *Polygonum persicaria*, *Rumex crispus*, *Rumex obtusifolius*, *Polygonum cuspidatum*, *Chenopodium album*, *Kochia scoparia*, *Polygonum longisetum*, *Solanum nigrum*, *Datura stramonium*, *Ipomoea purpurea*, *Ipomoea hederacea*, *Ipomoea hederacea var. integruscula*, *Ipomoea lacunosa*, *Convolvulus arvensis*, *Lamium purpureum*, *Lamium amplexicaule*, *Xanthium strumarium*, *Helianthus* spp. (girassol tipo selvagem), *Matricaria inodora*, *Matricaria chamomilla*, *Chrysanthemum segetum*, *Matricaria matricarioides*, *Ambrosia artemisiifolia*, *Ambrósia trifida*, *Erigeron Canadensis*, *Artemisia princeps*, *Solidago altissima*, *Sesbania exaltata*, *Cassia obtusifolia*, *Desmodium tortuosum*, *Trifolium repens*, *Pueraria lobata*, *Vicia sativa*, *Commelina communis*, *Commelina benghalensis*, *Galium aparine*, *Stellaria media*, *Raphanus raphanistrum*, *Sinapis arvensis*, *Capsella bursa-pastoris*, *Veronica persica*, *Veronica hederifolia*, *Viola arvensis*, *Viola tricolor*, *Papaver rhoeas*, *Myosotis scorpioides*, *Asclepias syriaca*, *Euphorbia helioscopia*, *Euphorbia maculata*, *Geranium carolinianum*, *Erodium cicutarium*, *Equisetum arvense*, e similares; e

Ervas daninhas em campos de arrozal tais como *Echinochloa*

oryzicola, *Echinochloa crus-galli*, *Cyperus difformis*, *Cyperus iria*, *Fimbristylis miliacea*, *Eleocharis acicularis*, *Scirpus juncoides*, *Scirpus wallichii*, *Cyperus serotinus*, *Eleocharis kuroguwai*, *Scirpus maritimus*, *Scirpus nipponicus*, *Monochoria vaginalis*, *Lindernia procumbens*, *Dopatrium junceum*, *Rotala indica*, *Ammannia multiflora*, *Elatine triandra*, *Ludwigia prostrata* *Sagittaria pygmaea*, *Alisma canaliculatum*, *Sagittaria trifolia*, *Potamogeton distinctus* *Oenanthe javanica*, *Callitriche verna* *Vandellia angustifolia*, *Lindernia dubia*, *Eclipta prostrata*, *Murdannia keisak*, *Paspalum distichum*, *Leersia oryzoides*, e similares.

10 O herbicida da presente invenção é geralmente preparado por dissolução ou dispersão do composto da presente invenção em um veículo líquido adequado, ou mistura do composto da presente invenção com um veículo sólido adequado, ou adsorção do composto da presente invenção em um veículo sólido adequado, e então formulando-se uma forma de dose-
 15 gem adequada para o uso pretendido. O herbicida da presente invenção toma, por exemplo, a forma de um concentrado emulsificável, um concentrado solúvel, uma solução de óleo, um aerossol, um pó umedecível, um pó, um pó menos flutuante, um grânulo, um micro grânulo, um micro grânulo F, um grânulo fino F, um grânulo dispersível em água, um pó solúvel em água, um
 20 comprimido grande escoável, um comprimido grande escoável seco, um comprimido, uma pasta, ou similares. O herbicida da presente invenção pode adicionalmente conter um agente auxiliar tal como um emulsificador, um dispersante, um agente de difusão, um agente de penetração, um agente de umedecimento, um ligante, um espessador, um conservante, um antioxidante, um corante, ou similares, conforme necessário. Tal formulação do herbi-
 25 cida da presente invenção pode ser produzida de acordo com um método conhecido.

30 Exemplos do veículo líquido incluem água, alcoóis (tais como metanol, etanol, 1-propanol, 2-propanol, ou etileno glicol), cetonas (tais como acetona, ou metila etil cetona), éteres (tais como dioxano, tetra-hidrofurano, etileno glicol monometil éter, dietileno glicol monometil éter, ou propileno glicol monometil éter), hidrocarbonetos linfáticos (tais como hexano, octano,

ciclo-hexano, querosene, óleo combustível, ou óleo de máquina), hidrocarbonetos aromáticos (tais como benzeno, tolueno, xileno, nafta solvente, ou metilnaftaleno), hidrocarbonetos halogenados (tais como diclorometano, clorofórmio, ou tetracloreto de carbono), amidas ácidas (tais como dimetilformamida, dimetilacetamida, ou N-metilpirrolidona), ésteres (tais como etilacetato, butil acetato, ou gliceril éster de ácido graxo), nitrilas (tais como acetonitrila, ou propionitrila), e similares. Dois ou mais de tais veículos podem ser usados como uma mistura em uma proporção correta.

Exemplos do veículo sólido incluem pó vegetal (por exemplo, pó de soja, pó de tabaco, farinha de trigo, ou serragem), pós minerais (por exemplo, argilas tais como caulim, bentonita, argila branca ácida e argila, talcos tais como pó de talco e pó de pirofilite, sílicas tais como terra diatomácea e pó de mica), alumina, pó de enxofre, carvão ativado, sacarídeos (por exemplo, lactose, ou glicose), sais inorgânicos (por exemplo, carbonato de cálcio, ou hidrogenocarbonato de sódio), corpos ocos de vidro (materiais vítreos naturais sendo calcinados para encapsular bolhas de ar nos mesmos), e similares. Dois ou mais de tais veículos sólidos podem ser usados como uma mistura em uma proporção correta.

O herbicida da presente invenção compreende geralmente 1 a 99% em peso, preferivelmente cerca de 10 a 99% em peso do veículo líquido ou do veículo sólido.

Um tensoativo é geralmente usado como um emulsificante, um dispersante, um agente de difusão, um agente de penetração ou um agente de umedecimento. Exemplos do tensoativo incluem tensoativos aniônicos tais como sais de alquil sulfato éster, alquilarilsulfonatos, dialquil sulfossuccinatos, polioxietileno alquilaril sais de éter fosfato, lignina sulfonatos, naftalenossulfonato-formaldeído policondensados, e similares, e tensoativos não iônicos tais como polioxietileno alquil éteres, polioxietileno alquilaril éteres, polioxietilenoalquil polioxipropileno copolímeros em bloco, ésteres de sorbitano de ácido graxo, e similares. Dois ou mais de tais tensoativos podem ser usados. O herbicida da presente invenção compreende geralmente 0,1 a 50% em peso, preferivelmente cerca de 0,1 a 25% em peso do tensoativo.

Exemplos do ligante e do espessador incluem dextrin, sal de sódio de carboximetilcelulose, polímeros tipo ácido policarboxílico, polivinilpirrolidona, polivinil álcool, lignina sulfonato de sódio, lignina sulfonato de cálcio, poliacrilato de sódio, goma acácia, alginato de sódio, manitol, sorbitol, 5 matérias minerais tipo bentonita, ácido poliacrílico e derivados deste, carbono branco, derivados de sacarídeo naturais (por exemplo, goma xantana, goma guar, e similares), e similares.

O teor do composto da presente invenção no herbicida da presente invenção é geralmente 1 a 90% em peso na forma do concentrado emulsificável, pó umedecível, grânulo dispersível em água, concentrado solúvel, pó solúvel em água, escoável, e similares, geralmente 0,01 a 10% em peso na forma da solução de óleo, pó, pó menos flutuante e similares, e geralmente 0,05 a 10% em peso na forma do micro grânulo, micro grânulo F, grânulo fino F, grânulo e similares. O teor do composto da presente invenção 15 no herbicida da presente invenção pode ser apropriadamente variado dependendo do uso pretendido. O concentrado emulsificável, pó umedecível, grânulo dispersível em água, concentrado solúvel, pó solúvel em água, escoável e similares são geralmente diluídos com água ou similares apropriadamente e então usados, e eles são geralmente usados após cerca de 100 a 20 100.000 vezes de diluição.

Outro aspecto da presente invenção é um método de controle de erva daninha que compreende aplicar uma quantidade eficaz do composto da presente invenção às ervas daninhas ou solo onde as ervas daninhas crescem.

25 Para o método de controle de erva daninha da presente invenção, o herbicida da presente invenção pode ser usado como o composto da presente invenção.

O herbicida da presente invenção pode ser aplicado por um método similar a um método de aplicação conhecido para químicos agrícolas 30 convencionais, incluindo pulverização aérea, dispersão de solo, aplicação de folhagem e similares.

Quando o herbicida da presente invenção é usado em campos

secos ou de arrozal, a quantidade usada (isto é, quantidade eficaz) do herbicida da presente invenção pode diferir de acordo com uma are aplicada, um tempo aplicado do ano, um método de aplicação, espécie de erva daninha alvo, colheita cultivada e similares, e é geralmente na faixa de cerca de 1 a 5 5000 g, preferivelmente cerca de 10 a 1000 g do composto da presente invenção por hectare de campo seco ou de arrozal.

Quando o herbicida da presente invenção é usado para controle de erva daninha em campo secos, ele é geralmente usado como um agente de tratamento de incorporação de solo de pré-emergência, um agente de 10 tratamento de solo de pré-emergência ou um agente de tratamento de folhagem de pós-emergência. Quando o herbicida da presente invenção é usado para controle de erva daninha em campos de arrozal, ele é geralmente usado como um agente de tratamento de solo inundado ou um agente para ambos tratamento de solo de folhagem e de solo.

15 O herbicida da presente invenção pode ser aplicado simultaneamente com um ou mais tipos de outros herbicidas, reguladores de crescimento de planta, fungicidas, inseticidas, acaricidas, nematocidas e similares, se necessário. O herbicida da presente invenção pode também conter os ingredientes ativos de um ou mais tipos de outros herbicidas, reguladores de 20 crescimento de planta, fungicidas, inseticidas, acaricidas, nematocidas e similares. O herbicida da presente invenção pode ser também usado em combinação com os ingredientes ativos de um ou mais tipos de outros herbicidas, reguladores de crescimento de planta, fungicidas, inseticidas, acaricidas, nematocidas e similares.

25 Exemplos dos ingredientes ativos de tais outros herbicidas incluem:

(1) compostos de ácido graxo fenoxi herbicida [2,4-PA, MCP, MCPB, fenotiol, mecoprop, fluroxipir, triclopir, clomeprop, naproanilida e similares],

30 (2) compostos de ácido benzoico herbicida [2,3,6-TBA, dicamba, clopiralid, picloram, aminopiralid, quinclorac, quinmerac e similares],

(3) compostos de ureia herbicida [diuron, linuron, clortoluron,

isoproturon, fluometuron, isouron, tebuthiuron, metabenzthiazuron, cumyluron, daimuron, metil-daimuron e similares],

(4) compostos de triazina herbicida [atrazina, ametrin, cianazina, simazina, propazina, simetrin, dimetametrin, prometrin, metribuzin, triaziflam e similares],

(5) compostos de bupiririnium herbicida [paraquat, diquat e similares],

(6) compostos de hidroxibenzonitrila herbicida [bromoxinila, ioxinila e similares],

(7) compostos de dinitroanilina herbicida [pendimetalin, prodiamina, trifluralin e similares],

(8) compostos de organofósforo herbicida [amiprofos-metila, butamifos, bensulide, piperofos, anilofos, glifosate, glufosinato, glufosinato-P, bialafos e similares],

(9) compostos de carbamato herbicida [di-alato, tri-alato, EPTC, butilato, bentiocarb, esprocarb, molinate, dimepiperato, swep, clorprofam, fenmedifam, fenisofam, piributicarb, asulam e similares],

(10) compostos de amida de ácido herbicida [propanila, propizamida, bromobutida, etobenzanid e similares],

(11) compostos de cloroacetoanilida herbicida [acetoclor, alaclor, butaclor, dimeem seguidaamid, propaclor, metazaclor, metolaclor, pretilaclor, tenilclor, petoxamid e similares],

(12) compostos de difeniléter herbicida [acifluorfen-sódio, bifenox, oxifluorfen, lactofen, fomesafen, clometoxinila, aclonifen e similares],

(13) compostos de imida cíclica herbicida [oxadiazon, cinidonetila, carfentrazona-etila, surfentrazona, flumiclorac-pentila, flumioxazin, pirafufen-etila, oxadiargila, pentoxazona, flutiacet-metila, butafenacila, benzfendizona, bencarbazona, saflufenacila e similares],

(14) compostos de pirazol herbicida [benzofenap, pirazolato, pirazoxifen, topramezona, pirasulfotol e similares],

(15) compostos de tricetona herbicida [isoxaflutol, benzobiciclon, sulcotriona, mesotriona, tembotriona, tefuriltriona e similares],

(16) compostos de ariloxifenoxipropionato [clodinafop-propargila, cihalofop-butila, diclofop-metila, fenoxaprop-etila, fluazifop-butila, haloxifop-metila, quizalofop-etila, metamifop e similares],

5 (17) compostos de oxima trioma herbicida [aloxidim-sódio, setoxidim, butoxidim, cletodim, cloproxidim, cicloxydim, tepraloxidim, tralkoxidim, profoxidim e similares],

(18) compostos de sulfomilureia herbicida [clorsulfuron, sulfometuron-metila, metsulfuron-metila, clorimuron-etila, tribenuron-metila, triasulfuron, bensulfuron-metila, tifensulfuron-metila, pirazosulfuron-etila, primisulfuron- metila, nicosulfuron, amidosulfuron, cinosulfuron, imazosulfuron, rimsulfuron, halosulfuron-metila, prosulfuron, etametsulfuron-metila, triflussulfuron-metila, flazassulfuron, ciclossulfamuron, flupirsulfuron, sulfossulfuron, azimsulfuron, etoxissulfuron, oxassulfuron, iodossulfuron-metil-sódio, foramsulfuron, mesossulfuron- metila, trifloxissulfuron, tritossulfuron, ortossulfamuron, flucetossulfuron, 1-(2-cloro-6-propilimidazo[1,2- a]piridazin-3-ilsulfonil)-3-(4,6-dimetoxipirimidin-2- il)ureia e similares],

10
15

(19) compostos de imidazolinona herbicida [imazametabenzmetila, imazametapir, imazamox, imazapir, imazaquin, imazetapir e similares],

20 (20) compostos de sulfonamida herbicida [flumetsulam, metosulam, diclosulam, florasulam, cloransulam-metila, penoxsulam, piroxsulam e similares],

(21) compostos de pirimidiniloxibenzoato herbicida [piritiobac-sódio, bispiribac-sódio, piriminobac-metila, piribenzoxim, piriftalid, pirimisulfan e similares],

25

(22) outros tipos de compostos herbicidas [bentazon, bromacila, terbacila, clorhiamid, isoxaben, dinoseb, amitrol, cinmetilin, tridifane, dalapon, diflufenzopir- sódio, ditiopir, tiazopir, flucarbazona-sódio, propoxicarbazona-sódio, mefenacet, flufenacet, fentrazamida, cafenstrol, indanofan, oxaziclomefona, benfuresato, ACN, piridato, cloridazon, norflurazon, flurtamona, diflufenican, picolinafen, beflubutamid, clomazona, amicarbazona, pinoxaden, piraclonila, piroxassulfona, tiencarbazona-metila, aminociclopiraclor,

30

ipfencarbazona e similares], e similares.

Exemplos dos ingredientes ativos dos reguladores de crescimento de planta incluem himexazol, paclobutrazol, uniconazol-P, inabenfide, prohexadiona-cálcio, aviglicina, naftalenoacetamida, ácido abscísico, ácido indolebutírico, eticlozato, etefon, cloxifonac, clormequat, diclorprop, gibberel-
 5 lins, prohidrojasmon, benziladenina, forclorfenuron, hidrazida maleica, peróxido de cálcio, mepiquat-cloreto, ácido 4-clorofenoxiacético, e similares.

Exemplos dos ingredientes ativos dos fungicidas incluem:

(1) compostos polihaloaquitio fungicida [captan, folpet e simi-
 10 res],

(2) compostos de orgnofósforo fungicida [IBP, EDDP, tolclofosmetila e similares],

(3) compostos de benzimidazol fungicida [benomila, carbendazim, tiofanato-metila, tiabendazol e similares],

15 (4) compostos de carboxiamida fungicida [carboxin, mepronila, flutolanila, tifuluzamid, furametpir, boscalid, pentiopirad e similares],

(5) compostos de dicarboxiimida fungicida [procimidona, iprodiona, vinclozolin e similares],

(6) compostos de acilalanina fungicida [metalaxila e similares],

20 (7) compostos de azol fungicida [triadimefon, triadimenol, propiconazol, tebuconazol, ciproconazol, epoxiconazol, protioconazol, ipconazol, triflumizol, procloraz, penconazol, flusilazol, diniconazol, bromuconazol, difenoconazol, metconazol, tetraconazol, miclobutanila, fenbuconazol, hexaconazol, fluquinconazol, triticonazol, bitertanol, imazalila, flutriafol e similares],

25 (8) compostos de morfolina fungicida [dodemorf, tridemorf, fenpropimorf e similares],

(9) compostos de estrobilurina fungicida [azoxistrobin, kresoximmetila, metominostrobin, trifloxistrobin, picoxistrobin, piraclostrobin, fluoxastrobin, dimoxistrobin e similares],

30 (10) antibióticos fungicidas [validamicin A, blasticidin S, kasugamicin, polioxin e similares],

(11) compostos de ditiocarbamato fungicida [mancozeb, maneb,

tiuram e similares],

(12) outros tipos de compostos fungicidas [ftalida, probenazol, isoprotiolano, triciclazol, piroquilon, ferimzona, acibenzolar S-metila, carpropamid, diclocimet, fenoxanila, tiadinila, diclomezina, tecloftalam, pencicuron, ácido oxolínico, TPN, triforina, fenpropidin, spiroxamina, fluazinam, iminoctadina, fencpiclonila, fludioxonila, quinoxifen, fenhexamid, siltiofam, proquinazid, ciflufenamid, mistura de bordeaux, diclofluanid, ciprodinila, pirimetanila, mepanipirim, dietofencarb, piribencarb, famoxadona, fenamidona, zoxamida, etaboxam, amisulbrom, iprovalicarb, bentiavalicarb, ciazofamid, mandipro-
 5
 10
 15
 20
 25
 30
 35
 40
 45
 50
 55
 60
 65
 70
 75
 80
 85
 90
 95
 100
 105
 110
 115
 120
 125
 130
 135
 140
 145
 150
 155
 160
 165
 170
 175
 180
 185
 190
 195
 200
 205
 210
 215
 220
 225
 230
 235
 240
 245
 250
 255
 260
 265
 270
 275
 280
 285
 290
 295
 300
 305
 310
 315
 320
 325
 330
 335
 340
 345
 350
 355
 360
 365
 370
 375
 380
 385
 390
 395
 400
 405
 410
 415
 420
 425
 430
 435
 440
 445
 450
 455
 460
 465
 470
 475
 480
 485
 490
 495
 500
 505
 510
 515
 520
 525
 530
 535
 540
 545
 550
 555
 560
 565
 570
 575
 580
 585
 590
 595
 600
 605
 610
 615
 620
 625
 630
 635
 640
 645
 650
 655
 660
 665
 670
 675
 680
 685
 690
 695
 700
 705
 710
 715
 720
 725
 730
 735
 740
 745
 750
 755
 760
 765
 770
 775
 780
 785
 790
 795
 800
 805
 810
 815
 820
 825
 830
 835
 840
 845
 850
 855
 860
 865
 870
 875
 880
 885
 890
 895
 900
 905
 910
 915
 920
 925
 930
 935
 940
 945
 950
 955
 960
 965
 970
 975
 980
 985
 990
 995

(1) compostos de organofósforo inseticida [fention, fenitrotrion, pirimiphos-metila, diazinon, quinalfos, isoxation, piridafention, clorpirifos, clorpirifos-metila, vamidotion, malation, fentoato, dimetoato, dissulfoton, monocrotofos, tetraclorvinfos, clorfenvinfos, propafos, acefato, triclorfon, EPN, piraclufos, butatíofos, cloretoxíofos, cianofos, diclofention, diclorvos, dimetilvinfos, etion, etoprofos, etrimfos, formotion, isofenfos, mesulfenfos, metidation, naled, oxideprofos, paration, fosadona, fosmet, profenofos, protiofos, salition, sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tiometon, florato e similares],

(2) compostos de carbamato inseticida [carbarila, metolcarb, isoprocarb, BPMC, propoxur, XMC, carbofurano, carbosulfan, benfuracarb, furatiocarb, metomila, tiodicarb, alanicarb, bendiocarb, cloetocarb, etiofencarb, fenobucarb, oxamila, pirimicarb, xililcarb, aldicarb e similares],

(3) compostos de piteroide sintético inseticida [teflutrin, bifentrin, cicloprotrin, etofenprox acrinatrin, alletrin, benflutrin, beta-ciflutrin ciflutrin, cihalotrin, cipermetrin, deltametrin esfenvalerato, fenpropatrin, fenvalerato, flucithrinato flufenprox, flumetrin, fluvalinato, halfenprox imiprotrin, permetrin, pralletrin, piretrins resmetrin, sigma-cipermetrin, silafluofen, tralometrin transflutrin, tetrametrin, fenotrin, cifenotrin, alfa-cipermetrin, zeta-cipermetrin, lambda-cihalotrin, gama-cihalotrin, furametrin, tau-fluvalinato, metoflutrin, proflutrin, dimeflutrin, protrifenbute e similares],

(4) compostos baseados em nereistoxin inseticida [cartap, ben-

sultap, tiociclam e similares],

(5) compostos de neonicotinoide inseticida [imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiametoxam, tiacloprid, dinotefurano, clotianidin e similares],

5 (6) compostos de benzoilfenilureia inseticida [clorfluazuron, flua-
zuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, bistrifluron, diflu-
benzuron, flucicloxuron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron e similares],

(7) compostos de macrolide inseticida [emamectin, abamectin,
milbemectin, lepimectin, espinosad, spinetoram e similares],

10 (8) outros tipos de compostos inseticidas [buprofezin, tebufeno-
zide, cromafenozide, halofenozide, metoxifenozide, fipronila, etiprole, aceto-
prole, vaniliprole, piriprole, pirafluprole, pimetozina, pirifluquinazona, diafen-
turon, indoxacarb, metaflumizona, tolfenpirad, flufenerim, piridalila, flonica-
mid, espiromesifen, espirotetramat, flubendiamida, clorantraniliprole, piripro-
15 xifen, ciroitiazina, metoxadiazona, triazamato, clordano, nicotina-sulfato, tra-
lopirila, Bt toxins e similares], e similares.

Exemplos dos ingredientes ativos dos acaricidas incluem hexiti-
azox, piridaben, fenpiroximato, tebufenpirad, clorfenapir, etoxazol, pirimidi-
fen, acequinocila, bifenazato, espirodiclofen, fenazaquin, bromopropilato,
20 formetanato, amitraz, benzoximato, quinometionat, clorobenzilato, clorfen-
son, clofentezina, ciflumetofen, dicofol, óxido de fenbutatin, fenotiocarb, flua-
cripirim, propargito, polinactinas, tetradifon, amidoflumet, cienopirafen, e si-
milares.

Exemplos dos ingredientes ativos dos nematocidas incluem fos-
25 tiazato, cadusafos, benclotiaz, metam-amônia, metam-sódio, DCIP, levami-
sol, metil isotiocianato, morantel tartarato, imiciafos, e similares.

O herbicida da presente invenção pode adicionalmente conter
um "fitoprotetor" (por exemplo, furilazol, diclormid, benoxacor, allidoclor, iso-
xadifen-etila, fenclorazol-etila, mefenpir-dietila, cloquintocet-mexila, fenclo-
30 rim, ciprosulfamida, ciometrinila, oxabetrinila, fluxofenim, flurazol, 2-
diclorometil-2-metil-1,3-dioxolano, 1,8-anidrido naftálico e similares), um a-
gente de coloração, um fertilizador (por exemplo, ureia e similares) e simila-

res, se necessário.

O composto da presente invenção pode ser usado como um ingrediente ativo de um herbicida para solos de colheita tais como campos, campos de arrozal, relvados, e pomares, ou solos de não colheita. O composto da presente invenção pode controlar ervas daninhas em solos de colheita e similares onde "plantas de colheita" são cultivadas, sem causar qualquer dano às "plantas de colheita". Exemplos das "plantas de colheita" incluem: colheitas agrícolas: milho, arroz, cevada, centeio, aveia, sorgo, algodão, soja, amendoim, trigo-mouro, beterraba de açúcar, colza, girassol, cana de açúcar, tabaco e similares;

vegetais: vegetais solanáceos (por exemplo, planta de ovo, tomate, pimenta verde, pimenta vermelha, batata e similares), vegetais cucurbitáceos (por exemplo, pepino, abóbora, abobrinha italiana, melancia, melão e similares), vegetais brassicáceos (por exemplo, rabanete japonês, nabo, rábano silvestre, couve-rábano, repolho chinês, repolho, mostarda de folha, brócolis, couve-flor e similares), vegetais compostos (por exemplo, bardana, crisântemo, alcachofra, alface e similares), vegetais liliáceos (por exemplo, alho-porro, cebola, alho, aspargos e similares), vegetais umbelífero (por exemplo, cenoura, salsa, aipo, pastinaca selvagem e similares), vegetais quenopodiáceo (por exemplo, espinafre, acelga suíça e similares), vegetais labiatae (por exemplo, perila, hortelã, manjerição e similares), morango, batata doce, inhame japonês, taro, e similares; frutos: frutos pomáceo (por exemplo, maçã, pêra, pêra japonesa, marmelo chinês, marmelo e similares), frutos de pedra (por exemplo, pêssego, ameixa, nectarina, ameixa japonesa, cereja mahaleb, damasco, ameixa seca e similares), frutos cítricos (por exemplo, tangerina, laranja, limão, lima, taranja e similares), nozes (por exemplo, castanha, noz, avelã, amêndoa, pistache, castanha de caju, noz de macadamia e similares), bagas (por exemplo, espécie de mirtilo que produz bagas azuis, oxococo, amora-preta, framboesa e similares), uva, caqui, oliva, ameixeira-do-japão, banana, café, tamareira, coqueiro, palma de óleo e similares; árvores outras do que árvores frutíferas: planta de chá, amora, plantas de florescimento, árvores de estrada (por exemplo, planta de cinza,

videira, comiso, eucalipto, noqueira-do-japão, "lilac", bordo, carvalho de salgueiro, álamo, "cercis", liquidâmbar, árvore plana, zelkova, tuia, "Abies", abeto vermelho de cucuta, junípero de agulha, pinho, abeto vermelho, *feixo*) e *similares*; e outras flores (por exemplo, rosa, rosa-pálido, crisântemo, genciana de pradaria, gipsófila, gerbera, cravo-de-defunto, sálvia, petúnia, verbena, tulipa, áster, genciana, lírio, amor-perfeito, ciclame, orquídea, convalária, alfazema, goiveiro, repolho ornamental, primula, poinsetia, gladiolo, cattleya, margarida, "cymbidium", begônia e similares), plantas ornamentais, e similares.

10 As "plantas de colheita" acima incluem aquelas que são conferidas resistência a herbicidas incluindo inibidores de HPPD tal como isoxaflutole; inibidores de ALS tais como imazetapir e tifensulfuron-metil; inibidores de sintetase de EPSP, tal como glifosato; inibidores de sintetase de glutamina tal como glufosinato; inibidores de acetil CoA carboxilase tais como setoxidim; inibidor de PPO tal como flumioxazin; bromoxynila, dicamba e 2,4-D
15 por técnica de geração clássica, uma técnica de engenharia genética, ou similares.

Exemplos das "plantas de colheita" a qual resistência a herbicida é dada por uma técnica de geração clássica inclui colza, trigo, girassol,
20 arroz e milho tendo resistência a herbicidas inibidores de imidazolinona ALS tal como imazetapir, que já estão no mercado sob o nome de Clearfield (marca registrada); resistência à soja para herbicidas inibidores de sulfonilureia ALS tal como tifensulfuron-metila, que já está no mercado sob o nome de soja STS; e plantas de colheita resistentes a inibidores de CoA carboxilase
25 tais como herbicidas triona oxima e herbicidas ariloxifenoxipropionato, por exemplo, milho SR. As plantas de colheita as quais a resistência a inibidores de acetil CoA carboxilase é dada são descritas em, por exemplo, Proc. Natl. Acad. Sci. USA, vol. 87, pp. 7175-7179 (1990).

Em adição, acetil CoA carboxilase mutante que é resistente a
30 inibidores acetil CoA carboxilase é descrito, por exemplo, em Weed Science vol. 53, pp. 728-746 (2005). Um gene para tal acetil CoA carboxilase mutante pode ser introduzido em uma planta de colheita por uma técnica de em-

genharia genética ou uma mutação envolvida na resistência a inibidores de acetil CoA carboxilase pode ser introduzido no gene de codificação de acetil CoA carboxilase de uma planta de colheita para produzir uma planta de colheita com resistência a inibidores de acetil CoA carboxilase.

- 5 Adicionalmente, ácidos nucleicos para introdução de uma mutação de substituição base podem ser introduzidos na célula de uma planta de colheita por quimeroplastia (ver, Gura T., "Repairing the Genome's Spelling Mistakes", Science, vol. 285, pp.316-318 (1999)) para induzir uma mutação de amino ácido direcionado local no gene da planta de colheita que é alveja-
10 do por um herbicida, e, desse modo, uma planta de colheita resistente ao herbicida pode ser produzida.

- Exemplos das "plantas de colheita" as quais resistência herbicida é conferida por uma técnica de engenharia genética incluem variedades de milho, soja, algodão, colza e beterraba de açúcar tendo resistência a gli-
15 fosate, que já estão no mercado sob o nome de produto de Roundup Ready (marca registrada) ou Agrisure (marca registrada) GT; variedades de milho, soja, algodão e colza tendo resistência a glufosinato, que já estão no mercado sob o nome de produto de Liberty Link (marca registrada); e uma variedade de algodão tendo resistência a bromoxinila, que já é conhecido no
20 mercado sob o nome de produto de BXN. As "plantas de colheita" acima também incluem plantas de colheita conferidas uma capacidade de produzir toxinas inseticidas conhecidas como toxinas seletivas produzidas de *Bacillus* bactéria cuja capacidade é dada por uma técnica de engenharia genética. Exemplos de tais toxinas inseticidas incluem proteínas inseticidas produzi-
25 das de *Bacillus cereus* ou *Bacillus popilliae*; 5-endotoxinas tais como CryIAb, CryIAc, CryIF, CryIFa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 e Cry9C produzidos de *Bacillus thuringiensis*; proteínas inseticidas tais como VIPI, VIP2, VIP3 e VIP3A; proteínas inseticidas produzidas de nematode; toxinas produzidas por animais tal como toxina de escorpião, toxina de aranha, uma toxina de abelha e um
30 toxina do sistema nervoso específica de inseto; toxinas de fungo filamentoso; lectinas de planta; aglutininas; inibidores de protease tais como inibidores de tripsin, inibidores de serina protease, inibidores de patatin, cistatin e papaína;

proteínas de inativação de ribosome (RIP) tais como ricins, milho-RIP, a-brins, luffin, saporinas, e briodin; enzimas de metabolismo de esteroide tais como 3-hidroxiesteroide oxidase, ecdiesteroide-UDP-glucosiltransferase, e colesterol oxidase; inibidores de ecdisone; HMG-CoA reductase; inibidores de canal de íon tais como inibidores de canal de sódio e inibidores de canal de cálcio; Estearase de hormônio juvenil; receptores de hormônio diurético; estilbene sintase; bibenzil sintase; quitinase; glucanases; e similares. Exemplos adicionais de tais toxinas de inseticida incluem toxinas híbridas das proteínas de inseticida acima (por exemplo, CryIAb, CryIAc, CryIF, CryIFa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C, VIPI, VIP2, VIP3, VIP3A) e proteínas de inseticida em que uma parte de amino ácidos constituindo as proteínas de inseticida é anulada ou modificada. As toxinas híbridas são criadas por combinação de domínios diferentes das proteínas de inseticida acima por uma técnica de engenharia genética. Um exemplo da toxina em que uma parte de amino ácidos constituindo a proteína de inseticida é anulada inclui CryIAb em que parte de aminoácidos é anulada. Um exemplo da toxina em que uma parte de aminoácidos constituindo a proteína de inseticida é modificada é produzido por substituição de um ou mais aminoácidos de uma toxina natural.

20 As toxinas inseticidas e plantas de colheita geneticamente modificadas que têm a capacidade de produzir as toxinas inseticidas são descritas, por exemplo, em EP-A-0374753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0427529, EP-A-451878 e WO 03/052073.

25 As "plantas de colheita" que são dadas à capacidade de produzir as toxinas inseticidas por uma técnica de engenharia genética tem resistência a ataque por pestes Coleopteran, pestes Dipteran e/ou pestes Lepidopteran.

30 Plantas geneticamente modificadas tendo um ou mais genes resistentes a inseto e expressando uma ou mais toxinas inseticidas já são conhecidos, e alguns deles são comercialmente disponíveis. Exemplos de tais plantas geneticamente modificadas incluem YieldGard (marca registrada) (uma variedade de milho que expressa toxina CryIAb), YieldGard Root-

worm (marca registrada) (uma variedade de milho que expressa toxina Cry3Bbl), YieldGard Plus (marca registrada) (uma variedade de milho que expressa CryIAb e toxinas Cry3Bbl), Herculex I (marca registrada) (uma variedade de milho que expressa toxina CryIFa2 e fosfotricin JV-acetiltransferase (PAT) para conferir resistência a glufosinato), NuCOTN33B (marca registrada) (uma variedade de algodão que expressa toxina CryIAc), Bollgard I (marca registrada) (uma variedade de algodão que expressa toxina CryIAc), Bollgard II (marca registrada) (uma variedade de algodão que expressa CryIAc e toxinas Cry2Ab), VIPCOT (marca registrada) (uma variedade de algodão que expressa toxina VIP), NewLeaf (marca registrada) (uma variedade de batata que expressa toxina Cry3A), NatureGard (marca registrada), Agrisure (marca registrada) GT Advantage (GA21 trato de resistência de glifosato), Agrisure (marca registrada) CB Advantage (BtII corn borer (CB) trait), e Protecta (marca registrada).

15 As "plantas de colheita" acima também incluem aquelas que são dadas uma capacidade de produzir substâncias antipatogenia por uma técnica de engenharia genética. Exemplos das substâncias anti-patogenia incluem proteínas PR (PRPs, descritas em EP-A-0392225); inibidores de canal de íon tais como inibidores de canal de sódio, e inibidores de canal de cálcio (KPI, KP4 e KP6 toxinas e similares produzidas por vírus são conhecidos); estilbeno sintase; bibenzil sintase; chitinase; glucanase; substâncias de produção de micro-organismo tais como antibióticos de peptídeo, antibióticos tendo um heterociclo, e fatores de proteína relacionados à resistência contra patogenias de planta (descritos em WO 03/000,906), e similares. Tais substâncias de antipatogenia e plantas geneticamente modificadas capazes de produzi-las são descritas, por exemplo, em EP-A-0392225, WO 95/33818 e EP-A-0353191. As "plantas de colheita" acima também incluem aquelas as quais um trato benéfico tal como um componente de óleo modificado ou um teor aumentado de aminoácido são dados por uma técnica de engenharia genética. Exemplos de tais plantas de colheita incluem VISTIVE (marca registrada) (soja linolênica baixa que tem um teor reduzido de ácido linolênico), e milho de alta lisina (óleo alto) (milho que tem um teor aumentado de lisina

ou óleo).

Além disso, as "plantas de colheita" acima incluem variedades de planta de colheita empilhadas que têm uma combinação de dois ou mais de traço benéfico tal como o traço resistente a herbicida clássico acima descrito, um gene de resistência à herbicida, um gene inseticida resistente à

5 peste, um gene de produção de substância de antipatogenia, um componente de óleo modificado, e um teor de aminoácido aumentado.

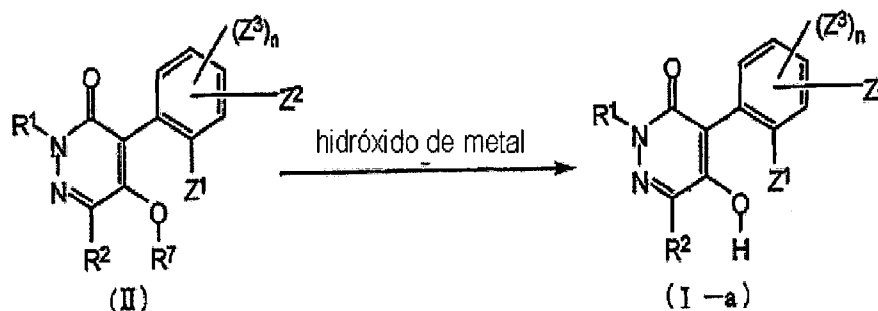
Quando o composto da presente invenção é usado para uma planta de colheita resistente à herbicida, a planta é tratada sequencialmente

10 com o composto da presente invenção e o herbicida (por exemplo, glifosato ou a sal deste, glufosinato ou um sal deste, dicamba ou um sal deste, imazetapir ou um sal deste, isoxaflutol, etc.) ao qual a planta é resistente, ou com uma mistura de ambos, e, desse modo, controle de erva daninha compreensivo pode ser alcançado.

15 O composto da presente invenção pode ser produzido, por exemplo, pelos seguintes métodos de preparação. Método de preparação 1

Um composto representado pela fórmula (I-a), que é um composto da presente invenção em que G é um átomo de hidrogênio, pode ser preparado pela reação de um composto representado pela fórmula (II) com

20 um hidróxido de metal.



em que R^7 representa um grupo alquil C_{1-6} (por exemplo, um grupo metila ou um grupo etil), e R^1 , R^2 , Z^1 , Z^2 , Z^3 e n são conforme definidos acima.

A reação é geralmente realizada em um solvente. Exemplos do solvente usado na reação incluem água; éteres tais como tetra-hidrofurano e

25 dioxano; e a mistura destes.

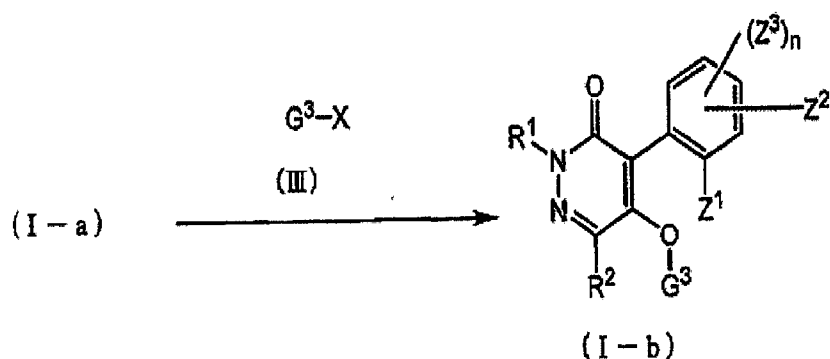
Exemplos do hidróxido de metal usado na reação incluem hidróxidos de metal alcalino tais como hidróxido de sódio e hidróxido de potássio. A quantidade do hidróxido de metal usado na reação é geralmente 1 a 120 equivalentes molares, preferivelmente 1 a 40 equivalentes molares para o composto representado pela fórmula (II).

A temperatura de reação é geralmente na faixa de temperatura ambiente para o ponto de ebulição do solvente, preferivelmente no ponto de ebulição do solvente. A reação pode ser também realizada em um tubo vedado ou um vaso fechado resistente à alta pressão enquanto em aquecimento. O tempo de reação é geralmente de 5 minutos a umas poucas semanas.

A completção da reação pode ser confirmada por um meio analítico tal como cromatografia de camada delgada, cromatografia líquida de alto desempenho ou similares após amostragem de uma parte de um mistura de reação. Após a completção da reação, o composto representado pela fórmula (I-a) pode ser isolado, por exemplo, por neutralização da mistura de reação com uma adição de um ácido, mistura da mistura de reação com água, seguido por extração com um solvente orgânico, e em seguida secagem e concentração da camada orgânica resultante.

20 Método de Preparação 2

Um composto representado pela fórmula (I-b), que é um composto da presente invenção em que G é um grupo outro que não um átomo de hidrogênio, pode ser preparado por reação de um composto representado pela fórmula (I-a) com um composto representado pela fórmula (III).



em que G^3 é conforme definido para G, provido que um átomo de hidrogênio é excluído; X representa um átomo de halogênio (por exemplo, um átomo de cloro, um átomo de bromo, ou um átomo de iodo) ou um grupo representado pela fórmula OG^3 ; e R^1 , R^2 , Z^1 , Z^2 , Z^3 ;

5 e n são conforme definidos acima.

A reação pode ser realizada em um solvente. Exemplos do solvente na reação incluem hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno e tolueno; éteres tais como dietil éter, isopropil éter, dioxano, tetra-hidrofurano e dimetoxietano; hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clo-
10 rofórmio e 1,2-dicloroetano; amidas tais como dimetilformamida e dimetilacetamida; sulfóxidos tais como dimetilsulfóxido; sulfonas tais como sulfolano; e uma mistura destes.

Exemplos do composto representado pela fórmula (III) incluem haletos de ácido carboxílico tais como acetil cloreto, propionil cloreto, isobuti-
15 ril cloreto, pivaloil cloreto, benzoil cloreto e ciclo-hexano cloreto de ácido carboxílico; anidridos de ácido carboxílico tais como anidrido acético e anidrido de trifluoroacético; haletos de éster meio carbonato tais como metil cloroformiato, etil cloroformiato e fenil cloroformiato; carbamoil haletos tais como dimetilcarbamoil cloreto; haletos de ácido sulfônico tais como metanossulfo-
20 nil cloreto e p-toluenossulfonil cloreto; anidridos de ácido sulfônico tais como anidrido metanossulfônico e anidrido trifluorometanossulfônico; e ésteres fosfato halogenados tais como dimetil clorofosfato. A quantidade do composto representado pela fórmula (III) usada na reação é geralmente 1 equivalente molar ou mais, preferivelmente 1 a 3 equivalentes molares para o com-
25 posto representado pela fórmula (I-a).

A reação é geralmente realizada na presença de uma base. Exemplos da base usada na reação incluem bases orgânicas tais como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina e 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-
7-undeceno; e bases inorgânicas tais como hidróxido de sódio, hidróxido de
30 potássio, hidróxido de cálcio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, hidrogenocarbonato de sódio, carbonato de cálcio e hidreto de sódio. A quantidade da base usada na reação é geralmente 0,5 a 10 equivalentes

molares, preferivelmente 1 a 5 equivalentes molares para o composto representado pela fórmula (I-a).

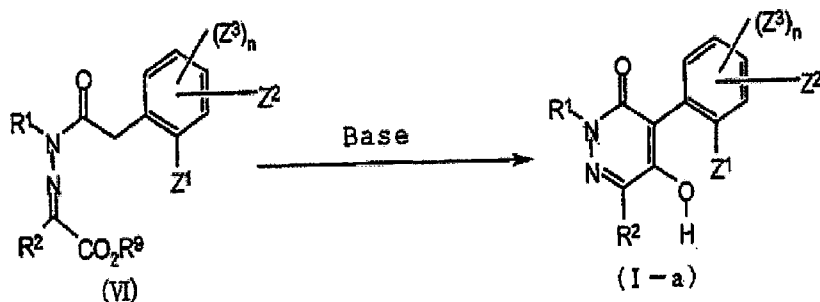
A temperatura de reação é geralmente a -30 a 180°C, preferivelmente a -10 a 50°C. O tempo de reação é geralmente de 10 minutos a 30 horas.

A completação da reação pode ser confirmada por um meio analítico tal como cromatografia de camada delgada, cromatografia líquida de alto desempenho ou similares após amostragem de uma parte de uma mistura de reação. Após a completação da reação, o composto representado pela fórmula (I-b) pode ser isolado, por exemplo, pela mistura da mistura de reação com água, seguido por extração com um solvente orgânico, e em seguida secagem e concentração da camada orgânica resultante.

O composto representado pela fórmula (III) é um composto conhecido, ou pode ser preparado de um composto conhecido.

15 Método de Preparação 3

UM composto representado pela fórmula (I-a), que é um composto da presente invenção em que G é um átomo de hidrogênio, pode ser também preparado pelo tratamento de um composto representado pela fórmula (VI) com uma base.



20 em que R⁹ representa a um grupo alquil C₁₋₆ (por exemplo, um grupo metila ou um grupo etila), e R¹, R², Z¹, Z², Z³; e

n são conforme definidos acima.

A reação é geralmente realizada em um solvente.

Exemplos do solvente na reação incluem hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno, tolueno e xileno; éteres tais como dietil éter, i-
25 isopropil éter, dioxano, tetra-hidrofuran e dimetoxietano; hidrocarbonetos ha-

logenados tais como diclorometano, clorofórmio e 1,2-dicloroetano; amidas tais como dimetilformamida e dimetilacetamida; sulfonas tais como sulfolana; e uma mistura destes.

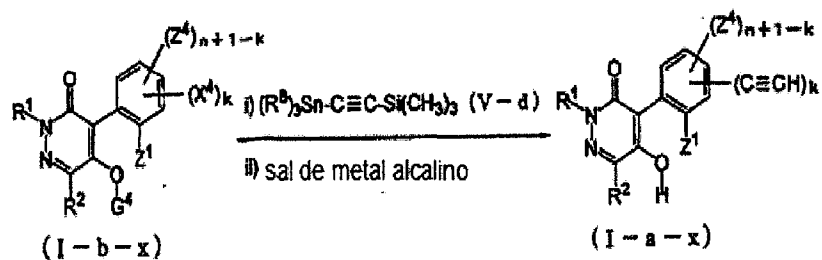
Exemplos da base na reação incluem alcóxidos de metal tais como potássio terc-butóxido; hidreto de metal alcalino tal como hidreto de sódio; bases orgânicas tais como trietilamina, tributilamina e N,N-diisopropiletilamina. A quantidade da base usada na reação é geralmente 1 a 10 equivalentes molares, preferivelmente 2 a 5 equivalentes molares para o composto representado pela fórmula (VI).

A temperatura de reação é geralmente a -60 a 180°C, preferivelmente a -10 a 100°C. O tempo de reação é geralmente de 10 minutos a 30 horas.

A completação da reação pode ser confirmada por um meio analítico tal como cromatografia de camada delgada, cromatografia líquida de alto desempenho ou similares após amostragem de uma parte de uma mistura de reação. Após a completação da reação, o composto representado pela fórmula (I-a) pode ser isolado, por exemplo, por neutralização da mistura de reação com uma adição de um ácido, mistura da mistura de reação com água, seguido por extração com um solvente orgânico, e, em seguida, secagem e concentração da camada orgânica resultante.

Método de Preparação 4

Entre os compostos da presente invenção representados pela fórmula (I-a), um composto representado pela seguinte fórmula (I-a-x) pode ser também preparado pelo seguinte método,



onde X^4 representa um átomo de halogênio (por exemplo, um átomo de cloro, um átomo de bromo, ou um átomo de iodo); R^8 representa

um grupo alquila C_{1-6} (por exemplo, um grupo metila, ou um grupo butila); Z^4 é conforme definido para Z^3 , provido que um grupo alquinila C_{2-6} , um átomo de halogênio, um grupo arila C_{6-10} substituído com pelo menos um átomo de halogênio e um grupo heteroarila de 5 ou 6 membros substituído com pelo menos um átomo de halogênio são excluídos; k representa 1, 2, 3 ou 4; G^4 representa um grupo alquilcarbonila C_{1-6} ou um grupo alquiloxicarbonila C_{1-6} ; e R^1 , R^2 , Z^1 e n são conforme definidos acima.

Na reação, um composto representado pela fórmula (I-b-x) e um reagente organometálico representado pela fórmula (V-d) são submetidos à reação de acoplamento, seguido por reação com um sal de metal alcalino para remover um grupo trimetilsilila e para converter o substituinte G^4 em um átomo de hidrogênio. Desse modo, o composto representado pela fórmula (I-a-x) pode ser preparado.

A primeira etapa da reação usando o composto representado pela fórmula (V-d) é realizada em um solvente. Exemplos do solvente incluem hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno e tolueno; éteres tais como dietil éter, di-isopropil éter, dioxano, tetra-hidrofuran e dimetoxietano; hidrocarbonetos halogenados tais como clorofórmio e 1,2-dicloroetano; amidas tais como dimetilformamida, dimetilacetamida, etc.; e uma mistura destes.

Na primeira etapa da reação, o reagente organometálico representado pela fórmula (V-d) pode ser geralmente usado em uma quantidade de k equivalentes molares ou mais, preferivelmente 1 a 10 equivalentes molares para o composto representado pela fórmula (I-b-x).

A primeira etapa da reação é efetuada na presença de um catalisador. Exemplos do catalisador incluem catalisadores de paládio tais como tetraquis(trifenilfosfina)paládio e diclorobis(trifenilfosfina)paládio. A quantidade do catalisador usado na reação é geralmente 0,001 a 0,5 equivalente molar, preferivelmente 0,01 a 0,2 equivalente molar para o composto representado pela fórmula (I-b-x).

A temperatura de reação da primeira etapa da reação é geralmente a -80 a 180°C , preferivelmente a -30 a 150°C . O tempo de reação da

primeira etapa da reação é geralmente de 30 minutos a 100 horas.

A completção da reação pode ser confirmada por um meio analítico tal como cromatografia de camada delgada, cromatografia líquida de alto desempenho ou similares após amostragem de uma parte de uma mistura de reação. Após a completção da reação, um produto a partir da primeira etapa da reação pode ser isolado, por exemplo, por sujeição da mistura de reação à concentração, purificação cromatográfica e similares.

O reagente organometálico representado pela fórmula (V-d) é um composto conhecido, ou pode ser preparado de um composto conhecido de acordo com um método conhecido.

A segunda etapa da reação usando um sal de metal alcalino é efetuada em um solvente. Exemplos do solvente incluem água; alcoóis tais como metanol e etanol; éteres tais como dioxano, tetra-hidrofuran e dimetoxietano; e uma mistura destes.

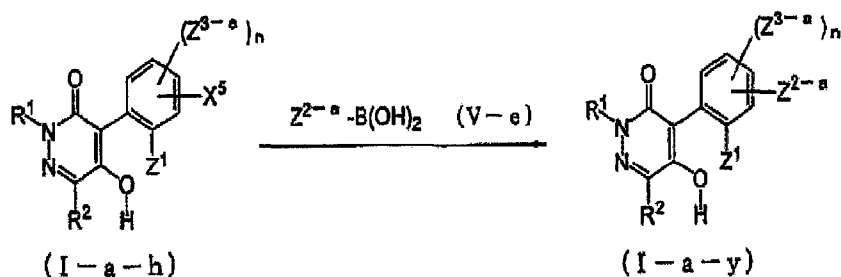
Exemplos do sal de metal alcalino usado para a segunda etapa da reação incluem hidróxidos de metal alcalino tais como hidróxido de sódio e hidróxido de potássio; e carbonatos de metal alcalino tais como carbonato de sódio e carbonato de potássio. Na segunda etapa da reação, a quantidade do sal de metal alcalino é geralmente $(1 + k)$ equivalentes molares ou mais, preferivelmente 2 a 10 equivalentes molares para o composto representado pela fórmula (I-b-x).

A temperatura de reação da segunda etapa da reação é geralmente a -30 a 180°C , preferivelmente a -10 a 50°C . O tempo de reação da segunda etapa da reação é geralmente de 30 minutos a 100 horas.

A completção da reação pode ser confirmada por um meio analítico tal como cromatografia de camada delgada, cromatografia líquida de alto desempenho ou similares após amostragem de uma parte de uma mistura de reação. Após a completção da reação, o composto representado pela fórmula (I-a-x) pode ser isolado, por exemplo, por mistura da mistura de reação com água, neutralização da mistura de reação com uma adição de um ácido, seguido por extração com um solvente orgânico, e, em seguida, secagem e concentração da camada orgânica resultante.

Método de Preparação 5

Entre os compostos da presente invenção representado pela fórmula (I-a), um composto representado pela seguinte fórmula (I-a-y) pode ser também preparado pelo seguinte método.



- 5 em que X^5 representa um átomo de halogênio (por exemplo, um átomo de cloro, um átomo de bromo, ou um átomo de iodo); Z^{3-a} é conforme definido para Z^3 , provido que um átomo de halogênio, um grupo arila C_{6-10} substituído com pelo menos um átomo de halogênio e um grupo heteroarila de 5 ou 6 membros substituído com pelo menos um átomo de halogênio são excluídos; Z^{2-a} representa um grupo cicloalquila C_{3-8} , um grupo arila C_{6-10} ou um grupo heteroarila de 5 ou 6 membros (cada um destes pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquila C_{1-6}); e R^1 , R^2 , Z^1 e n são conforme definidos acima.

- 15 Na reação, um composto representado pela fórmula (I-a-h) e um reagente organometálico representado pela fórmula (V-e) são submetidos à reação de acoplamento para preparar um composto representado pela fórmula (I-a-y).

- 20 Na reação, o reagente organometálico representado pela fórmula (V-e) pode ser usado geralmente em uma quantidade de 1 equivalente molar ou mais, preferivelmente 1 a 3 equivalentes molares para o composto representado pela fórmula (I-a-h).

- 25 A reação é efetuada em um solvente. Exemplos dos solventes na reação incluem hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno e tolueno; alcoóis tais como metanol, etanol e propanol; éteres tais como dietil éter, diisopropil éter, dioxano, tetra-hidrofurano, e dimetoxietano; cetonas tais como acetona e metila etil cetona; amidas tais como dimetilformamida e dimetila-

cetamida; sulfóxidos tais como dimetil sulfóxido; sulfonas tais como sulfolano; água; e uma mistura destes. A reação é realizada na presença de uma base. Exemplos da base na reação incluem bases orgânicas tais como trietilamina, tripropilamina, piridino, dimetilanilina, dimetilaminopiridina e 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno; e bases inorgânicas tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, hidrogenocarbonato de sódio, carbonato de cálcio, carbonato de cério e fosfato de potássio. A quantidade da base é geralmente 0,5 a 10 equivalentes molares, preferivelmente 1 a 5 equivalentes molares para o composto representado pela fórmula (I-a-h) .

Adicionalmente, a reação é efetuada na presença de um catalisador. Exemplos do catalisador na reação incluem catalisadores de paládio tais como tetraquis(trifenilfosfina)paládio, diclorobis(trifenilfosfina)paládio e diclorobis(triciclo-hexilfosfina)paládio. A quantidade do catalisador usado na reação é geralmente 0,001 a 0,5 equivalente molar, preferivelmente 0,01 a 0,2 equivalente molar para o composto representado pela fórmula (I-a-h).

A temperatura de reação da reação é geralmente a 20 a 180°C, preferivelmente a 60 a 150°C. O tempo de reação é geralmente de 30 minutos a 100 horas.

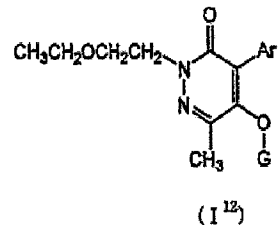
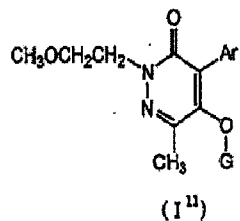
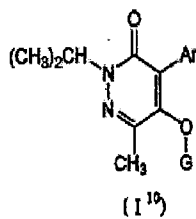
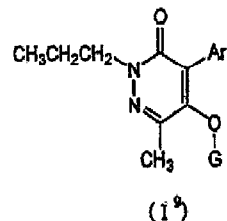
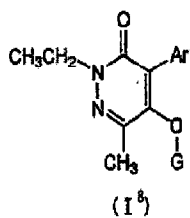
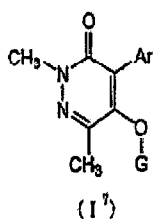
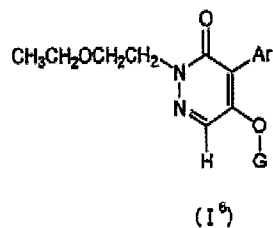
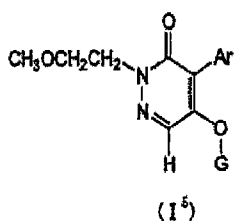
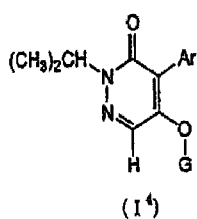
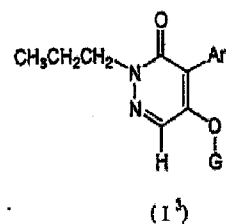
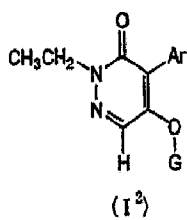
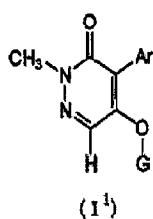
A completção da reação pode ser confirmada por um meio analítico tais como cromatografia de camada delgada, cromatografia líquida de alto desempenho ou similares após amostragem de uma parte de uma mistura de reação. Após a completção da reação, o composto representado pela fórmula (I-a-y) pode ser isolado, por exemplo, por mistura da mistura de reação com água, neutralização da mistura de reação com uma adição de um ácido, seguido por extração com um solvente orgânico, e, em seguida, secagem e concentração da camada orgânica resultante.

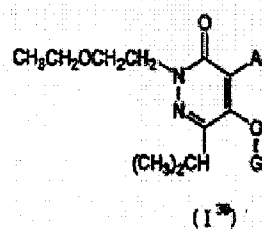
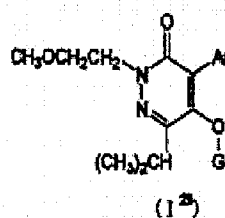
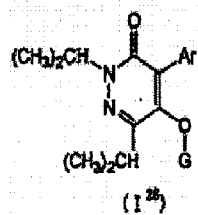
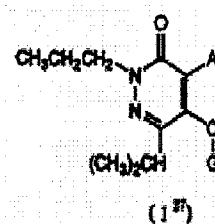
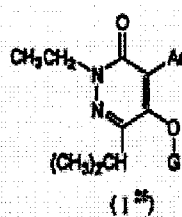
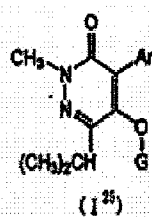
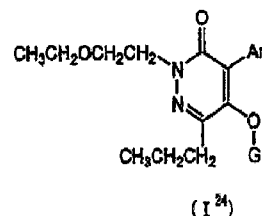
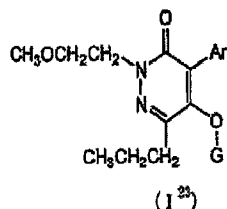
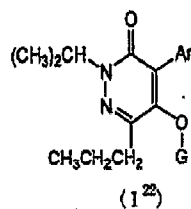
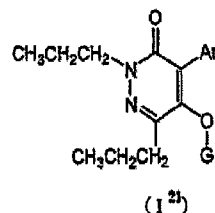
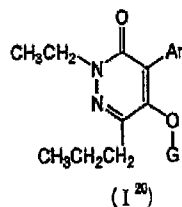
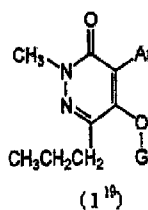
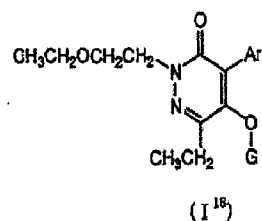
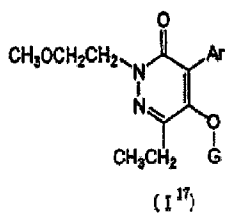
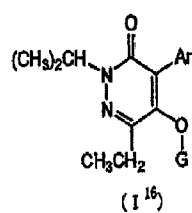
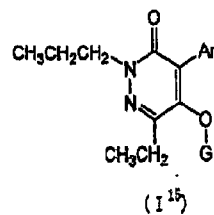
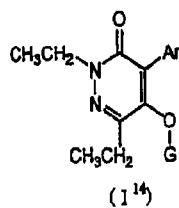
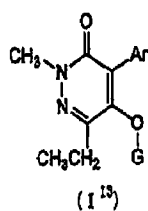
O reagente organometálico representado pela fórmula (V-e) é um composto conhecido, ou pode ser preparado de um composto conhecido de acordo com um método conhecido.

Cada composto preparado pelos Métodos de Preparação 1 a 5 pode ser também isolado e/ou purificado por outros métodos conhecidos,

tais como concentração, concentração sob pressão reduzida, extração, dissolução em solventes diferentes, cristalização, recristalização, cromatografia e similares.

Em seguida, exemplos específicos do composto da presente
5 invenção são mostrados abaixo.





1) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 4-cloro-2, 6- dietil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um

grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo meta-
5 nossulfonila, um grupo trifluorometanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

2) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 4-bromo-2, 6- dietil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um
10 grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluorometanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou
15 um grupo p-toluenossulfonila.

3) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 4-ciano-2,6- dietil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila,
20 um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluorometanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

4) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2, 6-dietil-4-metoxifenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um
30 grupo benzilcarbonila, a grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, a grupo fenoxicarbonila, a grupo dimetilaminocarbonila, a grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um

grupo p-toluenossulfonila.

5) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2, 6-dietil-4-nitrofenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluorometanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

6) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2,6-dietil-4-fenilfenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluorometanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

7) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2, 6-dietil-4-etilfenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluorometanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

8) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-ciano-4,6-dimetil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila,

um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluorometanossulfonila, um grupo benzenossulfonila
5 ou um grupo p-toluenossulfonila.

9) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-ciano-6-etil-4-metil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila,
10 um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluorometanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

15 10) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2,4-dicloro-6-metil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um
20 grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

11) Os compostos de piridazinona representados por qualquer
25 das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-cloro-4, 6-dimetil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila,
30 um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

12) Os composto de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰) , em que Ar é um grupo 2-cloro-6-etil-4-metil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

13) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2,4-dicloro-6-etil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

14) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰) , em que Ar é um grupo 2-bromo-6-etil-4-metil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

15) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰) , em que Ar é um grupo 4-cloro-2-etil-6-metoxi fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla,

um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

5 16) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-cloro-6-metóxi-4-metil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

15 17) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-etil-6-metóxi-4-metil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

20 18) Os composto de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 4-(4-clorofenil)-2,6-dietil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

30 19) Os compostos de piridazinona representados por qualquer

das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2,6-dietil-4-(4-metilfenil) fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

20) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-etil-6-etinil-4-fenil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

21) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-etil-6-metóxi-4-fenil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

22) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-cloro-6-etil-4-fenil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila,

um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

23) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2, 6-dietil-4-trifluorometil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

24) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2, 6-dietil-4-trifluorometoxi fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoroacetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

25) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-etil-6-etinil-4-metil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

26) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-cloro-6-etil-4-metoxi fenila,

e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

27) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-ciclopropil-6-etil-4-metil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo bivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

28) Os composto de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 4-ciclopropil-2,6-dietil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclofenilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

29) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 5-(4-clorofenil)-2-metil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo me-

tanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

30) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 5-(4-fluorofenil)-2-metil
5 fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila,
10 um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

31) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-bromo-4,6-dimetil fenila, e
15 G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfoni-
20 la ou grupo p-toluenossulfonila.

32) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-metóxi-4,6-dimetil fenila, e
25 G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila, um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoíla, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfoni-
la ou um grupo p-toluenossulfonila.

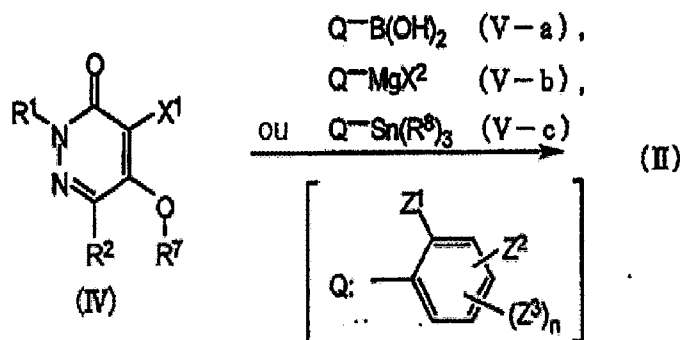
30 33) Os compostos de piridazinona representados por qualquer das fórmulas (I¹) a (I³⁰), em que Ar é um grupo 2-etinil-4,6-dimetil fenila, e G é um átomo de hidrogênio, um grupo acetila, um grupo trifluoro acetila,

um grupo propionila, um grupo butirila, um grupo isobutirila, um grupo isovalerila, um grupo pivaloila, um grupo ciclo-hexilcarbonila, um grupo benzoila, um grupo benzilcarbonila, um grupo metoxicarbonila, um grupo etoxicarbonila, um grupo fenoxicarbonila, um grupo dimetilaminocarbonila, um grupo metanossulfonila, um grupo trifluoro metanossulfonila, um grupo benzenossulfonila ou um grupo p-toluenossulfonila.

A presente invenção também inclui compostos intermediários úteis para produção do composto representado pela fórmula (I-a), o composto representado pela fórmula (II) e o composto representado pela fórmula (VI).

Método de Preparação de Referência 1

O composto representado pela fórmula (II) pode ser produzido, por exemplo, pelo seguinte método.



em que X¹ representa um grupo de partida (por exemplo, um átomo de halogênio tal como um átomo de cloro, um átomo de bromo, ou um átomo de iodo), X² representa um átomo de halogênio (por exemplo, um átomo de cloro, um átomo de bromo ou um átomo de iodo), e R¹, R², R⁷, R⁸, Z¹, Z², Z³ e n são conforme definidos acima.

Na reação, o composto representado pela fórmula (IV) pode ser submetido à reação de acoplamento com um reagente organometálico representado pela fórmula (V-a), (V-b) ou (V-c) (geralmente 1 equivalente molar ou, mais preferivelmente, 1 a 3 equivalentes molares para o composto representado pela fórmula (IV)) para preparar o composto representado pela fórmula (II).

A reação usando o composto representado pela fórmula (V-a) é

realizado em um solvente. Exemplos do solvente incluem hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno e tolueno; alcoóis tais como metanol, etanol e propanol; éteres tais como dietil éter, isopropil éter, dioxano, tetra-hidrofuran e dimetoxietano; cetonas tais como acetona e metila etil cetona; amidas tais como dimetilformamida e dimetilacetamida; sulfóxidos tais como dimetilsul-
5 fóxido; sulfonas tais como sulfolanos; água; e uma mistura destes.

A reação usando o composto representado pela fórmula (V-a) é realizada na presença de uma base. Exemplos da base incluem bases orgânicas tais como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilanilina, dimetila-
10 minopiridina e 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno; e bases inorgânicas tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, hidrogenocarbonato de sódio, carbonato de cálcio, carbonato de cério e fosfato de potássio. A quantidade da base é geralmente 0,5 a 10 equivalentes molares, preferivelmente 1 a 5 equivalentes molares para o composto representado pela fórmula (IV).
15

Adicionalmente, a reação usando o composto representado pela fórmula (V-a) é realizada na presença de um catalisador. Exemplos do catalisador incluem catalisadores de paládio tais como tetraquis(trifenilfosfina)-paládio e diclorobis(trifenilfosfina)paládio. A quantidade do catalisador é geralmente 0,001 a 0,5 equivalente molar, preferivelmente 0,01 a 0,2 equivalente molar para o composto representado pela fórmula (IV). Adicionalmente, na reação usando o composto representado pela fórmula (V-a), um sal de amônia quaternária é preferivelmente adicionado ao sistema de reação. Exemplos do sal de amônia quaternária incluem tetrabutilamônia brometo e
20 similares.
25

A temperatura de reação da reação usando o composto representado pela fórmula (V-a) é geralmente a 20 a 180°C, preferivelmente a 60 a 150°C. O tempo de reação da reação usando o composto representado pela fórmula (V-a) é geralmente de 30 minutos a 100 horas.

30 A completção da reação pode ser confirmada por um meio analítico tal como cromatografia de camada delgada, cromatografia líquida de alto desempenho ou similares após amostragem de uma parte de um mistu-

ra de reação. Após a completação da reação, o composto representado pela fórmula (II) pode ser isolado, por exemplo, por mistura da mistura de reação com água, seguido por extração com um solvente orgânico, e, em seguida, secagem e concentração da camada orgânica resultante.

5 A reação usando o composto representado pela fórmula (V-b) é realizada em um solvente. Exemplos do solvente incluem hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno e tolueno; éteres tais como dietil éter, diisopropil éter, dioxano, tetra-hidrofuran e dimetoxietano; e uma mistura destes.

10 A reação usando o composto representado pela fórmula (V-b) é realizada na presença de um catalisador. Exemplos do catalisador incluem catalisadores de níquel tais como diclorobis(1,3-difenilfosfino)propano níquel e diclorobis(trifenilfosfino)níquel; e catalisadores de paládio tais como tetraquis(trifenilfosfina)paládio e diclorobis(trifenilfosfina)paládio. A quantidade do
15 catalisador é geralmente 0,001 a 0,5 equivalentes molares, preferivelmente 0,01 a 0,2 equivalentes molares para o composto representado pela fórmula (IV).

A temperatura de reação usando o composto representado pela fórmula (V-b) é geralmente a -80 a 180°C, preferivelmente a -30 to 150°C. O
20 tempo de reação da reação usando o composto representado pela fórmula (V-b) é geralmente de 30 minutos a 100 horas.

A completação da reação pode ser confirmada por um meio analítico tal como cromatografia de camada delgada, cromatografia líquida de alto desempenho ou similares após amostragem de uma parte de uma
25 mistura de reação. Após a completação da reação, o composto representado pela fórmula (II) pode ser isolado, por exemplo, por mistura da mistura de reação com água, seguido por extração com um solvente orgânico, e, em seguida, secagem e concentração da camada orgânica resultante.

A reação usando o composto representado pela fórmula (V-c) é
30 realizada em um solvente. Exemplos do solvente incluem hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno e tolueno; éteres tais como dietil éter, diisopropil éter, dioxano, tetra-hidrofuran e dimetoxietano; hidrocarbonetos

halogenados tais como clorofórmio, 1,2-dicloroetano, etc; amidas tais como dimetilformamida e dimetilacetamida; e uma mistura destes. A reação usando o composto representado pela fórmula (V-c) é realizada na presença de um catalisador.

5 Exemplos do catalisador incluem catalisadores de paládio tais como tetraquis(trifenilfosfina)paládio, e diclorobis(trifenilfosfina) paládio. A quantidade do catalisador é geralmente 0,001 a 0,5 equivalente molar, preferivelmente 0,01 a 0,2 equivalente molar para o composto representado pela fórmula (IV).

10 A temperatura de reação da reação usando o composto representado pela fórmula (V-c) é geralmente a -20 a 180°C, preferivelmente a -30 a 150°C. O tempo de reação da reação usando o composto representado pela fórmula (V-c) é geralmente de 30 minutos a 100 horas.

A completção da reação pode ser confirmada por um meio analítico tal como cromatografia de camada delgada, cromatografia líquida de alto desempenho ou similares após amostragem de uma parte de uma mistura de reação. Após a completção da reação, o composto representado pela fórmula (II) pode ser isolado, por exemplo, por mistura da mistura de reação com água, seguido por extração com um solvente orgânico, e, em seguida, secagem e concentração da camada orgânica resultante.

15

20

O composto representado pela fórmula (II) pode ser preparado, por exemplo, por um método similar àquele descrito em Tetrahedron, Vol. 57, pp.1323-1330 (2001).

O reagente organometálico representado pela fórmula (V-a), (V-b) ou (V-c) é um composto conhecido, ou pode ser preparado de um composto conhecido de acordo com um método conhecido.

25

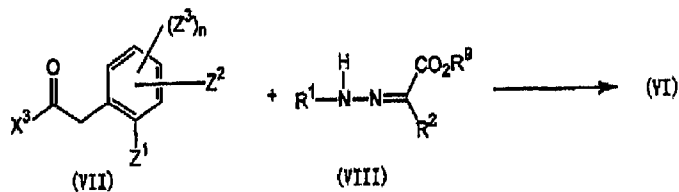
O composto representado pela fórmula (IV) é um composto conhecido, ou pode ser preparado de um composto conhecido, por exemplo, por um método descrito em J. Heterocycl. Chem., Vol. 33, pp.1579-1582 (1996), ou um método similar.

30

Método de Preparação de Referência 2

O composto representado pela fórmula (VI) pode ser preparado,

por exemplo, pelo seguinte método:



em que X^3 representa um átomo de halogênio (por exemplo, um átomo de cloro, um átomo de bromo, ou um átomo de iodo), e R^1 , R^2 , R^9 , Z^1 , Z^2 , Z^3 e n são conforme definidos acima.

- 5 A reação é geralmente realizada em um solvente. Exemplos do solvente incluem nitrilas tal como acetonitrila; cetonas tal como acetona; hidrocarbonetos aromáticos tais como benzeno e tolueno; éteres tais como dietil éter, di-isopropil éter, dioxano, tetra-hidrofuran e dimetoxietano; hidrocarbonetos halogenados tais como diclorometano, clorofórmio e 1,2-
10 dicloroetano; amidas tais como dimetilformamida e dimetilacetoamida; sulfonas tal como sulfolano; e uma mistura destas.

- A reação é geralmente realizada por reação de um composto representado pela fórmula (VII) com um composto representado pela fórmula (VIII) na presença de uma base. Exemplos da base na reação incluem bases
15 orgânicas tais como trietilamina, tripropilamina, piridina, dimetilaminopiridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno e 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano; e bases inorgânicas tais como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de cálcio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, hidrogenocarbonato de sódio, carbonato de cálcio e hidreto de sódio.

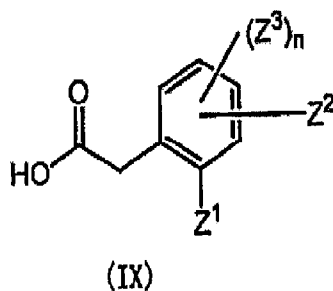
- 20 Na reação, o composto representado pela fórmula (VIII) é geralmente usado em uma quantidade de 1 equivalente molar ou mais, preferivelmente 1 a 3 equivalentes molares para o composto representado pela fórmula (VII). A quantidade da base usada é geralmente 0,5 a 10 equivalentes molares, preferivelmente 1 a 5 equivalentes molares para o composto
25 representado pela fórmula (VII).

 A temperatura de reação é geralmente a -30 a 180°C , preferivelmente a -10 a 50°C . O tempo de reação é geralmente de 10 minutos a 30

horas.

A completação da reação pode ser confirmada por um meio analítico tal como cromatografia de camada delgada, cromatografia líquida de alto desempenho ou similares após amostragem de uma parte de uma mistura de reação. Após a completação da reação, o composto representado pela fórmula (VI) pode ser isolado, por exemplo, por mistura da mistura de reação com água, seguido por extração com um solvente orgânico, e, em seguida, secagem e concentração da camada orgânica resultante.

O composto representado pela fórmula (VII) pode ser preparado por reação de um composto representado pela fórmula (IX):



em que Z^1 , Z^2 , Z^3 e n são conforme definidos acima, com um agente de halogenação (por exemplo, tionil cloreto, tionil brometo, oxicloreto de fósforo ou oxalil cloreto).

O composto representado pela fórmula (IX) é um composto conhecido, ou pode ser preparado de um composto conhecido, por exemplo, por um método descrito em W096/25395, W096/35664, WO97/02243, W099/43649, WO2001/017973, WO2004/065366, WO2004/080962, WO2005/016873, WO2005/044796, WO2005/092897 ou WO2006/056281, ou um método similar.

Exemplos do composto representado pela fórmula (IX) inclui 4-cloro-2,6-diácido etilfenilacético, 4-bromo-2,6-diácido etilfenilacético, 4-ciano-2,6-diácido etilfenilacético, 2,6-dietil-4-ácido metoxofenilacético, 2,6-dietil-4-ácido fenilfenilacético, 4-(4-clorofenil)-2,6-diácido etilfenilacético, 2,6-dietil-4-(4-ácido metilfenil)fenilacético, ácido 2,6-dietil-4-etilfenilacético, ácido 2,6-dietil-4-nitrofenilacético, 2-ciano-4,6-diácido metilfenilacético, 2-ciano-6-etil-4-ácido metilfenilacético, 2,4-dicloro-6-ácido metilfenilacético, 2-cloro-4,6-

diácido metilfenilacético, 2-cloro-6-etil-4-ácido metilfenilacético, 2,4-dicloro-6-ácido etilfenilacético, 2-bromo-6-etil-4-ácido metilfenilacético, 4-cloro-2-etil-6-ácido metoxofenilacético, 2-cloro-6-metóxi-4-ácido metilfenilacético, 2-etil-6-metóxi-4-ácido metilfenilacético, 2-etil-6-etinil-4-ácido fenilfenilacético, 2-cloro-6-etil-4-ácido fenilfenilacético, 2-etil-6-metóxi-4-ácido fenilfenilacético, 2,6-dietil-4-trifluoroácido metilfenilacético, 2,6-dietil-4-trifluoroácido metoxofenilacético, 2-etil-6-etinil-4-5 ácido metilfenilacético, 2-cloro-6-etil-4-ácido metoxofenilacético, 2-ciclopropil-6-etil-4-ácido metilfenilacético, 4-ciclopropil-2,6-diácido etilfenilacético, 5-(4-clorofenil)-2-ácido metilfenilacético, 5-(4-fluorofenil)-2-ácido metilfenilacético, 2-bromo-4,6-diácido metilfenilacético, 2-metóxi-4,6-diácido metilfenilacético e 2-etinil-4,6-diácido metilfenilacético.

O composto representado pela fórmula (VIII) é um composto conhecido, ou pode ser preparado de um composto conhecido.

Cada composto preparado pelos Métodos de Preparação de Referência 1 a 2 pode ser também isolado e/ou purificado por outros métodos conhecidos, tais como concentração, concentração sob pressão reduzida, extração, dissolução em solventes diferentes, cristalização, recristalização, cromatografia e similares.

Exemplos do composto representado pela fórmula (II) incluem os seguintes compostos.

Um composto representado pela fórmula (II), em que n é 1, 2 ou 3.

Um composto representado pela fórmula (II), em que Z é fixado à posição 4- ou 6- no anel benzeno.

Um composto representado pela fórmula (II), em que n é 1, e Z^2 e Z^3 são respectivamente fixados às posições 4- e 6- ou às posições 6 e 4 no anel benzeno.

Um composto representado pela fórmula (II), em que R^1 é um grupo alquil C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquil C_{1-3} .

Um composto representado pela fórmula (II), em que R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo alquil C_{1-3} . Um composto representado pela fórmula (II), em que R^2 é um átomo de hidrogênio ou a grupo metila.

Um composto representado pela fórmula (II), em que Z^1 é um grupo alquil C_{1-3} , Z^2 é um grupo cicloalquil C_{3-6} , um grupo alquinil C_{2-3} , um grupo alquiloxi C_{1-3} , um grupo haloalquil C_{1-3} , um grupo haloalquiloxi C_{1-3} , um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou grupo fenil que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquil C_{1-3} , e Z^3 é um grupo alquil C_{1-3} , um grupo cicloalquil C_{3-6} , um grupo alquinil C_{2-3} , um grupo alquiloxi C_{1-3} ou um átomo de halogênio.

Um composto representado pela fórmula (II), em que R^1 é um grupo alquil C_{1-3} ou um (C_{3-3} alquiloxi) grupo alquil C_{1-3} , e R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila.

Um composto representado pela fórmula (II), em que R^1 é um grupo alquil C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquil C_{1-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo alquil C_{1-3} , n é 1, Z^2 e Z^3 são respectivamente fixados às posições 4- e 6- ou às posições 6 e 4 no anel benzeno, Z^1 é um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquil C_{1-3}), Z^2 é um grupo cicloalquil C_{3-8} (mais preferivelmente um grupo cicloalquil C_{3-6}), um grupo alquinil C_{2-6} (mais preferivelmente um grupo alquinil C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquiloxi C_{1-3}), um grupo haloalquil C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo haloalquil C_{1-3}), um grupo haloalquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo haloalquiloxi C_{1-3}), um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo aril C_{5-10} (mais preferivelmente um grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquil C_{1-3}), e Z^3 é um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquil C_{1-3}), um grupo cicloalquil C_{3-8} (mais preferivelmente um grupo cicloalquil C_{3-6}), um grupo alquinil C_{2-6} (mais preferivelmente um grupo alquinil C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-5} (mais preferivelmente um grupo alquiloxi C_{1-3}) ou um átomo de halogênio.

Um composto representado pela fórmula (II), em que R^1 é um grupo alquil C_{1-3} ou um (C_{-3} alquiloxi) grupo alquil C_{-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, n é 1, Z^2 e Z^3 são respectivamente fixados às

posições 4- e 6- ou às posições 6 e 4 no anel benzeno, Z^1 é um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}), Z^2 é um grupo cicloalquil C_{3-8} (mais preferivelmente, um grupo cicloalquil C_{3-6}), um grupo alquinil C_{2-6} (mais preferivelmente um grupo alquinil C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo alquiloxi C_{1-3}), um grupo haloalquil C_{1-6} (mais preferivelmente um grupo haloalquil C_{1-3}), um grupo haloalquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo haloalquiloxi C_{1-3}), um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo aril C_{6-10} (mais preferivelmente um grupo fenil) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}), e Z^3 é um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}), um grupo cicloalquil C_{3-8} (mais preferivelmente, um grupo cicloalquil C_{3-6}), um grupo alquinil C_{2-6} (mais preferivelmente, um grupo alquinil C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquiloxi C_{1-3}), ou um átomo de halogênio.

Um composto representado pela fórmula (II), em que n é 0, e Z^2 é fixado à posição 5 no anel benzeno.

Um composto representado pela fórmula (II), em que R^1 é um grupo alquil C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquil C_{3-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo alquil C_{1-3} , n é 0, Z^2 é fixado à posição 5- no anel benzeno, Z^1 é um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}), e Z^2 é um grupo aril C_{6-10} (mais preferivelmente, um grupo fenil) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}).

Um composto representado pela fórmula (II), em que R^1 é um grupo alquil C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquil C_{1-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, n é 0, Z^2 é fixado à posição 5 no anel benzeno, Z^1 é um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}), e Z^2 é um grupo aril C_{6-10} (mais preferivelmente um grupo fenil) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmen-

te, um grupo alquil C_{1-3}).

Exemplos dos compostos representados pela fórmula (VI) incluem os seguintes compostos. Um composto representado pela fórmula (VI), em que n é 1, 2 ou 3.

5 Um composto representado pela fórmula (VI), em que Z^2 é fixado à posição 4- ou 6 no anel benzeno.

Um composto representado pela fórmula (VI), em que n é 1, e Z^2 e Z^3 são respectivamente fixados às posições 4- e 6- ou às posições 6 e 4 no anel benzeno.

10 Um composto representado pela fórmula (VI), em que R^1 é um grupo alquil C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquil C_{1-3} .

Um composto representado pela fórmula (VI), em que R^2 é um grupo alquil C_{1-6} . Um composto representado pela fórmula (VI), em que R é um átomo de hidrogênio ou um grupo alquil C_{1-3} .

15 Um composto representado pela fórmula (VI), em que R^2 é um grupo alquil C_{1-3} .

Um composto representado pela fórmula (VI), em que R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila.

20 Um composto representado pela fórmula (VI), em que R^2 é um grupo metila.

Um composto representado pela fórmula (VI), em que Z^1 é um grupo alquil C_{1-3} , Z^2 é um grupo cicloalquil C_{3-6} , um grupo alquinil C_{2-3} , um grupo alquiloxi C_{1-3} , um grupo haloalquil C_{1-3} , um grupo haloalquiloxi C_{1-3} , um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo fenil que
25 pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquil C_{1-3} , e Z^3 é um grupo alquil C_{1-3} , um grupo cicloalquil C_{3-6} , um grupo alquinil C_{2-3} , um grupo alquiloxi grupo C_{1-3} ou um átomo de halogênio.

30 Um composto representado pela fórmula (VI), em que R^1 é um grupo alquil C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquil C_{1-3} , e R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila.

Um composto representado pela fórmula (VI), em que R^1 é um

grupo alquil C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquil C_{1-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo alquil C_{1-3} , n é 1, Z^2 e Z^3 são respectivamente fixados às posições 4- e 6- ou às posições 6 e 4 no anel benzeno, Z^1 é um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}), Z^2 é um grupo cicloalquil C_{3-8} (mais preferivelmente, um grupo cicloalquil C_{3-6}), um grupo alquil C_{2-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquiloxi C_{1-3}), um grupo haloalquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo haloalquil C_{1-3}), um grupo haloalquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo haloalquiloxi C_{1-3}), um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo aril C_{6-10} (mais preferivelmente, um grupo fenila) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}), e Z^3 é um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}), um grupo cicloalquil C_{3-8} (mais preferivelmente, um grupo cicloalquil C_{3-5}), um grupo alquil C_{2-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquiloxi C_{3-3}), ou um átomo de halogênio.

Um composto representado pela fórmula (VI), em que R^1 é um grupo alquil C_{1-3} ou um (C_{1-3} alquiloxi) grupo alquil C_{1-3} , R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, n é 1, Z^2 e Z^3 são respectivamente fixados às posições 4- e 6- ou às posições 6 e 4 no anel benzeno, Z^1 é um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}), Z^2 é um grupo cicloalquil C_{3-8} (mais preferivelmente, um grupo cicloalquil C_{3-6}), um grupo alquil C_{2-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{2-3}), um grupo alquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquiloxi C_{1-3}), um grupo haloalquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo haloalquil C_{1-3}), um grupo haloalquiloxi C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo haloalquiloxi C_{1-3}), um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo nitro, ou um grupo aril C_{6-10} (mais preferivelmente, um grupo fenil) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquil C_{1-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}), e Z^3 é um grupo alquil C_{3-6} (mais preferivelmente, um grupo alquil C_{1-3}), um grupo cicloalquil C_{3-8} (mais

preferivelmente, um grupo cicloalquil C₃₋₆), um grupo alquil C₂₋₆ (mais preferivelmente, um grupo alquil C₂₋₃), um alquiloxi grupo C₁₋₆ (mais preferivelmente, um grupo alquiloxi C₁₋₃) ou um átomo de halogênio.

Um composto representado pela fórmula (VI), em que n é 0, e Z² é fixado à posição 5 no anel benzeno.

Um composto representado pela fórmula (VI), em que R¹ é um grupo alquil C₁₋₃ ou um (C₁₋₃ alquiloxi) grupo alquil C₁₋₃, R² é um átomo de hidrogênio ou um grupo alquil C₁₋₃, n é 0, Z² é fixado à posição 5 no anel benzeno, Z¹ é um grupo alquil C₁₋₆ (mais preferivelmente, um grupo alquil C₁₋₃), e Z² é um grupo aril C₆₋₁₀ (mais preferivelmente, um grupo fenil) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquil C₁₋₆ (mais preferivelmente, um grupo alquil C₁₋₃).

Um composto representado pela fórmula (VI), em que R¹ é um grupo alquil C₁₋₃ ou um (C₁₋₃ alquiloxi) grupo alquil C₁₋₃, R² é um átomo de hidrogênio ou um grupo metila, n é 0, Z² é fixado à posição 5 no anel benzeno, Z¹ é um grupo alquil C₁₋₆ (mais preferivelmente, um grupo alquil C₁₋₃), e Z² é um grupo aril C₆₋₁₀ (mais preferivelmente, um grupo fenil) que pode ser substituído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo alquil C₁₋₆ (mais preferivelmente, um grupo alquil C₁₋₃).

Exemplos

A presente invenção será adicionalmente especificamente ilustrada pelos seguintes Exemplos, Exemplos de referência, Exemplos de formulação e Exemplos teste; contudo, a presente invenção não está limitada a estes exemplos.

Nos Exemplos e Exemplos de referência, temperatura ambiente significa usualmente 10 a 30°C. ¹H RMN significa ressonância magnética nuclear de próton. Tetrametilsilano foi usado como um padrão interno e alteração química (5) foi mostrado como ppm. As abreviações usadas nos Exemplos e Exemplos de referência têm os seguintes significados.

CDCl₃: clorofórmio-d, s: simples, d: duplo, t: triplo, qr quarto, m:

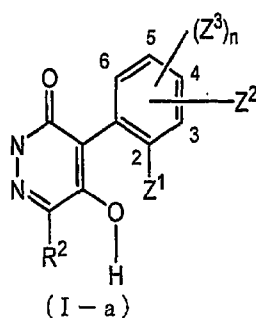
múltiplo, br.: amplo, J: constante de acoplamento, Me: metila, Et: etila, c-Pr: ciclopropila, Ph: fenila, 4-Me-Ph: 4-metilfenila, 4-Cl-Ph: 4-clorofenila.

Exemplo 1

5 4-(4-Cloro-2,6-dietilfenil)-5-hidróxi-2,6-dimetil-
3(2H)-piridazinona (composto I-a-2)

Uma solução de 0,55 g de potássio terc-butóxido em 20 mL de tetra-hidrofurano foi agitada a 36 a 38°C sob atmosfera de nitrogênio. À solução foi adicionada gota a gota uma solução de 0,79 g de etil 2-[2-(4-cloro-2,6-dietilfenilacetil)-2-metilhidrazono]propanoato (composto VI-2) em 15 mL de tolueno sobre cerca de 20 minutos. A mistura foi adicionalmente agitada na mesma temperatura por 10 minutos. Em seguida, a mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foi adicionado 20 mL de água gelada, seguido por extração com terc-butil metil éter (20 mL x 2). Uma camada aquosa foi acidificada por uma adição de 0,6 g de 35% de ácido hidrocloreto, seguido por extração com acetato de etila (20 mL x 2). Os extratos de acetato de etila foram combinados, lavados com uma solução de cloreto de sódio saturada (20 mL x 2), secados sobre sulfato de magnésio anidro, e, em seguida, concentrados sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido à cromatografia de sílica-gel (acetato de etila:hexano =1:4) para dar 0,1 g de um sólido. O sólido foi lavado com um solvente de mistura de acetato de etila-hexano (1:10) e secado a ar para dar 0,07 g do composto do título como um pó branco.

Os compostos da presente invenção representados pela fórmula (I-a) foram preparados pelo procedimento similar ao Exemplo 1 e são mostrados na Tabela 1, junto com o composto I-a-2. O composto representado pela fórmula (I-a):



[Tabela 1]

No.	R ¹	R ²	Z ¹	Z ²	(Z ³) _n	Ponto de fusão /°C
I-a-1	Me	Me	Et	4-Ph	6-Et	231-232
I-a-2	Me	Me	Et	4-Cl	6-Et	234-235
I-a-3	Me	Me	Et	4-OMe	6-Et	205-206
I-a-4	Me	Me	Et	4-Br	6-Et	251-252
I-a-5	Me	Me	Et	4-CN	6-Et	243-245
I-a-6	Me	Me	Et	4-CF ₃	6-Et	270-271
I-a-7	Me	Me	Et	4-OCF ₃	6-Et	230-231
I-a-8	Me	Me	Et	4-(c-Pr)	6-Et	217-218
I-a-9	Me	Me	Et	4-(4-Me-Ph)	6-Et	214-215
I-a-10	Me	Me	Me	5-(4-Cl-Ph)	-	234-236
I-a-11	Me	Me	Me	6-Br	4-Me	220-221

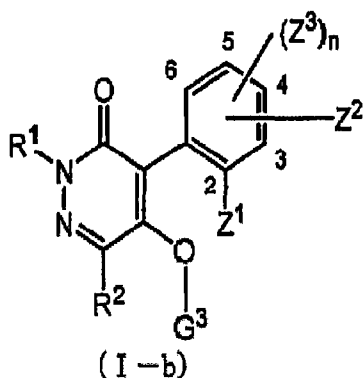
Exemplo 2

5-Acetóxi-4-(2,6-dietil-4-fenilfenil)-2,6-dimetil-
3(2H)-piridazinona (composto I-b-1)

- 5 A uma solução de 0,04 g do composto I-a-1 (preparado pelo procedimento similar ao Exemplo 1) em 10 mL de tetra-hidrofurano foram adicionados 0,03 g de trietilamina, 0,02 g de anidrido acético e, em seguida, 2 mg de 4-dimetilaminopiridina. A mistura foi agitada à temperatura ambiente por 9,5 horas. A solução de reação foi concentrada sob pressão reduzida.
- 10 Ao resíduo foi adicionado 10 mL de água gelada, seguido por extração com acetato de etila (10 mL x 3). Os extratos foram combinados, lavados com uma solução de cloreto de sódio aquosa saturada (10 mL x 2), secados sobre sulfato de magnésio anidro, e, em seguida, concentrados sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido à cromatografia de sílica-gel (etil acetate-rhexano =1:6) para dar 0,05 g de um sólido. O sólido foi lavado com hexano frio e ar seco para dar 0,025 g do composto do título como um pó branco.
- 15

Os compostos da presente invenção representados pela fórmula (I-b) foram preparados pelo procedimento similar ao Exemplo 2 e são mostrados na Tabela 2, junto com o composto I-b-1. O composto representado pela fórmula (I-b):

20



[Tabela 2]

No.	R ¹	R ²	Z ¹	Z ²	(Z ³) _n	G ³	Ponto de fusão /°C
I-b-1	Me	Me	Et	4-Ph	6-Et	COMe	125-127
I-b-2	Me	Me	Et	4-Br	6-Et	CO ₂ Me	125-127
I-b-3	Me	Me	Et	4- (c-Pr)	6-Et	CO ₂ Me	102-103
I-b-4	Me	Me	Et	4- (4-Me-Ph)	6-Et	COMe	153-155
I-b-5	Me	Me	Me	5-(4-Cl-Ph)	-	COMe	153-154
I-b-6	Me	Me	Me	6-Br	4-Me	CO ₂ Me	114-115

Exemplo 3

4-(2,6-Dietil-4-etinilfenil)-5-hidróxi-2,6-dimetil-3(2H)-piridazinona
(composto I-a-20)

- 5 Um gás nitrogênio seco foi soprado em uma solução de 0,49 g do composto I-b-2 (preparado pelo procedimento similar ao Exemplo 2) e 0,56 g de tributil(trimetilsililetinil)estanho em 10 mL de tolueno por 70 minutos. À solução de reação foi adicionado 0,08 g de tetraquis(trifenilfosfina) paládio. A mistura foi agitada a 100 a 110°C sob atmosfera de nitrogênio seco por 5
- 10 horas. Após resfriamento, matérias insolúveis foram filtradas da mistura de reação. O filtrado foi concentrado sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido à cromatografia de sílica-gel (acetato de etila:hexano =1:8) para dar 0,43 g de 4-(2,6-dietil-4-trimetilsililetinilfenil)-5-metoxicarbonilóxi-2,6-dimetil-3(2H)-piridazinona como uma resina amarela.

- 15 ¹H RMN (CDCl₃) 5 ppm: 0,26 (9H, s), 1,12 (6H, t, J = 7,6 Hz),

2,29 (3H, s), 2,26-2,43 (4H, m), 3,68 (3H, s), 3,81 (3H, s), 7,27 (2H, s).

O produto foi dissolvido em 15 mL de etanol e agitado sob resfriamento com gelo, e uma solução de 0,13 g de 95,0% de hidróxido de sódio em 2 mL de água foi adicionada. A solução de reação foi agitada à temperatura ambiente por 22,5 horas, e, em seguida, concentrada sob pressão redu-
 5 zida. Ao resíduo foi adicionado 20 mL de água gelada, seguido por extração com terc-butil metil éter (20 mL). Uma camada aquosa foi acidificada por uma adição de 1,5 mL de ácido hidrocloreto a 3N, seguido por extração com acetato de etila (20 mL, 10 mL). Os extratos de acetato de etila foram com-
 10 binados, lavados com uma solução aquosa concentrada de cloreto de sódio (20 mL x 2), secados sobre sulfato de magnésio anidro, e, em seguida, concentrados sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido à cromatografia de sílica-gel (acetato de etila:hexano = 1:3) para dar 0,15 g de um sólido. O sólido foi lavado com um solvente de mistura de acetato de etila-hexano (1:10)
 15 e ar seco para dar 0,13 g do composto do título como um pó branco, p.f 216-217°C.

Exemplo 4

4-(2-Etínil-4,6-dimetilfenil)-5-hidróxi-2,6-dimetil- 3(2H)-
 piridazinona (composto I-a-21)

20 Do composto I-b-6 (preparado pelo procedimento similar ao Ex-
 2), 4-(4,6-dimetil-2-trimetilsililetinilfenil)-5-metoxicarbonilóxi-2,6-
 dimetil-3(2H)-piridazinona foi preparado como um sólido marrom claro pelo
 procedimento similar ao Exemplo 3, ¹H RMN (CDCl₃) 5 ppm: 0,07 (9H, s),
 2,13 (3H, s), 2,29 (6H, s), 3,69 (3H, s), 3,81 (3H, s), 7,03 (1H, s), 7,19 (1H, s),
 25 Além disso, deste produto, o composto do título foi preparado como um pó
 branco pelo procedimento similar ao Exemplo 3, p.f 179-181°C.

Um exemplo de preparação típico do composto representado
 pela fórmula (VI) é mostrado no Exemplo de Referência 1.

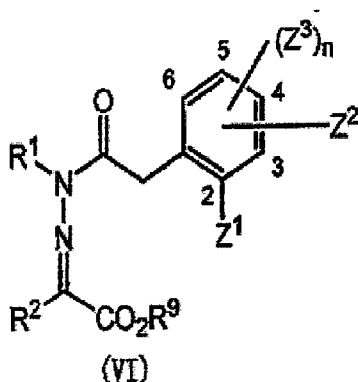
Exemplo de Referência 1

30 2-[2-(4-cloro-2,6-dietilfenilacetil)-2-metilhidrazono]propanoato de
 etila(composto VI-2)

A uma solução de 1,1 g de 2-(metilhidrazono)propanoato de etila

em 20 mL de acetonitrila foi adicionado 0,68 g de carbonato de potássio. A mistura foi agitada sob resfriamento de gelo. À mistura foi adicionada gota a gota uma solução de 1,26 g de 4-cloro-2,6-dietilfenilacetil cloreto em 8 mL de acetonitrila por cerca de 10 minutos. A mistura foi adicionalmente agitada a temperatura ambiente por 3 horas. Em seguida, a mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo foi adicionado 20 mL de água gelada, seguido por extração com acetato de etila (20 mL, 10 mL x 2). Os extratos foram combinados, lavados com uma solução de cloreto de sódio aquosa saturada (20 mL x 2), secada sobre sulfato de sódio anidro, e, em seguida, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi submetido à cromatografia de coluna de alumina básica (acetato de etila:hexano = 1:6) para dar 1,2 g de um sólido amarelo-claro. O sólido foi lavado com hexano frio e secado com ar para dar 0,79 g do composto do título como um pó branco.

Os compostos representados pela fórmula (VI) foram preparados pelo procedimento similar ao Exemplo de Referência 1, e são mostrados na Tabela 3, junto com o composto VI-2. O composto representado pela fórmula (VI):



[Tabela 3]

Nº	R ¹	R ²	Z ¹	Z ²	(Z ³) _n	R ⁹	Ponto de fusão °C
VI-1	Me	Me	Et	4-Ph	6-Et	Et	75-78
VI-2	Me	Me	Et	4-C1	6-Et	Et	85-89
VI-3	Me	Me	Et	4-OMe	6-Et	Et	*
VI-4	Me	Me	Et	4-Br	6-Et	Et	80-84
VI-5'	Me	Me	Et	4-CN	6-Et	Et	*

Nº	R ¹	R ²	Z ¹	Z ²	(Z ³) _n	R ⁹	Ponto de fusão	°C
VI-6	Me	Me	Et	4-CF ₃	6-Et	Et	90-91	
VI-7	Me	Me	Et	4-OCF ₃	6-Et	Et	75-76	
VI-8	Me	Me	Et	4- (c-Pr)	6-Et	Et	*	
VI-9	Me	Me	Et	4- (4-Me-Ph)	6-Et	Et	*	
VI-10	Me	Me	Me	5-(4-Cl-Ph)	-	Et	•k	
VI-11	Me	Me	Me	6-Br	4-Me	Et	*	

Com relação aos compostos marcados com asterisco (*) na coluna de ponto de fusão da Tabela 3, dados de ¹H RMN são mostrados abaixo,

Composto VI-3:

- 5 ¹H RMN (CDCl₃) 5 ppm: 1,18 (6H, t, J=7,6Hz), 1,36 (3H, t, J=7,1Hz), 2,31 (3H, br,s), 2,57 (4H, q, J=7,4Hz), 3,40 (3H, br,s), 3,79 (3H, s), 4,01 (2H, br,s), 4,33 (2H, q, J=7,1Hz), 6,64 (2H, s).

Composto VI-5:

- 10 ¹H RMN (CDCl₃) 5 ppm: 1,20 (6H, t, J=7,6Hz), 1,37 (3H, t, J=7,1Hz), 2,34 (3H, s), 2,61 (4H, q, J=7,5Hz), 3,41 (3H, s), 4,12 (2H, s), 4,34 (2H, q, J=7,1Hz), 7,36 (2H, s).

Composto VI-8:

- 15 ¹H RMN (CDCl₃) 5 ppm: 0,62-0,73 (2H, m) , 0,85-0,95 (2H, m), 1,17 (6H, t, J=7,6Hz), 1,35 (3H, t, J=7,1Hz), 1,79-1,90 (1H, m) , 2,31 (3H, br,s), 2,55 (4H, q, J=7,6Hz), 3,39 (3H, br,s), 4,04 (2H, br,s), 4,32 (2H, q, J=7,1Hz), 6,78 (2H, s).

Composto VI-9:

- 20 ¹H RMN (CDCl₃) 5 ppm: 1,23 (6H, t, J=7,6Hz), 1,36 (3H, t, J=7,2Hz), 2,33 (3H, br,s), 2,39 (3H, s), 2,65 (4H, q, J=7,6Hz), 3,42 (3H, br,s), 4,12 (2H, br,s), 4,33 (2H, q, J=7,1Hz), 7,23 (2H, d, J=8,0Hz), 7,28 (2H, s), 7,49 (2H, d, J=8,3Hz).

Composto VI-10:

- 25 ¹H RMN (CDCl₃) 5 ppm: 1,33 (3H, t, J=7,2Hz), 2,21 (3H, s), 2,35 (3H, s), 3,37 (3H, s), 4,06 (2H, br,s), 4,28 (2H, q, J=7,1Hz), 7,22 (1H, d, J=7,8Hz), 7,30-7,40 (3H, m), 7,43 (1H, br,s), 7,47 (2H, d, J=8,3Hz).

Composto VI-11:

¹H RMN (CDCl₃) 5 ppm: 1,37 (3H, t, J=7,1Hz), 2,20-2,39 (9H, m), 3,40 (3H, br,s), 4,16 (2H, br,s), 4,33 (2H, q, J=7,2Hz), 6,94 (1H, br,s), 7,25 (1H, br,s).

5 Exemplo de Formulação 1

Concentrado emulsificável

Composto I-a-1 20% em peso

Polioxietileno alquila éter 5% em peso

Dimetilformamida 18% em peso

10 Xileno 57% em peso

Os ingredientes listados acima são misturados para obter um concentrado emulsificável. O concentrado emulsificável preparado é diluído com água apropriadamente antes de uso.

15 Cada um dos compostos I-a-2 a I-a-11, I-a-20, I-a-21 e I-b-1 a I-b-6 é usado ao invés do composto I-a-1 para obter um concentrado emulsificável de cada composto.

Exemplo de Formulação 2

Pó umedecível

Composto I-b-1 50% em peso

20 Lignina sulfonato de sódio 5% em peso

Polioxietileno alquil éter 5% em peso

Carbono branco 5% em peso

Argila 35% em peso

25 Os ingredientes acima listados pulverizados e misturados para obter um pó umedecível. O pó umedecível preparado é diluído com água apropriadamente antes de uso.

Cada um dos compostos I-a-1 a I-a-11, I-a-20, I-a-21 e I-b-2 a I-b-6 é usado ao invés do composto I-b-1 para obter um pó umedecível de cada composto.

30 Exemplo de Formulação 3

Grânulo

Composto I-a-2 1,5% em peso

Lignina sulfonato de sódio	2% em peso
Talco	40% em peso
Bentonita	56,5% em peso

5 Os ingredientes listados acima são misturados, amassados com água e, em seguida, granulados para obter um grânulo.

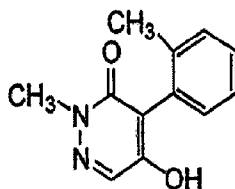
Cada um dos compostos I-a-1, I-a-3 a I-a-11, I-a-20, I-a-21 e I-b-1 a I-b-6 é usado ao invés do composto I-a-2 para obter um grânulo de cada composto.

Exemplo de Teste 1

10 Tratamento de teste pós-emergência em campo seco

Um pote plástico com diâmetro de 8 cm e uma profundidade de 6,5 cm foi preenchido com solo comercialmente disponível. Sementes de *Lolium multiflorum* foram semeadas no pote, cobertas com solo cerca de 0,5 cm de espessura e, em seguida, crescidas em estufa. Quando as plantas foram crescidas no primeiro e segundo estágio de folha, uma formulação líquida diluída contendo uma quantidade prescrita do composto I-a-2 foi pulverizada nas plantas uniformemente. A formulação líquida diluída foi preparada por dissolução de uma quantidade prescrita do composto I-a-2 em uma solução 2% de Tween 20 (polioxietileno sorbitano éster de ácido graxo, MP Biomedicals, Inc.) em dimetilformamida e, em seguida, diluindo a solução com água deionizada. Após o tratamento, as plantas foram crescidas em uma estufa. Vinte dias após tratamento, o efeito de controle do composto em *Lolium multiflorum* foi visualmente avaliado. O efeito foi classificado em 11 níveis, de 0 a 10 (0 representa "nenhum efeito"; 10 representa "morte completa"; e um estado da planta entre estes é classificado em níveis de 1 a 9).

Os outros compostos da presente invenção, e Composto A descritos em J, Heterocycl, Chem., vol, 42, pp, 427-435 (2005) como um exemplo comparativo foram similarmente testados.



Exemplo Comparativo (Composto A)

Como um resultado, os compostos I-a-1, I-a-2, I-a-3, I-a-4, I-a-6, I-a-7, I-a-8, I-a-9, I-a-20, I-b-1 e I-b-4 mostraram um efeito de 7 ou mais em uma quantidade de tratamento de 250 g/ha. Em contraste, o Composto A
5 mostrou um efeito de 1 em uma quantidade de tratamento de 500 g/ha.

Exemplo de Teste 2

Teste de tratamento de pré-emergência em campo seco

Um recipiente plástico (32 cm x 22 cm x 8 cm de altura) foi preenchido com solo esterilizado por vapor. Sementes de *Apera spica-venti* fo-
10 ram semeadas no recipient e cobertas com solo cerca de 0,5 cm de espesura. Em seguida, uma formulação líquida diluída contendo uma quantidade prescrita do composto I-a-1 foi pulverizada na superfície do solo uniformemente. A formulação líquida diluída foi preparada pelo método similar àquele no Exemplo de Teste 1. Após o tratamento, as plantas foram crescidas em
15 uma estufa. Três semanas após tratamento, o efeito de controle do composto em *Apera spica-venti* foi visualmente avaliado. O efeito foi classificado em 11 níveis, de 0 a 10 similarmente ao Exemplo de Teste 1.

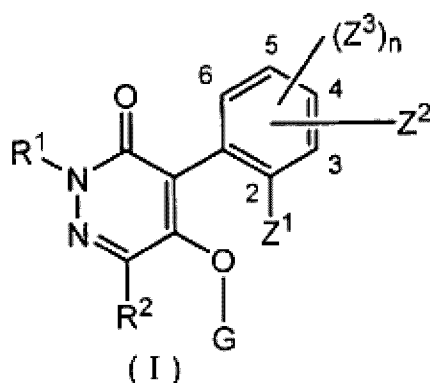
Os outros compostos da presente invenção e Composto A como um exemplo comparativo foram similarmente testados. Como um resultado,
20 o composto I-a-1, I-a-4, I-a-6, I-a-7, I-a-8, I-a-9, I-a-10, I-a-20, I-b-3, I-b-4 e I-b-5 mostraram um efeito de 8 ou mais a uma quantidade de tratamento de 250 g/ha. O composto I-b-1 mostrou um efeito de 8 ou mais a uma quantidade de de tratamento de 125 g/ha. Em contraste, Composto A mostrou um efeito de 1 a uma quantidade de tratamento de 500 g/ha.

25 Aplicabilidade Industrial

De acordo com a presente invenção, ervas daninhas podem ser controladas por aplicação de uma quantidade eficaz do composto da presente invenção às ervas daninhas ou solo onde as ervas daninhas são desenvolvidas.

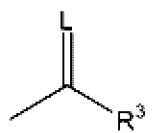
REIVINDICAÇÕES

1. Composto de piridazinona, caracterizado pelo fato de que é representado pela fórmula (I):



em que

- 5 R¹ representa um grupo C₁₋₆ alquila;
 R² representa um grupo C₁₋₆ alquila;
 G representa um átomo de hidrogênio ou um grupo representa-
do pela seguinte fórmula:



- em que L representa um átomo de oxigênio,
10 R³ representa um grupo C₁₋₆ alquila, ou um grupo C₁₋₆ alquiloxi,
 Z¹ representa um grupo C₁₋₆ alquila;
 Z² representa um grupo C₃₋₈ cicloalquila, um grupo C₂₋₆ alquinila,
um grupo C₁₋₆ alquiloxi, um grupo C₁₋₆ haloalquila, um grupo C₁₋₆ haloalqui-
loxi, um átomo de halogênio, um grupo C₆₋₁₀ arila, ou um grupo ciano, e
15 Z³ representa um grupo C₁₋₆ alquila,
 em que o grupo C₆₋₁₀ arila representado por Z² pode ser substitu-
ído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em
um átomo de halogênio e um grupo C₁₋₆ alquila; e
 n representa 1.
20 2. Composto de piridazinona de acordo com a reivindicação 1,
caracterizado pelo fato de que Z² é fixado à posição 4 ou 6 no anel benzeno.
 3. Composto de piridazinona de acordo a reivindicação 1, carac-

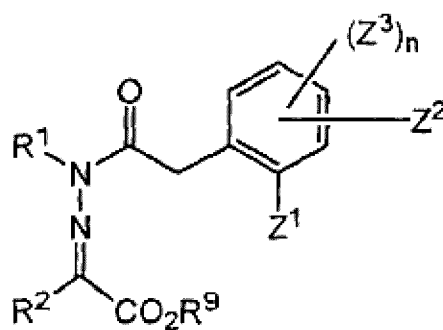
terizado pelo fato de que Z^2 e Z^3 são respectivamente fixados às posições 4 e 6 ou às posições 6 e 4 no anel benzeno.

4. Herbicida, caracterizado pelo fato de que compreende o composto de piridazinona como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 3 como um ingrediente ativo.

5. Método de controle de erva daninha, caracterizado pelo fato de que compreende aplicar uma quantidade eficaz do composto de piridazinona como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 3 a ervas daninhas ou solo onde as ervas daninhas são desenvolvidas.

6. Uso do composto de piridazinona como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 3, caracterizado pelo fato de que é para controle de erva daninha.

7. Composto, caracterizado pelo fato de que é representado pela fórmula (VI):



(VI)

15 em que

R^9 representa um grupo C_{1-6} alquila;

R^1 representa um grupo C_{1-6} alquila;

R^2 representa um grupo C_{1-6} alquila;

Z^1 representa um grupo C_{1-6} alquila;

20 Z^2 representa um grupo C_{3-8} cicloalquila, um grupo C_{2-6} alquinila, um grupo C_{1-6} alquiloxi, um grupo C_{1-6} haloalquila, um grupo C_{1-6} haloalquiloxi, um átomo de halogênio, um grupo C_{6-10} arila, ou um grupo ciano, e

Z^3 representa um grupo C_{1-6} alquila,

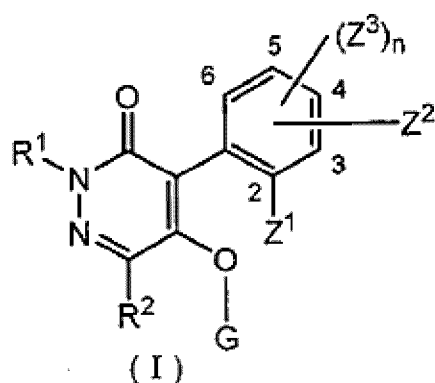
em que o grupo C_{6-10} arila representado por Z^2 pode ser substitu-

ído com pelo menos um grupo selecionado a partir do grupo consistindo em um átomo de halogênio e um grupo C₁₋₆ alquila; e
n representa 1.

RESUMO

Patente de Invenção para "COMPOSTO DE PIRIDAZINONA, HERBICIDA CONTENDO O MESMO, MÉTODO DE CONTROLE DE ERVA DANINHA, USO DO REFERIDO COMPOSTO, E SEU COMPOSTO INTERMEDIÁRIO".

5 A presente invenção refere-se a um composto representado pela fórmula (I):



em que R^1 é um grupo C_{1-6} alquila ou um grupo $(C_{1-6}$ alquiloxi) alquil C_{1-6} alquila; R^2 é um átomo de hidrogênio ou um grupo C_{1-6} alquila; G é um átomo de hidrogênio, etc; Z^1 é um grupo C_{1-6} alquila ou um grupo C_{1-6} alquiloxi; Z^2 é um grupo C_{3-8} cicloalquila, etc, Z^3 é um grupo C_{1-6} alquila, etc, n é 0, 1, 2 ou 3, que tem um excelente efeito de controle de erva daninha.