

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

(21) **PI0711546-6 A2**



(22) Data de Depósito: 11/04/2007
(43) Data da Publicação: 08/11/2011
(RPI 2131)

(51) *Int.Cl.:*
C07D 401/04
C07D 401/14
C07D 405/14
C07D 409/14
A01N 43/707

(54) **Título:** COMPOSTOS, USO DE COMPOSTOS, AGENTE PARA PROTEÇÃO DE COLHEITA, SEMENTE, E, PROCESSO PARA COMBATER FUNGOS FITOPATOGÊNICOS

(30) **Prioridade Unionista:** 12/04/2006 EP 06007743.5

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

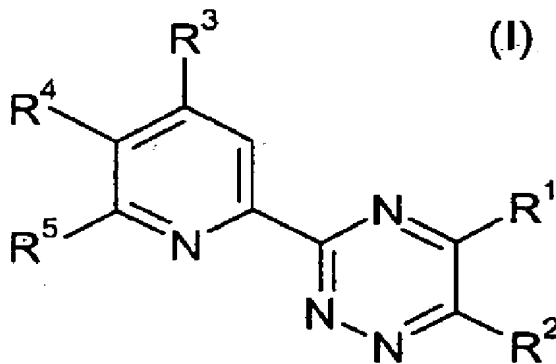
(72) **Inventor(es):** Bernd Müller, Jan Klaas Lohmann, Jens Renner, Jochen Dietz, Sarah Ulmschneider, Thomas Grote, Wassilios Grammenos

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

(86) **Pedido Internacional:** PCT EP2007053515 de 11/04/2007

(87) **Publicação Internacional:** WO 2007/116078de 18/10/2007

(57) **Resumo:** COMPOSTOS, USO DE COMPOSTOS, AGENTE PARA PROTEÇÃO DE COLHEITA, SEMENTE, E, PROCESSO PARA COMBATER FUNGOS FITOPATOGÊNICOS. A invenção refere-se a 3-(piridin-2-il)-[1,2,4]-triazinas de fórmula (I) e seu uso no controle de fungos parasíticos e a herbicidas que contém ditos compostos como um seu ingrediente eficaz. Na fórmula (I), R¹ e R² representam independentemente OH, halogênio, NO₂, NH₂, C₁-C₈ alquila, C₁-C₈ alcóxi, C₁-C₈ halogenalquila, C₁-C₈ halogenalcóxi, C₁-C₈ alquilamino ou di(C₁-C₈ alquil)amino ou sua forma, junto com os átomos a que eles são ligados, um carbociclo ou heterociclo de cinco, seis ou sete membros saturado, que, além dos membros do anel de carbono, tem um ou dois heteroátomos selecionados de oxigênio ou enxofre como os membros do anel, o carbociclo e o heterociclo sendo não substituídos ou tendo 1, 2, 3 ou 4 grupos C₁-C₄ alquila como substituintes; R³ representa hidrogênio, C₁-C₄ alquila, C₁-C₄ alcóxi, C₁-C₄ halogenalquila, C₁-C₄ halogenalcóxi, C₃-C₆ cicloalquila, C₃-C₆ cicloalquilmetila ou halogênio; R⁴ representa hidrogênio, C₁-C₄ alquila, C₁-C₄ alcóxi, C₁-C₄ halogenalquila, C₁-C₄ halogenalcóxi ou halogênio; R⁵ representa C₁-C₈ alquila, C₁-C₈ halogenalquila, C₁-C₈ alcóxi, C₁-C₈ halogenalcóxi, C₃-C₈ cicloalquila, C₃-C₈ cicloalquilóxi, heteroarila, fenila, fenóxi, benzila, benzilóxi de cinco ou seis membros, heteroarilmetila de cinco ou seis membros ou heteroarilóxi de cinco ou seis membros, ditos grupos sendo não substituídos ou tendo 1, 2, 3, 4 ou 5 grupos R^a.



“COMPOSTOS, USO DE COMPOSTOS, AGENTE PARA PROTEÇÃO DE COLHEITA, SEMENTE, E, PROCESSO PARA COMBATER FUNGOS FITOPATOGÊNICOS”

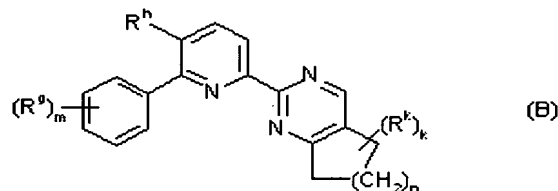
A presente invenção refere-se a 3-(piridin-2-il)-[1,2,4]-triazinas e seu uso para controlar fungos nocivos e também a composições de proteção de colheitas compreendendo tais compostos como componente ativo.

EP-A 234 104 descreve 2-(piridin-2-il)pirimidinas que têm um grupo alquila na posição 6 do radical piridina e que podem ter um anel fundido saturado de 5 ou 6 membros na posição-3,4 do anel pirimidina. Os compostos são adequados para controlar fungos fitopatogênicos (fungos nocivos).

2-(Piridin-2-il)pirimidinas tendo ação fungicida, que contém um anel fenila opcionalmente substituído na posição-4 do anel pirimidina, são conhecidos pela US 4.873.248.

EP-A 259 139 descreve 2-(piridin-2-il)pirimidinas, que têm um grupo fenila opcionalmente substituído na posição-6 do radical piridina e que podem ter um anel fundido saturado de 5 ou 6 membros na posição-3,4 do anel pirimidina. Os compostos são igualmente adequados para controlar fungos fitopatogênicos (fungos nocivos).

O WO 2006/010570 descreve compostos 2-(6-fenilpiridin-2-il)pirimidina fungicidamente ativos de fórmula B abaixo:



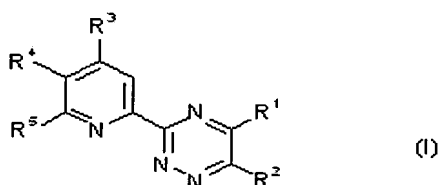
em que: k é 0, 1, 2 ou 3, m é 0, 1, 2, 3, 4 ou 5 e n é 1, 2, 3, 4 ou 5, os substituintes R^g são entre outros halogênio, OH, CN, NO₂, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₂-C₄-alquenila, C₂-C₄-alquinila, C₃-C₈-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, amino, fenóxi, etc.,

R^h é C_1 - C_4 -haloalquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -haloalcóxi, hidroxila, halogênio, CN ou NO_2 e R^k é C_1 - C_4 -alquila.

Com respeito a sua atividade fungicida, algumas das 2-(piridin-2-il)pirimidinas conhecidas da arte anterior são insatisfatórias ou têm propriedades indesejadas, tais como baixa compatibilidade com plantas de colheita.

Portanto, é um objetivo da presente invenção fornecer novos compostos tendo melhorada atividade fungicida e/ou melhor compatibilidade com plantas de colheita.

Surpreendentemente, este objetivo é alcançado por compostos de 3-(piridin-2-il)-[1,2,4]-triazina de fórmula geral I



em que:

R^1 , R^2 independentemente entre si são OH, halogênio, NO_2 , NH_2 , C_1 - C_8 -alquila, C_1 - C_8 -alcóxi, C_1 - C_8 -haloalquila, C_1 - C_8 -haloalcóxi, C_1 - C_8 -alquilamino ou di(C_1 - C_8 -alquil)amino,

ou juntos com os átomos de carbono a que são ligados podem formar um carbociclo ou heterociclo saturado de 5, 6 ou 7 membros que, além dos membros do anel de carbono, tem um ou dois heteroátomos selecionados do grupo consistindo de oxigênio e enxofre como membros do anel, em que o carbociclo e o heterociclo são não substituídos ou têm 1, 2, 3 ou 4 grupos C_1 - C_4 -alquila como substituintes;

R^3 é hidrogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -haloalquila, C_1 - C_4 -haloalcóxi, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_3 - C_6 -cicloalquilmetila, ou halogênio;

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

R^5 é C_1 - C_8 -alquila, C_1 - C_8 -haloalquila, C_1 - C_8 -alcóxi, C_1 - C_8 -haloalcóxi, C_3 - C_8 -cicloalquila, C_3 - C_8 -cicloalquilóxi, heteroarila de 5 ou 6 membros, fenila, fenóxi, benzila, benzilóxi de 5 ou 6 membros, heteroarilmetila de 5 ou 6 membros ou heteroarilóxi de 5 ou 6 membros, em que os radicais cíclicos mencionados acima são não substituídos ou podem ter 1, 2, 3, 4 ou 5 radicais R^a , em que

R^a é selecionado do grupo consistindo de OH, SH, halogênio, NO_2 , NH_2 , CN, COOH, C_1 - C_8 -alquila, C_1 - C_8 -alcóxi, C_1 - C_8 -haloalquila, C_1 - C_8 -haloalcóxi, C_1 - C_8 -alquilamino, di(C_1 - C_8 -alquila)amino, C_1 - C_8 -alquiltio, C_1 - C_8 -haloalquiltio, C_1 - C_8 -alquilasulfinila, C_1 - C_8 -haloalquilsulfinila, C_1 - C_8 -alquilsulfonila, C_1 - C_8 -haloalquilsulfonila, C_3 - C_8 -cicloalquila, fenila, fenóxi e radicais de fórmula $C(=Z)R^{aa}$ em que Z é O, S, N(C_1 - C_8 -alquila), N(C_1 - C_8 -alcóxi), N(C_3 - C_8 -alquenilóxi) ou N(C_3 - C_8 -alquinilóxi) e R^{aa} é hidrogênio, C_1 - C_8 -alquila, C_1 - C_8 -alcóxi, NH_2 , C_1 - C_8 -alquilamino ou di(C_1 - C_8 -alquil)amino, ou dois radicais R^a ligados aos átomos de carbono adjacentes juntos com os átomos de carbono a que são ligados podem também formar um carbociclo saturado de 5, 6 ou 7 membros ou um heterociclo de 5, 6 ou 7 membros que, além dos membros do anel de carbono, tem um ou dois heteroátomos selecionados do grupo consistindo de oxigênio e enxofre como membros do anel, em que o carbociclo e o heterociclo são não substituídos ou têm 1, 2, 3 ou 4 grupos C_1 - C_4 -alquila como substituintes;

e os sais agriculturalmente úteis dos compostos de fórmula I.

Portanto, a presente invenção fornece as 3-(piridin-2-il)triazinas de fórmula geral I e seus sais agriculturalmente aceitáveis.

A presente invenção provê ainda o uso das 3-(piridin-2-il)triazinas de fórmula geral I e seus sais agriculturalmente aceitáveis para controlar fungos fitopatogênicos (= fungos nocivos), e também um método para controlar fungos fitopatogênicos em que os fungos ou os materiais, plantas, o solo ou semente a serem protegidos contra ataque fúngico são/é

tratados com uma quantidade eficaz de um composto de fórmula geral I e/ou com um sal agriculturalmente aceitáveis de I.

A presente invenção além disso provê uma composição para controlar fungos nocivos e compreendendo pelo menos um composto de 3-(piridin-2-il)triazina de fórmula geral I e/ou um seu sal agriculturalmente aceitável e pm um veículo líquido ou sólido.

Dependendo do padrão de substituição, os compostos de fórmula I e seus tautômeros podem ter um ou mais centros de quiralidade, em cujo caso eles estão presentes como enantiômeros puros ou diastereômeros puros ou como misturas de enantiômeros ou diastereômeros. A invenção fornece tanto os enantiômeros ou diastereômeros puros e suas misturas.

Sais agriculturalmente úteis abrangem especialmente os sais daqueles cátions ou dos sais de adição de ácido daqueles ácidos cujos cátions e ânions, respectivamente, não têm efeito adverso sobre a ação fungicida dos compostos I. Cátions adequados são, assim, em particular, os íons dos metais alcalinos, preferivelmente sódio e potássio, dos metais alcalino terrosos, preferivelmente cálcio, magnésio e bário dos metais de transição, preferivelmente manganês, cobre, zinco e ferro e também do íon amônio que, se desejado, pode conter um a quatro substituintes C_1-C_4 alquila e/ou um substituinte fenila ou benzila, preferivelmente diisopropilamônio, tetrametilamônio, tetrabutylamônio, trimetilbenzilamônio, além disso íons fosfônio, íons sulfônio, preferivelmente tri(C_1-C_4 -alquil)sulfônio e íons sulfoxônio, preferivelmente tri(C_1-C_4 -alquil)sulfoxônio.

Ânions de sais de adição de ácido úteis são principalmente cloreto, brometo, fluoreto, sulfato de hidrogênio, sulfato, fosfato de diidrogênio, fosfato de diidrogênio, fosfato de hidrogênio, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorossilicato, hexafluorofosfato, benzoato e os ânions de ácidos C_1-C_4 -alcanóicos, preferivelmente formiato, acetato, propionato e butirato. Eles podem ser formados reagindo-se I com um ácido

do correspondente ânion, preferivelmente de ácido clorídrico, ácido bromídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico ou ácido nítrico.

Nas definições das variáveis dadas nas fórmulas acima, termos coletivos são usados que são geralmente representativos dos substituintes em questão. A expressão C_n-C_m indica o número de átomos de carbono possíveis em cada caso no substituinte ou componente substituinte em questão:

halogênio: flúor, cloro, bromo e iodo;

alquila e também todos componentes alquila de alcóxi, alcoxialquila, alquilcarbonila, alcoxycarbonila, alquiltio, alquilsulfonila, alquilsulfonila, alquilamino, dialquilamino, alquilaminocarbonila, dialquilaminocarbonila: radicais hidrocarboneto saturados, de cadeia reta ou ramificada, tendo 1 a 8 (C_1-C_8 -alquila), freqüentemente 1 a 6 (C_1-C_6 -alquila) e in particular 1 a 4 átomos de carbono (C_1-C_4 -alquila), tais como metila, etila, propila, 1-metiletila, butila, 1-metilpropila, 2-metilpropila, 1,1-dimetiletila, pentila, 1-metilbutila, 2-metilbutila, 3-metilbutila, 2,2-dimetilpropila, 1-etilpropila, hexila, 1,1-dimetilpropila, 1,2-dimetilpropila, 1-metilpentila, 2-metilpentila, 3-metilpentila, 4-metilpentila, 1,1-dimetilbutila, 1,2-dimetilbutila, 1,3-dimetilbutila, 2,2-dimetilbutila, 2,3-dimetilbutila, 3,3-dimetilbutila, 1-etilbutila, 2-etilbutila, 1,1,2-trimetilpropila, 1,2,2-trimetilpropila, 1-etil-1-metilpropila e 1-etil-2-metilpropila, heptila, 1-metilhexila, octila, 1-metilheptila e 2-etilexila;

haloalquila e também todos componentes haloalquila de haloalcóxi e haloalquiltio: grupos alquila de cadeia reta ou ramificada, tendo 1 a 8 e em particular 1 a 4 átomos de carbono (como mencionado acima), em que parte ou todos os átomos de hidrogênio destes grupos podem ser substituídos por átomos de halogênio como mencionado acima, em particular flúor ou cloro: em particular C_1-C_2 -haloalquila tais como clorometila, bromometila, diclorometila, triclorometila, fluorometila, difluorometila, trifluorometila, clorofluorometila, diclorofluorometila, clorodifluorometila, 1-

cloroetila, 1-bromoetila, 1-fluoroetila, 2-fluoroetila, 2,2-difluoroetila, 2,2,2-trifluoroetila, 2-cloro-2-fluoroetila, 2-cloro-2,2-difluoroetila, 2,2-dicloro-2-fluoroetila, 2,2,2-tricloroetila, pentafluoroetila e 1,1,1-trifluoroprop-2-ila;

alquenila: radicais hidrocarboneto monoinsaturados, de cadeia
 5 reta ou ramificada, tendo 2 a 8 ou 3 a 8 átomos de carbono e uma dupla ligação em qualquer posição, por exemplo etenila, 1-propenila, 2-propenila, 1-metilenila, 1-butenila, 2-butenila, 3-butenila, 1-metil-1-propenila, 2-metil-1-propenila, 1-metil-2-propenila, 2-metil-2-propenila

alquinila: grupos hidrocarboneto de cadeia reta ou ramificada,
 10 tendo 2 a 8 ou 3 a 8 átomos de carbono e uma tripla ligação em qualquer posição, por exemplo etinila, 1-propinila, 2-propinila, 1-butinila, 2-butinila, 3-butinila, 1-metil-2-propinila;

cicloalquila: grupos hidrocarboneto saturados monocíclicos,
 tendo 3 a 8, preferivelmente a 6, membros no anel de carbono, tais como
 15 ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila e cicloexila;

cicloalquilmetila: um radical cicloalquila como mencionado
 acima que é ligado via um grupo metileno (CH_2);

alquilamino e também os componentes alquilamino de
 alquilaminocarbonila: um grupo alquila que é ligado via um grupo NH, em
 20 que alquila é um dos radicais alquila mencionados acima tendo 1 a 8 átomos de carbono, tais como metilamino, etilamino, n-propilamino, isopropilamino, n-butilamino e similares;

dialquilamino e também os componentes dialquilamino de
 dialquilaminocarbonila: um radical de fórmula $\text{N}(\text{alquila})_2$, em que alquila é
 25 um dos radicais alquila mencionados acima tendo 1 a 8 átomos de carbono, por exemplo dimetilamino, dietilamino, metiletilamino, N-metil-N-propilamino e similares;

alcóxi e também os componentes alcóxi de alcóxicarbonila:
 um grupo alquila, ligado via um oxigênio, tendo 1 a 8, em particular 1 a 6 e

especialmente 1 a 4 átomos de carbono, por exemplo metóxi, etóxi, n-propóxi, 1-metiletóxi, butóxi, 1-metilpropóxi, 2-metilpropóxi ou 1,1-dimetiletóxi;

5 alcoxicarbonila: um radical alcóxi como mencionado acima, ligado via um grupo carbonila;

 alquiltio: um grupo alquila como mencionado acima, ligado via um átomo de enxofre;

 alquilsulfinila: um grupo alquila como mencionado acima, ligado via um grupo S(=O);

10 alquilsulfonila: um grupo alquila como mencionado acima, ligado via um grupo S(=O)₂;

 haloalcóxi: um radical alcóxi tendo 1 a 8, em particular 1 a 6 e especialmente 1 a 4 átomos de carbono como mencionado acima, que é parcial ou totalmente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, preferivelmente substituído por flúor, i.e., por exemplo, OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCCl₃, clorofluorometóxi, diclorofluorometóxi, clorodifluorometóxi, 2-fluoroetóxi, 2-cloroetóxi, 2-bromoetóxi, 2-iodoetóxi, 2,2-difluoroetóxi, 2,2,2-trifluoroetóxi, 2-cloro-2-fluoroetóxi, 2-cloro-2,2-difluoroetóxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetóxi, 2,2,2-tricloroetóxi, OC₂F₅, 2-fluoropropóxi, 3-fluoropropóxi, 2,2-difluoropropóxi, 2,3-difluoropropóxi, 2-cloropropóxi, 3-cloropropóxi, 2,3-dicloropropóxi, 2-bromopropóxi, 3-bromopropóxi, 3,3,3-trifluoropropóxi, 3,3,3-tricloropropóxi, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetóxi, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetóxi, 1-(CH₂Br)-2-bromoetóxi, 4-fluorobutóxi, 4-clorobutóxi, 4-bromobutóxi ou
25 nonafluorobutóxi;

 alquilenos: uma cadeia de hidrocarboneto de cadeia reta, saturada tendo 2 a 6 e em particular 2 a 4 átomos de carbono, tais como etano-1,2-diila, propano-1,3-diila, butano-1,4-diila, pentano-1,5-diila ou hexano-1,6-diila.

Heterociclo saturado de 5, 6 ou 7 membros que tem um ou dois heteroátomos selecionados do grupo consistindo de oxigênio e enxofre como membros do anel: um anel construído de átomos de carbono e 1 ou 2 heteroátomos selecionados do grupo consistindo de oxigênio e enxofre, o número total de átomos do anel (membros do anel) sendo 5, 6 ou 7, por exemplo: oxolano, oxepano, oxano (tetraidropirano), 1,3-dioxolano, 1,3-dioxano, 1,4-dioxano, tiolano, tiano, tiepano, 1,3-ditiolano, 1,3-ditiano e 1,4-ditiano;

heteroarila de 5 ou 6 membros: um anel aromático de 5 ou 6 membros que, além do carbono, tem 1, 2, 3 ou 4 heteroátomos como membros do anel, os heteroátomos tipicamente sendo selecionados do grupo consistindo de oxigênio, nitrogênio e enxofre, em particular:

- heteroarila de 5 membros que tem 1, 2, 3 ou 4 átomos de nitrogênio como membros do anel, tais como 1-, 2- ou 3-pirrolila, 1-, 3- ou 4-pirazolila, 1-, 2- ou 4-imidazolila, 1,2,3-[1H]-triazol-1-ila, 1,2,3-[2H]-triazol-2-ila, 1,2,3-[1H]-triazol-4-ila, 1,2,3-[1H]-triazol-5-ila, 1,2,3-[2H]-triazol-4-ila, 1,2,4-[1H]-triazol-1-ila, 1,2,4-[1H]-triazol-3-ila, 1,2,4-[1H]-triazol-5-ila, 1,2,4-[4H]-triazol-4-ila, 1,2,4-[4H]-triazol-3-ila, [1H]-tetrazol-1-ila, [1H]-tetrazol-5-ila, [2H]-tetrazol-2-ila e [2H]-tetrazol-5-ila;

- heteroarila de 5 membros que tem 1 heteroátomo selecionado do grupo consistindo de oxigênio e enxofre e opcionalmente 1, 2 ou 3 átomos de nitrogênio como membros do anel, por exemplo 2-furila, 3-furila, 2-tienila, 3-tienila, 3- ou 4-isoxazolila, 3- ou 4- isotiazolila, 2-, 4- ou 5-oxazolila, 2-, 4 ou 5-tiazolila, 1,2,4-tiadiazol-3-ila, 1,2,4-tiadiazol-5-ila, 1,3,4-tiadiazol-2-ila, 1,2,4-oxadiazol-3-ila, 1,2,4-oxadiazol-5-ila e 1,3,4-oxadiazol-2-ila;

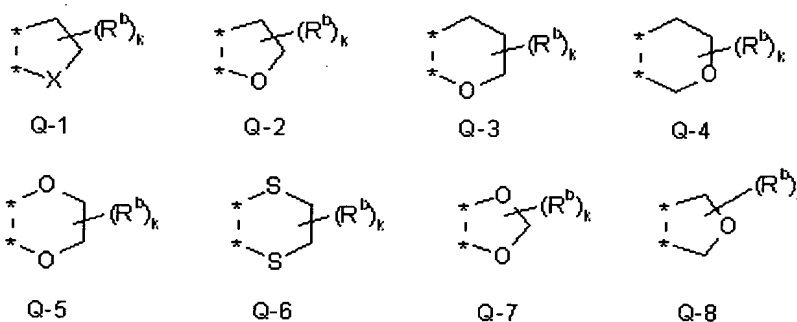
- heteroarila de 6 membros que tem 1, 2, 3 ou 4 átomos de nitrogênio como membros do anel, tais como 2-piridinila, 3-piridinila, 4-piridinila, 2-pirimidinila, 4-pirimidinila, 5-pirimidinila, 2-pirazinila, 3-piridazinila, 4-piridazinila, 1,2,4-triazin-3-ila, 1,2,4-triazin-5-ila, 1,2,4-triazin-

6-ila e 1,3,5-triazinila.

Com vistas ao uso como fungicidas, preferência é dada àqueles compostos de fórmula I em que as variáveis R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 independentemente entre si e em particular em combinação têm os seguintes significados:

De acordo com uma primeira forma de realização da presente invenção, R^1 e R^2 independentemente entre si são radicais monovalentes. Aqui, R^1 e R^2 podem ser idênticos ou diferentes. Neste caso, eles são preferivelmente selecionados do grupo consistindo de flúor, cloro, C_1 - C_4 -alquila, especialmente metila, etila ou n-propila, além disso metóxi, etóxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 e $OCHF_2$.

De acordo com uma segunda forma de realização da presente invenção, R^1 e R^2 juntos com os átomos de carbono a que são ligados formam um carbociclo ou heterociclo saturado de 5, 6 ou 7 membros que é definido acima e que pode conter um ou mais grupos C_1 - C_4 -alquila como substituintes. Nesta forma de realização, R^1 e R^2 juntos com os átomos de carbono do anel triazina a que são ligados são preferivelmente um dos seguintes anéis:



em que

*são os átomos do anel triazina;

k é 0, 1, 2, 3 ou 4;

R^b é C_1 - C_4 -alquila, em particular metila; e

X é $(CH_2)_n$ em que $n = 1, 2$ ou 3 .

Os radicais R^b podem ser localizados em quaisquer átomos de

carbono destes anéis e, se $k \neq 0$, por exemplo, 1, 2, 3 ou 4 dos átomos de hidrogênio de $(\text{CH}_2)_n$ podem ser substituídos por R^b . Os radicais Q-2, Q-3 e Q-4 podem assumir qualquer orientação com respeito ao anel triazina. Dentre os radicais Q-1 a Q-8, particular preferência é dada ao radical Q-1 e especialmente a radicais Q-1 em que $n = 2$ ou 3. A variável k é em particular 0, 1 ou 2.

R^3 é preferivelmente hidrogênio, flúor, cloro, C_1 - C_4 -alquila, especialmente metila, etila, isopropila ou terc-butila, metóxi, etóxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 ou OCHF_2 , em particular hidrogênio ou metila. Particular preferência é além disso dada a compostos de fórmula I em que R^3 é cloro. Particular preferência é além disso dada a compostos de fórmula I em que R^3 é CF_3 . Particular preferência é além disso dada a compostos de fórmula I em que R^3 é metóxi ou etóxi.

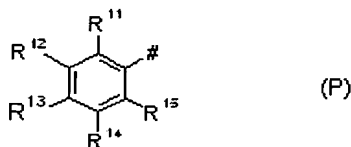
R^4 é preferivelmente hidrogênio, flúor, cloro, C_1 - C_4 -alquila, especialmente metila ou etila, metóxi, etóxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 ou OCHF_2 . R^4 é em particular hidrogênio, flúor, cloro ou metila.

Nos compostos preferidos de fórmula I, R^5 é fenila, fenóxi ou benzila, em que o anel fenila dos três radicais mencionados acima é não substituído ou tem 1, 2, 3, 4 ou 5 radicais R^a , em particular 1, 2 ou 3 radicais R^a .

Radicais preferidos R^a são selecionados do grupo consistindo de halogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_2 -haloalquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_2 -haloalcóxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -alquilcarbonila, C_1 - C_4 -alcoxicarbonila, e radicais de fórmula $\text{C}(=\text{N}-\text{O}-\text{C}_1-\text{C}_8\text{-alquila})\text{R}^{aa}$ em que R^{aa} é hidrogênio ou C_1 - C_4 -alquila. Especialmente preferível, os radicais R^a são selecionados do grupo consistindo de halogênio, especialmente cloro ou flúor, metila, metóxi, trifluorometila, difluorometila, trifluorometóxi, difluorometóxi e metiltio.

De acordo com uma forma de realização preferida da invenção, R^5 na fórmula I é fenila, fenóxi ou benzila, em que o anel fenila tem

1, 2, 3, 4 ou 5 e em particular 1, 2 ou 3 radicais R^a , em que os radicais R^a are preferivelmente selecionados dos radicais R^a mencionados como sendo preferidos e em particular dos radicais R^a mencionados como sendo particularmente preferidos. Nesta forma de realização, o radical fenila de fenila, fenóxi ou benzila é um radical de fórmula P:



em que # é o ponto de ligação do anel piridina e R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} e R^{15} são hidrogênio ou pelo menos um destes radicais, por exemplo 1, 2, 3, 4 ou 5 destes radicais, tem/têm um dos significados dados para R^a , em particular um dos significados dados como sendo preferidos ou particularmente preferidos. Em uma forma de realização preferida, pelo menos um e especialmente 1, 2 ou 3 dos radicais R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} ou R^{15} é/são diferente(s) de hidrogênio. Em particular:

R^{11} é hidrogênio, flúor, cloro, CH_3 , OCH_3 , OCHF_2 , OCF_3 ou CF_3 ;

R^{12} , R^{14} independentemente entre si são hidrogênio, cloro, flúor, CH_3 , OCH_3 , OCHF_2 , OCF_3 ou CF_3 , em que um dos radicais R^{12} e R^{14} pode também ser NO_2 , $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ ou COOCH_3 ; em particular, R^{12} e R^{14} são hidrogênio, flúor, metila ou trifluorometila;

R^{13} é hidrogênio, flúor, cloro, ciano, OH, CHO, NO_2 , NH_2 , metilamino, dimetilamino, dietilamino, C_1 - C_4 -alquila, especialmente CH_3 , C_2H_5 , $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, C_3 - C_8 -cicloalquila, especialmente ciclopropila, ciclopentila ou cicloexila, C_1 - C_4 -alcóxi, especialmente OCH_3 , C_1 - C_4 -alquiltio, especialmente metiltio ou etiltio, C_1 - C_4 -haloalquila, especialmente CF_3 , C_1 - C_4 -haloalcóxi, especialmente OCHF_2 ou OCF_3 , ou $\text{CO}(\text{A}^2)$ em que A^2 é C_1 - C_4 -alquila, especialmente metila, ou C_1 - C_4 -alcóxi, especialmente OCH_3 , ou um grupo $\text{C}(\text{R}^{13a})=\text{NOR}^{13b}$ em que R^{13a} é hidrogênio ou metila e R^{13b} é C_1 - C_4 -

alquila, propargila ou alila ou R^{12} e R^{13} juntos formam um grupo $O-CH_2-O$; e R^{15} é hidrogênio, flúor, cloro, ou C_1-C_4 -alquila, especialmente CH_3 , em particular hidrogênio ou flúor.

5 Vantajosamente, se mais do que um dos radicais R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} ou R^{15} forem diferentes de hidrogênio, então somente um dos radicais diferentes de hidrogênio é diferentes de halogênio ou metila. Especialmente se um dos radicais R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} ou R^{15} for diferente de hidrogênio, halogênio ou metila, os radicais restantes R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} são selecionados do grupo consistindo de halogênio e hidrogênio.

10 Exemplos de radicais P são os radicais mencionados abaixo:
 fenila, 2-fluorofenila, 3-fluorofenila, 4-fluorofenila, 2-clorofenila, 3-clorofenila, 4-clorofenila, 3-bromofenila, 4-bromofenila, 2-trifluorometilfenila, 3-trifluorometilfenila, 4-trifluorometilfenila, 2-(metiltio)fenila, 3-(metiltio)fenila, 4-(metiltio)fenila, 2-metoxifenila, 3-metoxifenila, 4-metoxifenila, 4-nitrofenila, 4-cianofenila, 4-terc-butilfenila, 4-isopropilfenila, 3-etoxifenila, 4-etoxifenila, 4-n-propoxifenila, 4-isopropoxifenila, 3-isopropoxifenila, 4-n-butoxifenila, 4-terc-butoxifenila, 4-acetilfenila, 4-metoxicarbonilfenila, 4-etoxicarbonilfenila, 4-terc-butoxicarbonilfenila, 4-(metoxiiminometil)fenila, 4-(1-(metoxiimino)etil)fenila, 2,3-
 20 difluorofenila, 2,4-difluorofenila, 2,5-difluorofenila, 3,4-difluorofenila, 3,5-difluorofenila, 2,6-difluorofenila, 2,4,6-trifluorofenila, 2,4,5-trifluorofenila, 2,3,4-trifluorofenila, 2,3,5-trifluorofenila, 3,4,5-trifluorofenila, 2,3-diclorofenila, 2,5-diclorofenila, 3,5-diclorofenila, 2,6-diclorofenila, 2,3-dimetilfenila, 2,4-dimetilfenila, 2,5-dimetilfenila, 2,4,5-trimetilfenila, 2,3-
 25 dimetoxifenila, 2,4-dimetoxifenila, 3,4-dimetoxifenila, 2,4-bis(trifluorometil)fenila, 3,5-bis(trifluorometil) fenila, 2-metil-3-metoxifenila, 2-metil-4-metoxifenila, 2-metil-6-metoxifenila, 3-cloro-4-fluorofenila, 2-cloro-4-fluorofenila, 2-cloro-6-fluorofenila, 4-cloro-2-fluorofenila, 5-cloro-2-fluorofenila, 4-fluoro-3-metilfenila, 2-fluoro-4-metilfenila, 4-fluoro-2-

metilfenila, 2-fluoro-3-metoxifenila, 2-fluoro-4-metoxifenila, 2-fluoro-6-metoxifenila, 2-fluoro-4-trifluorometilfenila, 4-cloro-3-metilfenila, 2-cloro-4-metilfenila, 2-cloro-6-metilfenila, 3-cloro-2-metilfenila, 5-cloro-2-metilfenila, 2-cloro-4-metoxifenila, 2-cloro-6-metoxifenila, 2-cloro-4-trifluorometilfenila, 3-fluoro-4-metilfenila, 4-fluoro-3-metilfenila, 3-fluoro-4-metoxifenila, 3-fluoro-4-etoxifenila, 3-fluoro-4-trifluorometilfenila, 3-cloro-4-metilfenila, 3-cloro-4-metoxifenila, 3-cloro-4-etoxifenila, 3-cloro-4-trifluorometilfenila, 3-metil-4-metoxifenila, 4-cloro-2,5-difluorofenila, 4-terc-butil-2-fluorofenila, 2-fluoro-4-isopropilfenila, 4-etoxi-2-fluorofenila, 4-acetil-2-fluorofenila, 2-metilfenila, 3-metilfenila, 4-metilfenila, 2-etilfenila, 3-etilfenila, 4-etilfenila.

Particularmente preferível, R^5 na fórmula I é fenila e especialmente um radical P e em particular um dos radicais P mostrados aqui como um exemplo.

De acordo com mais uma forma de realização preferida, R^5 é C_1 - C_6 -alquila ou C_1 - C_6 -haloalquila, em particular C_3 - C_6 -alquila, especialmente n-propila, isopropila, terc-butila, 1,2-dimetilpropila ou 1,2,2-trimetilpropila, ou trifluorometila.

De acordo com mais uma forma de realização preferida, R^5 é heteroarila de 5 membros que, além do carbono, tem 1, 2, 3 ou 4 átomos de nitrogênio como átomos do anel; ou heteroarila de 5 membros que, além do carbono, tem 1 heteroátomo selecionado do grupo consistindo de oxigênio e enxofre e opcionalmente 1, 2 ou 3 átomos de nitrogênio como átomos do anel, ou é hetarila de 6 membros que tem 1, 2, 3 ou 4 átomos de nitrogênio como átomos do anel, em que a hetarila de 5 e 6 membros pode ser não substituída ou parte dos ou todos os átomos de hidrogênio da hetarila não substituída podem ser substituídos por substituintes R^a do tipo indicado acima, de modo que o número total de todos os substituintes R^a de hetarila é tipicamente 1, 2, 3 ou 4. Substituintes dos átomos de anel nitrogênio são em particular radicais R^a ligados via carbono e especialmente C_1 - C_4 -alquila.

Nesta forma de realização, R⁵ é preferivelmente opcionalmente substituída 2-furila, 3-furila, 2-tienila, 3-tienila, 2-piridila, 3-piridila, 4-piridila, 2-pirimidinila, 4-pirimidinila ou 5-pirimidinila, em que os em que os radicais heterocíclicos mencionados acima são preferivelmente não substituídos ou têm 1, 2 ou 3 substituintes R^a. Com respeito aos radicais preferidos e particularmente preferidos, aplica-se o que foi dito acima.

Exemplos de radicais heteroaromáticos preferidos R⁵ são

- opcionalmente substituída 2-tienila, tais como não substituída 2-tienila, 5-metiltiofen-2-ila, 4-metiltiofen-2-ila, 5-clorotiofen-2-ila, 3-cianotiofen-2-ila, 5-formiltiofen-2-ila, 5-acetiltiofen-2-ila, 5-(metoxiiminometil)tiofen-2-ila, 5-(1-(metoxiimino)etil)tiofen-2-ila, 4-bromotiofen-2-ila, 3,5-diclorotiofen-2-ila,

- opcionalmente substituída 3-tienila, tais como não substituída 3-tienila, 2-metiltiofen-3-ila, 2,5-diclorotiofen-3-ila, 2,4,5-triclorotiofen-3-ila,

- opcionalmente substituída 2-furila, tais como não substituída 2-furila, 5-metilfuran-2-ila, 5-clorofuran-2-ila, 4-metilfuran-2-ila, 3-cianofuran-2-ila, 5-acetilfuran-2-ila,

- opcionalmente substituída 3-furila, tais como não substituída 3-furila, 2-metilfuran-3-ila, 2,5-dimetilfuran-3-ila,

- opcionalmente substituída 2-piridila, tais como não substituída 2-piridila, 3-fluoropiridin-2-ila, 3-cloropiridin-2-ila, 3-bromopiridin-2-ila, 3-trifluorometil-piridin-2-ila, 3-metilpiridin-2-ila, 3-etilpiridin-2-ila, 3,5-difluoropiridin-2-ila, 3,5-dicloropiridin-2-ila, 3,5-dibromopiridin-2-ila, 3,5-dimetilpiridin-2-ila, 3-fluoro-5-trifluorometilpiridin-2-ila, 3-cloro-5-fluoropiridin-2-ila, 3-cloro-5-metilpiridin-2-ila, 3-fluoro-5-cloropiridin-2-ila, 3-fluoro-5-metilpiridin-2-ila, 3-metil-5-fluoropiridin-2-ila, 3-metil-5-cloropiridin-2-ila, 5-nitropiridin-2-ila, 5-cianopiridin-2-ila, 5-metoxicarbonilpiridin-2-ila, 5-trifluorometilpiridin-2-ila, 5-metilpiridin-2-ila, 4-metilpiridin-2-ila, 6-metilpiridin-2-ila,

- opcionalmente substituída 3-piridila, tais como não substituída 3-piridila, 2-cloropiridin-3-ila, 2-bromopiridin-3-ila, 2-metilpiridin-3-ila, 2,4-dicloropiridin-3-ila, 2,4-dibromopiridin-3-ila, 2,4-difluoropiridin-3-ila, 2-fluoro-4-cloropiridin-3-ila, 2-cloro-4-fluoropiridin-3-ila, 2-cloro-4-metilpiridin-3-ila, 2-metil-4-fluoropiridin-3-ila, 2-metil-4-cloropiridin-3-ila, 2,4-dimetilpiridin-3-ila, 2,4,6-tricloropiridin-3-ila, 2,4,6-tribromopiridin-3-ila, 2,4,6-trimetilpiridin-3-ila, 2,4-dicloro-6-metilpiridin-3-ila, 6-metoxipiridin-3-ila, 6-cloropiridin-3-ila,

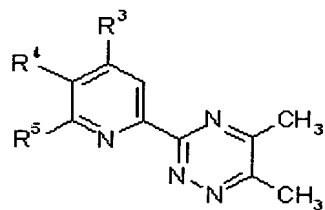
10 - opcionalmente substituída 4-piridila, tais como não substituída 4-piridila, 3-cloropiridin-4-ila, 3-bromopiridin-4-ila, 3-metilpiridin-4-ila, 3,5-dicloropiridin-4-ila, 3,5-dibromo-piridin-4-ila, 3,5-dimetilpiridin-4-ila,

15 - opcionalmente substituída 4-pirimidinila, tais como não substituída 4-pirimidinila, 5-cloropirimidin-4-ila, 5-fluoropirimidin-4-ila, 5-fluoro-6-cloropirimidin-4-ila, 2-metil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila, 2,5-dimetil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila, 5-metil-6-trifluorometil-pirimidin-4-ila, 6-trifluorometilpirimidin-4-ila, 2-metil-5-fluoropirimidin-4-ila, 2-metil-5-cloropirimidin-4-ila, 5-cloro-6-metilpirimidin-4-ila, 5-cloro-6-etilpirimidin-4-ila, 5-cloro-6-isopropilpirimidin-4-ila, 5-bromo-6-metilpirimidin-4-ila, 5-fluoro-6-metilpirimidin-4-ila, 5-fluoro-6-fluorometilpirimidin-4-ila, 2,6-dimetil-5-cloropirimidin-4-ila, 5,6-dimetil-pirimidin-4-ila, 2,5-dimetilpirimidin-4-ila, 2,5,6-trimetilpirimidin-4-ila, 5-metil-6-metoxipirimidin-4-ila,

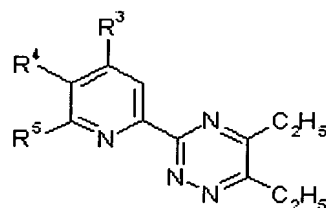
25 - opcionalmente substituída 5-pirimidinila, tais como não substituída 5-pirimidinila, 4-metilpirimidin-5-ila, 4,6-dimetilpirimidin-5-ila, 2,4,6-trimetilpirimidin-5-ila, 4-trifluorometil-6-metilpirimidin-5-ila,

- opcionalmente substituída 2-pirimidinila, tais como não substituída 2-pirimidinila, 4,6-dimetilpirimidin-2-ila, 4,5,6-trimetilpirimidin-2-ila, 4,6-ditri-fluorometilpirimidin-2-ila e 4,6-dimetil-5-cloropirimidin-2-ila.

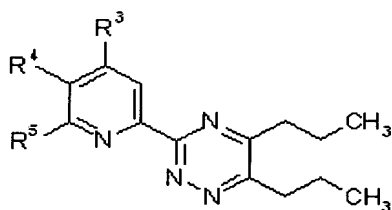
Especialmente preferidos são os seguintes grupos de compostos de fórmula I:



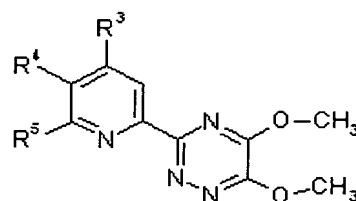
I.1



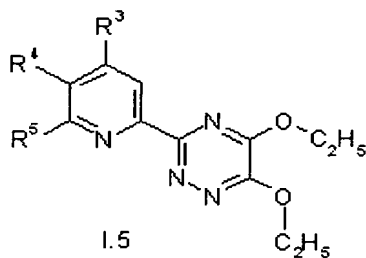
I.2



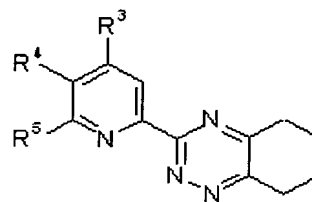
I.3



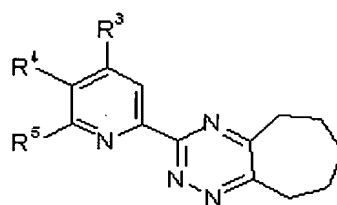
I.4



I.5



I.6



I.7

Em particular com vistas a seu uso, preferência é dada aos compostos de fórmulas gerais I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 e I.7 mencionados nas Tabelas 1 a 9.

Tabela 1

Compostos de fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 e I.7 em que R³ é hidrogênio e a combinação de R⁴ e R⁵ para um composto corresponde em cada caso a uma fileira da Tabela A.

Tabela 2

Compostos de fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 e I.7 em que R³ é metila e a combinação de R⁴ e R⁵ para um composto corresponde em cada caso a uma fileira da Tabela A.

5 Tabela 3

Compostos de fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 e I.7 em que R³ é etila e a combinação de R⁴ e R⁵ para um composto corresponde em cada caso a uma fileira da Tabela A.

Tabela 4

10 Compostos de fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 e I.7 em que R³ é metóxi e a combinação de R⁴ e R⁵ para um composto corresponde em cada caso a uma fileira da Tabela A.

Tabela 5

15 Compostos de fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 e I.7 em que R³ é etóxi e a combinação de R⁴ e R⁵ para um composto corresponde em cada caso a uma fileira da Tabela A.

Tabela 6

20 Compostos de fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 e I.7 em que R³ é isopropila e a combinação de R⁴ e R⁵ para um composto corresponde em cada caso a uma fileira da Tabela A.

Tabela 7

Compostos de fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 e I.7 em que R³ é terc-butila e a combinação de R⁴ e R⁵ para um composto corresponde em cada caso a uma fileira da Tabela A.

25 Tabela 8

Compostos de fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 e I.7 em que R³ é trifluorometila e a combinação de R⁴ e R⁵ para um composto corresponde em cada caso a uma fileira da Tabela A.

Tabela 9

Compostos de fórmulas I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, I.6 e I.7 em que R³ é difluorometóxi e a combinação de R⁴ e R⁵ para um composto corresponde em cada caso a uma fileira da Tabela A.

Tabela A

No.	R ⁴	R ⁵
A-1.	H	fenila
A-2.	H	2-fluorofenila
A-3.	H	3-fluorofenila
A-4.	H	4-fluorofenila
A-5.	H	2-clorofenila
A-6.	H	3-clorofenila
A-7.	H	4-clorofenila
A-8.	H	3-bromofenila
A-9.	H	4-bromofenila
A-10.	H	2-trifluorometilfenila
A-11.	H	3-trifluorometilfenila
A-12.	H	4-trifluorometilfenila
A-13.	H	2-(metiltio)fenila
A-14.	H	3-(metiltio)fenila
A-15.	H	4-(metiltio)fenila
A-16.	H	2-metoxifenila
A-17.	H	3-metoxifenila
A-18.	H	4-metoxifenila
A-19.	H	4-nitrofenila
A-20.	H	4-cianofenila
A-21.	H	4-terc-butilfenila
A-22.	H	4-isopropilfenila
A-23.	H	3-etoxifenila
A-24.	H	4-etoxifenila
A-25.	H	4-n-propoxifenila
A-26.	H	3-isopropoxifenila
A-27.	H	4-isopropoxifenila
A-28.	H	4-n-butoxifenila
A-29.	H	4-terc-butoxifenila
A-30.	H	4-(metoxiiminometil)fenila
A-31.	H	4-(1-(metoxiimino)etil)fenila
A-32.	H	2,3-difluorofenila
A-33.	H	2,4-difluorofenila
A-34.	H	2,5-difluorofenila
A-35.	H	3,4-difluorofenila
A-36.	H	3,5-difluorofenila
A-37.	H	2,6-difluorofenila
A-38.	H	2,4,6-trifluorofenila
A-39.	H	2,4,5-trifluorofenila
A-40.	H	2,3,4-trifluorofenila
A-41.	H	2,3,5-trifluorofenila
A-42.	H	3,4,5-trifluorofenila
A-43.	H	2,3-diclorofenila
A-44.	H	2,5-diclorofenila
A-45.	H	3,5-diclorofenila

No.	R ⁴	R ⁵
A-46.	H	2,6-diclorofenila
A-47.	H	2,3-dimetilfenila
A-48.	H	2,4-dimetilfenila
A-49.	H	2,5-dimetilfenila
A-50.	H	2,4,5-trimetilfenila
A-51.	H	2,3-dimetoxifenila
A-52.	H	2,4-dimetoxifenila
A-53.	H	3,4-dimetoxifenila
A-54.	H	2,4-bis(trifluorometil)fenila
A-55.	H	3,5-bis(trifluorometil)fenila
A-56.	H	2-metila-3-metoxifenila
A-57.	H	2-metila-4-metoxifenila
A-58.	H	2-metila-6-metoxifenila
A-59.	H	3-cloro-4-fluorofenila
A-60.	H	2-cloro-4-fluorofenila
A-61.	H	2-cloro-6-fluorofenila
A-62.	H	4-cloro-2-fluorofenila
A-63.	H	5-cloro-2-fluorofenila
A-64.	H	4-fluoro-3-metilfenila
A-65.	H	2-fluoro-4-metilfenila
A-66.	H	4-fluoro-2-metilfenila
A-67.	H	2-fluoro-3-metoxifenila
A-68.	H	2-fluoro-4-metoxifenila
A-69.	H	2-fluoro-6-metoxifenila
A-70.	H	2-fluoro-4-trifluorometilfenila
A-71.	H	4-cloro-3-metilfenila
A-72.	H	2-cloro-4-metilfenila
A-73.	H	2-cloro-6-metilfenila
A-74.	H	5-cloro-2-metilfenila
A-75.	H	3-cloro-2-metilfenila
A-76.	H	2-cloro-4-metoxifenila
A-77.	H	2-cloro-6-metoxifenila
A-78.	H	2-cloro-4-trifluorometilfenila
A-79.	H	3-fluoro-4-metilfenila
A-80.	H	3-fluoro-4-isopropilfenila
A-81.	H	4-fluoro-3-metilfenila
A-82.	H	3-fluoro-4-metoxifenila
A-83.	H	3-fluoro-4-etoxifenila
A-84.	H	3-fluoro-4-trifluorometilfenila
A-85.	H	3-cloro-4-metilfenila
A-86.	H	3-cloro-4-metoxifenila
A-87.	H	3-cloro-4-etoxifenila
A-88.	H	3-cloro-4-trifluorometilfenila
A-89.	H	3-metila-4-metoxifenila
A-90.	H	4-cloro-2,5-difluorofenila
A-91.	H	4-terc-butila-2-fluorofenila
A-92.	H	2-fluoro-4-isopropilfenila
A-93.	H	4-etoxi-2-fluorofenila
A-94.	H	4-acetila-2-fluorofenila
A-95.	H	2-tienila
A-96.	H	5-metiltiofen-2-ila
A-97.	H	4-metiltiofen-2-ila
A-98.	H	5-clorotiofen-2-ila

No.	R ⁴	R ⁵
A-99.	H	3-cianotiofen-2-ila
A-100.	H	5-formiltiofen-2-ila
A-101.	H	5-acetiltiofen-2-ila
A-102.	H	5-(metoksiiminometila)tiofen-2-ila
A-103.	H	5-(1-(metoksiimino)etila)tiofen-2-ila
A-104.	H	4-bromotiofen-2-ila
A-105.	H	3,5-diclorotiofen-2-ila
A-106.	H	3-tienila
A-107.	H	2-metiltiofen-3-ila
A-108.	H	2,5-diclorotiofen-3-ila
A-109.	H	2,4,5-tricloro-tiofen-3-ila
A-110.	H	2-furila
A-111.	H	5-metilfuran-2-ila
A-112.	H	5-clorofuran-2-ila
A-113.	H	4-metilfuran-2-ila
A-114.	H	3-cianofuran-2-ila
A-115.	H	5-acetilfuran-2-ila
A-116.	H	3-furila
A-117.	H	2-metilfuran-3-ila
A-118.	H	2,5-dimetilfuran-3-ila
A-119.	H	2-piridila
A-120.	H	3-fluoropiridin-2-ila
A-121.	H	3-cloropiridin-2-ila
A-122.	H	3-bromopiridin-2-ila
A-123.	H	3-trifluorometilpiridin-2-ila
A-124.	H	3-metilpiridin-2-ila
A-125.	H	3-etilpiridin-2-ila
A-126.	H	3,5-difluoropiridin-2-ila
A-127.	H	3,5-dicloropiridin-2-ila
A-128.	H	3,5-dibromopiridin-2-ila
A-129.	H	3,5-dimetilpiridin-2-ila
A-130.	H	3-fluoro-5-trifluorometilpiridin-2-ila
A-131.	H	3-cloro-5-fluoropiridin-2-ila
A-132.	H	3-cloro-5-metilpiridin-2-ila
A-133.	H	3-fluoro-5-cloropiridin-2-ila
A-134.	H	3-fluoro-5-metilpiridin-2-ila
A-135.	H	3-metil-5-fluoropiridin-2-ila
A-136.	H	3-metil-5-cloropiridin-2-ila
A-137.	H	5-nitropiridin-2-ila
A-138.	H	5-cianopiridin-2-ila
A-139.	H	5-metoxycarbonilpiridin-2-ila
A-140.	H	5-trifluorometilpiridin-2-ila
A-141.	H	5-metilpiridin-2-ila
A-142.	H	4-metilpiridin-2-ila
A-143.	H	6-metilpiridin-2-ila
A-144.	H	3-piridila
A-145.	H	2-cloropiridin-3-ila
A-146.	H	2-bromopiridin-3-ila
A-147.	H	2-metilpiridin-3-ila
A-148.	H	2,4-dicloropiridin-3-ila
A-149.	H	2,4-dibromopiridin-3-ila
A-150.	H	2,4-difluoropiridin-3-ila
A-151.	H	2-fluoro-4-cloropiridin-3-ila

No.	R ⁴	R ⁵
A-152.	H	2-cloro-4-fluoropiridin-3-ila
A-153.	H	2-cloro-4-metilpiridin-3-ila
A-154.	H	2-metila-4-fluoropiridin-3-ila
A-155.	H	2-metila-4-cloropiridin-3-ila
A-156.	H	2,4-dimetilpiridin-3-ila
A-157.	H	2,4,6-tricloropiridin-3-ila
A-158.	H	2,4,6-tribromopiridin-3-ila
A-159.	H	2,4,6-trimetilpiridin-3-ila
A-160.	H	2,4-dicloro-6-metilpiridin-3-ila
A-161.	H	4-piridila
A-162.	H	3-cloropiridin-4-ila
A-163.	H	3-bromopiridin-4-ila
A-164.	H	3-metilpiridin-4-ila
A-165.	H	3,5-dicloropiridin-4-ila
A-166.	H	3,5-dibromopiridin-4-ila
A-167.	H	3,5-dimetilpiridin-4-ila
A-168.	H	4-pirimidinila
A-169.	H	5-cloropirimidin-4-ila
A-170.	H	5-fluoropirimidin-4-ila
A-171.	H	5-fluoro-6-cloropirimidin-4-ila
A-172.	H	2-metila-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-173.	H	2,5-dimetila-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-174.	H	5-metila-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-175.	H	6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-176.	H	2-metila-5-fluoropirimidin-4-ila
A-177.	H	2-metila-5-cloropirimidin-4-ila
A-178.	H	5-cloro-6-metilpirimidin-4-ila
A-179.	H	5-cloro-6-etilpirimidin-4-ila
A-180.	H	5-cloro-6-isopropilpirimidin-4-ila
A-181.	H	5-bromo-6-metilpirimidin-4-ila
A-182.	H	5-fluoro-6-metilpirimidin-4-ila
A-183.	H	5-fluoro-6-fluorometilpirimidin-4-ila
A-184.	H	2,6-dimetila-5-cloropirimidin-4-ila
A-185.	H	5,6-dimetilpirimidin-4-ila
A-186.	H	2,5-dimetilpirimidin-4-ila
A-187.	H	2,5,6-trimetilpirimidin-4-ila
A-188.	H	5-metila-6-metoxipirimidin-4-ila
A-189.	H	5-pirimidinila
A-190.	H	4-metilpirimidin-5-ila
A-191.	H	4,6-dimetilpirimidin-5-ila
A-192.	H	2,4,6-trimetilpirimidin-5-ila
A-193.	H	4-trifluorometila-6-metilpirimidin-5-ila
A-194.	H	2-pirimidinila
A-195.	H	4,6-dimetilpirimidin-2-ila
A-196.	H	4,5,6-trimetilpirimidin-2-ila
A-197.	H	4,6-ditrifluorometilpirimidin-2-ila
A-198.	H	4,6-dimetil-5-cloropirimidin-2-ila
A-199.	CH ₃	fenila
A-200.	CH ₃	2-fluorofenila
A-201.	CH ₃	3-fluorofenila
A-202.	CH ₃	4-fluorofenila
A-203.	CH ₃	2-clorofenila
A-204.	CH ₃	3-clorofenila

No.	R ⁴	R ⁵
A-205.	CH ₃	4-clorofenila
A-206.	CH ₃	3-bromofenila
A-207.	CH ₃	4-bromofenila
A-208.	CH ₃	2-trifluorometilfenila
A-209.	CH ₃	3-trifluorometilfenila
A-210.	CH ₃	4-trifluorometilfenila
A-211.	CH ₃	2-(metiltio)fenila
A-212.	CH ₃	3-(metiltio)fenila
A-213.	CH ₃	4-(metiltio)fenila
A-214.	CH ₃	2-metoxifenila
A-215.	CH ₃	3-metoxifenila
A-216.	CH ₃	4-metoxifenila
A-217.	CH ₃	4-nitrofenila
A-218.	CH ₃	4-cianofenila
A-219.	CH ₃	4-terc-butilfenila
A-220.	CH ₃	4-isopropilfenila
A-221.	CH ₃	3-etoxifenila
A-222.	CH ₃	4-etoxifenila
A-223.	CH ₃	4-n-propoxifenila
A-224.	CH ₃	3-isopropoxifenila
A-225.	CH ₃	4-isopropoxifenila
A-226.	CH ₃	4-n-butoxifenila
A-227.	CH ₃	4-terc-butoxifenila
A-228.	CH ₃	4-(metoksiiminometil)fenila
A-229.	CH ₃	4-(1-(metoksiimino)etil)fenila
A-230.	CH ₃	2,3-difluorofenila
A-231.	CH ₃	2,4-difluorofenila
A-232.	CH ₃	2,5-difluorofenila
A-233.	CH ₃	3,4-difluorofenila
A-234.	CH ₃	3,5-difluorofenila
A-235.	CH ₃	2,6-difluorofenila
A-236.	CH ₃	2,4,6-trifluorofenila
A-237.	CH ₃	2,4,5-trifluorofenila
A-238.	CH ₃	2,3,4-trifluorofenila
A-239.	CH ₃	2,3,5-trifluorofenila
A-240.	CH ₃	3,4,5-trifluorofenila
A-241.	CH ₃	2,3-diclorofenila
A-242.	CH ₃	2,5-diclorofenila
A-243.	CH ₃	3,5-diclorofenila
A-244.	CH ₃	2,6-diclorofenila
A-245.	CH ₃	2,3-dimetilfenila
A-246.	CH ₃	2,4-dimetilfenila
A-247.	CH ₃	2,5-dimetilfenila
A-248.	CH ₃	2,4,5-trimetilfenila
A-249.	CH ₃	2,3-dimetoxifenila
A-250.	CH ₃	2,4-dimetoxifenila
A-251.	CH ₃	3,4-dimetoxifenila
A-252.	CH ₃	2,4-bis(trifluorometil)fenila
A-253.	CH ₃	3,5-bis(trifluorometil)fenila
A-254.	CH ₃	2-metila-3-metoxifenila
A-255.	CH ₃	2-metila-4-metoxifenila
A-256.	CH ₃	2-metila-6-metoxifenila
A-257.	CH ₃	3-cloro-4-fluorofenila

No.	R ⁴	R ⁵
A-258.	CH ₃	2-cloro-4-fluorofenila
A-259.	CH ₃	2-cloro-6-fluorofenila
A-260.	CH ₃	4-cloro-2-fluorofenila
A-261.	CH ₃	5-cloro-2-fluorofenila
A-262.	CH ₃	4-fluoro-3-metilfenila
A-263.	CH ₃	2-fluoro-4-metilfenila
A-264.	CH ₃	4-fluoro-2-metilfenila
A-265.	CH ₃	2-fluoro-3-metoxifenila
A-266.	CH ₃	2-fluoro-4-metoxifenila
A-267.	CH ₃	2-fluoro-6-metoxifenila
A-268.	CH ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenila
A-269.	CH ₃	4-cloro-3-metilfenila
A-270.	CH ₃	2-cloro-4-metilfenila
A-271.	CH ₃	2-cloro-6-metilfenila
A-272.	CH ₃	5-cloro-2-metilfenila
A-273.	CH ₃	3-cloro-2-metilfenila
A-274.	CH ₃	2-cloro-4-metoxifenila
A-275.	CH ₃	2-cloro-6-metoxifenila
A-276.	CH ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenila
A-277.	CH ₃	3-fluoro-4-metilfenila
A-278.	CH ₃	3-fluoro-4-isopropilfenila
A-279.	CH ₃	4-fluoro-3-metilfenila
A-280.	CH ₃	3-fluoro-4-metoxifenila
A-281.	CH ₃	3-fluoro-4-etoxifenila
A-282.	CH ₃	3-fluoro-4-trifluorometilfenila
A-283.	CH ₃	3-cloro-4-metilfenila
A-284.	CH ₃	3-cloro-4-metoxifenila
A-285.	CH ₃	3-cloro-4-etoxifenila
A-286.	CH ₃	3-cloro-4-trifluorometilfenila
A-287.	CH ₃	3-metila-4-metoxifenila
A-288.	CH ₃	4-cloro-2,5-difluorofenila
A-289.	CH ₃	4-terc-butila-2-fluorofenila
A-290.	CH ₃	2-fluoro-4-isopropilfenila
A-291.	CH ₃	4-etoxi-2-fluorofenila
A-292.	CH ₃	4-acetila-2-fluorofenila
A-293.	CH ₃	2-tienila
A-294.	CH ₃	5-metiltiofen-2-ila
A-295.	CH ₃	4-metiltiofen-2-ila
A-296.	CH ₃	5-clorotiofen-2-ila
A-297.	CH ₃	3-cianotiofen-2-ila
A-298.	CH ₃	5-formiltiofen-2-ila
A-299.	CH ₃	5-acetiltiofen-2-ila
A-300.	CH ₃	5-(metoksiiminometil)tiofen-2-ila
A-301.	CH ₃	5-(1-(metoksiimino)etil)tiofen-2-ila
A-302.	CH ₃	4-bromotiofen-2-ila
A-303.	CH ₃	3,5-diclorotiofen-2-ila
A-304.	CH ₃	3-tienila
A-305.	CH ₃	2-metiltiofen-3-ila
A-306.	CH ₃	2,5-diclorotiofen-3-ila
A-307.	CH ₃	2,4,5-triclorotiofen-3-ila
A-308.	CH ₃	2-furila
A-309.	CH ₃	5-metilfuran-2-ila
A-310.	CH ₃	5-clorofuran-2-ila

No.	R ⁴	R ⁵
A-311.	CH ₃	4-metilfuran-2-ila
A-312.	CH ₃	3-cianofuran-2-ila
A-313.	CH ₃	5-acetilfuran-2-ila
A-314.	CH ₃	3-furila
A-315.	CH ₃	2-metilfuran-3-ila
A-316.	CH ₃	2,5-dimetilfuran-3-ila
A-317.	CH ₃	2-piridila
A-318.	CH ₃	3-fluoropiridin-2-ila
A-319.	CH ₃	3-cloropiridin-2-ila
A-320.	CH ₃	3-bromopiridin-2-ila
A-321.	CH ₃	3-trifluorometilpiridin-2-ila
A-322.	CH ₃	3-metilpiridin-2-ila
A-323.	CH ₃	3-etilpiridin-2-ila
A-324.	CH ₃	3,5-difluoropiridin-2-ila
A-325.	CH ₃	3,5-dicloropiridin-2-ila
A-326.	CH ₃	3,5-dibromopiridin-2-ila
A-327.	CH ₃	3,5-dimetilpiridin-2-ila
A-328.	CH ₃	3-fluoro-5-trifluorometilpiridin-2-ila
A-329.	CH ₃	3-cloro-5-fluoropiridin-2-ila
A-330.	CH ₃	3-cloro-5-metilpiridin-2-ila
A-331.	CH ₃	3-fluoro-5-cloropiridin-2-ila
A-332.	CH ₃	3-fluoro-5-metilpiridin-2-ila
A-333.	CH ₃	3-metila-5-fluoropiridin-2-ila
A-334.	CH ₃	3-metila-5-cloropiridin-2-ila
A-335.	CH ₃	5-nitropiridin-2-ila
A-336.	CH ₃	5-cianopiridin-2-ila
A-337.	CH ₃	5-metoxicarbonilpiridin-2-ila
A-338.	CH ₃	5-trifluorometilpiridin-2-ila
A-339.	CH ₃	5-metilpiridin-2-ila
A-340.	CH ₃	4-metilpiridin-2-ila
A-341.	CH ₃	6-metilpiridin-2-ila
A-342.	CH ₃	3-piridila
A-343.	CH ₃	2-cloropiridin-3-ila
A-344.	CH ₃	2-bromopiridin-3-ila
A-345.	CH ₃	2-metilpiridin-3-ila
A-346.	CH ₃	2,4-dicloropiridin-3-ila
A-347.	CH ₃	2,4-dibromopiridin-3-ila
A-348.	CH ₃	2,4-difluoropiridin-3-ila
A-349.	CH ₃	2-fluoro-4-cloropiridin-3-ila
A-350.	CH ₃	2-cloro-4-fluoropiridin-3-ila
A-351.	CH ₃	2-cloro-4-metilpiridin-3-ila
A-352.	CH ₃	2-metil-4-fluoropiridin-3-ila
A-353.	CH ₃	2-metil-4-cloropiridin-3-ila
A-354.	CH ₃	2,4-dimetilpiridin-3-ila
A-355.	CH ₃	2,4,6-tricloropiridin-3-ila
A-356.	CH ₃	2,4,6-tribromopiridin-3-ila
A-357.	CH ₃	2,4,6-trimetilpiridin-3-ila
A-358.	CH ₃	2,4-dicloro-6-metilpiridin-3-ila
A-359.	CH ₃	4-piridila
A-360.	CH ₃	3-cloropiridin-4-ila
A-361.	CH ₃	3-bromopiridin-4-ila
A-362.	CH ₃	3-metilpiridin-4-ila
A-363.	CH ₃	3,5-dicloropiridin-4-ila

No.	R ⁴	R ⁵
A-364.	CH ₃	3,5-dibromopiridin-4-ila
A-365.	CH ₃	3,5-dimetilpiridin-4-ila
A-366.	CH ₃	4-pirimidinila
A-367.	CH ₃	5-cloropirimidin-4-ila
A-368.	CH ₃	5-fluoropirimidin-4-ila
A-369.	CH ₃	5-fluoro-6-cloropirimidin-4-ila
A-370.	CH ₃	2-metil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-371.	CH ₃	2,5-dimetil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-372.	CH ₃	5-metil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-373.	CH ₃	6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-374.	CH ₃	2-metil-5-fluoropirimidin-4-ila
A-375.	CH ₃	2-metil-5-cloropirimidin-4-ila
A-376.	CH ₃	5-cloro-6-metilpirimidin-4-ila
A-377.	CH ₃	5-cloro-6-etilpirimidin-4-ila
A-378.	CH ₃	5-cloro-6-isopropilpirimidin-4-ila
A-379.	CH ₃	5-bromo-6-metilpirimidin-4-ila
A-380.	CH ₃	5-fluoro-6-metilpirimidin-4-ila
A-381.	CH ₃	5-fluoro-6-fluorometilpirimidin-4-ila
A-382.	CH ₃	2,6-dimetil-5-cloropirimidin-4-ila
A-383.	CH ₃	5,6-dimetilpirimidin-4-ila
A-384.	CH ₃	2,5-dimetilpirimidin-4-ila
A-385.	CH ₃	2,5,6-trimetilpirimidin-4-ila
A-386.	CH ₃	5-metil-6-metoxipirimidin-4-ila
A-387.	CH ₃	5-pirimidinila
A-388.	CH ₃	4-metilpirimidin-5-ila
A-389.	CH ₃	4,6-dimetilpirimidin-5-ila
A-390.	CH ₃	2,4,6-trimetilpirimidin-5-ila
A-391.	CH ₃	4-trifluorometil-6-metilpirimidin-5-ila
A-392.	CH ₃	2-pirimidinila
A-393.	CH ₃	4,6-dimetilpirimidin-2-ila
A-394.	CH ₃	4,5,6-trimetilpirimidin-2-ila
A-395.	CH ₃	4,6-ditrifluorometilpirimidin-2-ila
A-396.	CH ₃	4,6-dimetil-5-cloropirimidin-2-ila
A-397.	CF ₃	fenila
A-398.	CF ₃	2-fluorofenila
A-399.	CF ₃	3-fluorofenila
A-400.	CF ₃	4-fluorofenila
A-401.	CF ₃	2-clorofenila
A-402.	CF ₃	3-clorofenila
A-403.	CF ₃	4-clorofenila
A-404.	CF ₃	3-bromofenila
A-405.	CF ₃	4-bromofenila
A-406.	CF ₃	2-trifluorometilfenila
A-407.	CF ₃	3-trifluorometilfenila
A-408.	CF ₃	4-trifluorometilfenila
A-409.	CF ₃	2-(metiltio)fenila
A-410.	CF ₃	3-(metiltio)fenila
A-411.	CF ₃	4-(metiltio)fenila
A-412.	CF ₃	2-metoxifenila
A-413.	CF ₃	3-metoxifenila
A-414.	CF ₃	4-metoxifenila
A-415.	CF ₃	4-nitrofenila
A-416.	CF ₃	4-cianofenila

No.	R ⁴	R ⁵
A-417.	CF ₃	4-terc-butilfenila
A-418.	CF ₃	4-isopropilfenila
A-419.	CF ₃	3-etoxifenila
A-420.	CF ₃	4-etoxifenila
A-421.	CF ₃	4-n-propoxifenila
A-422.	CF ₃	3-isopropoxifenila
A-423.	CF ₃	4-isopropoxifenila
A-424.	CF ₃	4-n-butoxifenila
A-425.	CF ₃	4-terc-butoxifenila
A-426.	CF ₃	4-(metoxiiminometil)fenila
A-427.	CF ₃	4-(1-(metoxiimino)etil)fenila
A-428.	CF ₃	2,3-difluorofenila
A-429.	CF ₃	2,4-difluorofenila
A-430.	CF ₃	2,5-difluorofenila
A-431.	CF ₃	3,4-difluorofenila
A-432.	CF ₃	3,5-difluorofenila
A-433.	CF ₃	2,6-difluorofenila
A-434.	CF ₃	2,4,6-trifluorofenila
A-435.	CF ₃	2,4,5-trifluorofenila
A-436.	CF ₃	2,3,4-trifluorofenila
A-437.	CF ₃	2,3,5-trifluorofenila
A-438.	CF ₃	3,4,5-trifluorofenila
A-439.	CF ₃	2,3-diclorofenila
A-440.	CF ₃	2,5-diclorofenila
A-441.	CF ₃	3,5-diclorofenila
A-442.	CF ₃	2,6-diclorofenila
A-443.	CF ₃	2,3-dimetilfenila
A-444.	CF ₃	2,4-dimetilfenila
A-445.	CF ₃	2,5-dimetilfenila
A-446.	CF ₃	2,4,5-trimetilfenila
A-447.	CF ₃	2,3-dimetoxifenila
A-448.	CF ₃	2,4-dimetoxifenila
A-449.	CF ₃	3,4-dimetoxifenila
A-450.	CF ₃	2,4-bis(trifluorometil)fenila
A-451.	CF ₃	3,5-bis(trifluorometil)fenila
A-452.	CF ₃	2-metil-3-metoxifenila
A-453.	CF ₃	2-metil-4-metoxifenila
A-454.	CF ₃	2-metil-6-metoxifenila
A-455.	CF ₃	3-cloro-4-fluorofenila
A-456.	CF ₃	2-cloro-4-fluorofenila
A-457.	CF ₃	2-cloro-6-fluorofenila
A-458.	CF ₃	4-cloro-2-fluorofenila
A-459.	CF ₃	5-cloro-2-fluorofenila
A-460.	CF ₃	4-fluoro-3-metilfenila
A-461.	CF ₃	2-fluoro-4-metilfenila
A-462.	CF ₃	4-fluoro-2-metilfenila
A-463.	CF ₃	2-fluoro-3-metoxifenila
A-464.	CF ₃	2-fluoro-4-metoxifenila
A-465.	CF ₃	2-fluoro-6-metoxifenila
A-466.	CF ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenila
A-467.	CF ₃	4-cloro-3-metilfenila
A-468.	CF ₃	2-cloro-4-metilfenila
A-469.	CF ₃	2-cloro-6-metilfenila

No.	R ⁴	R ⁵
A-470.	CF ₃	5-cloro-2-metilfenila
A-471.	CF ₃	3-cloro-2-metilfenila
A-472.	CF ₃	2-cloro-4-metoxifenila
A-473.	CF ₃	2-cloro-6-metoxifenila
A-474.	CF ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenila
A-475.	CF ₃	3-fluoro-4-metilfenila
A-476.	CF ₃	3-fluoro-4-isopropilfenila
A-477.	CF ₃	4-fluoro-3-metilfenila
A-478.	CF ₃	3-fluoro-4-metoxifenila
A-479.	CF ₃	3-fluoro-4-etoxifenila
A-480.	CF ₃	3-fluoro-4-trifluorometilfenila
A-481.	CF ₃	3-cloro-4-metilfenila
A-482.	CF ₃	3-cloro-4-metoxifenila
A-483.	CF ₃	3-cloro-4-etoxifenila
A-484.	CF ₃	3-cloro-4-trifluorometilfenila
A-485.	CF ₃	3-metil-4-metoxifenila
A-486.	CF ₃	4-cloro-2,5-difluorofenila
A-487.	CF ₃	4-terc-butila-2-fluorofenila
A-488.	CF ₃	2-fluoro-4-isopropilfenila
A-489.	CF ₃	4-etoxi-2-fluorofenila
A-490.	CF ₃	4-acetila-2-fluorofenila
A-491.	CF ₃	2-tienila
A-492.	CF ₃	5-metiltiofen-2-ila
A-493.	CF ₃	4-metiltiofen-2-ila
A-494.	CF ₃	5-clorotiofen-2-ila
A-495.	CF ₃	3-cianotiofen-2-ila
A-496.	CF ₃	5-formiltiofen-2-ila
A-497.	CF ₃	5-acetiltiofen-2-ila
A-498.	CF ₃	5-(metoksiiminometila)tiofen-2-ila
A-499.	CF ₃	5-(1-(metoksiimino)etila)tiofen-2-ila
A-500.	CF ₃	4-bromotiofen-2-ila
A-501.	CF ₃	3,5-diclorotiofen-2-ila
A-502.	CF ₃	3-tienila
A-503.	CF ₃	2-metiltiofen-3-ila
A-504.	CF ₃	2,5-diclorotiofen-3-ila
A-505.	CF ₃	2,4,5-triclorotiofen-3-ila
A-506.	CF ₃	2-furila
A-507.	CF ₃	5-metilfuran-2-ila
A-508.	CF ₃	5-clorofuran-2-ila
A-509.	CF ₃	4-metilfuran-2-ila
A-510.	CF ₃	3-cianofuran-2-ila
A-511.	CF ₃	5-acetilfuran-2-ila
A-512.	CF ₃	3-furila
A-513.	CF ₃	2-metilfuran-3-ila
A-514.	CF ₃	2,5-dimetilfuran-3-ila
A-515.	CF ₃	2-piridila
A-516.	CF ₃	3-fluoropiridin-2-ila
A-517.	CF ₃	3-cloropiridin-2-ila
A-518.	CF ₃	3-bromopiridin-2-ila
A-519.	CF ₃	3-trifluorometilpiridin-2-ila
A-520.	CF ₃	3-metilpiridin-2-ila
A-521.	CF ₃	3-etilpiridin-2-ila
A-522.	CF ₃	3,5-difluoropiridin-2-ila

No.	R ⁴	R ⁵
A-523.	CF ₃	3,5-dicloropiridin-2-ila
A-524.	CF ₃	3,5-dibromopiridin-2-ila
A-525.	CF ₃	3,5-dimetilpiridin-2-ila
A-526.	CF ₃	3-fluoro-5-trifluorometilpiridin-2-ila
A-527.	CF ₃	3-cloro-5-fluoropiridin-2-ila
A-528.	CF ₃	3-cloro-5-metilpiridin-2-ila
A-529.	CF ₃	3-fluoro-5-cloropiridin-2-ila
A-530.	CF ₃	3-fluoro-5-metilpiridin-2-ila
A-531.	CF ₃	3-metil-5-fluoropiridin-2-ila
A-532.	CF ₃	3-metil-5-cloropiridin-2-ila
A-533.	CF ₃	5-nitropiridin-2-ila
A-534.	CF ₃	5-cianopiridin-2-ila
A-535.	CF ₃	5-metoxycarbonilpiridin-2-ila
A-536.	CF ₃	5-trifluorometilpiridin-2-ila
A-537.	CF ₃	5-metilpiridin-2-ila
A-538.	CF ₃	4-metilpiridin-2-ila
A-539.	CF ₃	6-metilpiridin-2-ila
A-540.	CF ₃	3-piridila
A-541.	CF ₃	2-cloropiridin-3-ila
A-542.	CF ₃	2-bromopiridin-3-ila
A-543.	CF ₃	2-metilpiridin-3-ila
A-544.	CF ₃	2,4-dicloropiridin-3-ila
A-545.	CF ₃	2,4-dibromopiridin-3-ila
A-546.	CF ₃	2,4-difluoropiridin-3-ila
A-547.	CF ₃	2-fluoro-4-cloropiridin-3-ila
A-548.	CF ₃	2-cloro-4-fluoropiridin-3-ila
A-549.	CF ₃	2-cloro-4-metilpiridin-3-ila
A-550.	CF ₃	2-metil-4-fluoropiridin-3-ila
A-551.	CF ₃	2-metil-4-cloropiridin-3-ila
A-552.	CF ₃	2,4-dimetilpiridin-3-ila
A-553.	CF ₃	2,4,6-tricloropiridin-3-ila
A-554.	CF ₃	2,4,6-tribromopiridin-3-ila
A-555.	CF ₃	2,4,6-trimetilpiridin-3-ila
A-556.	CF ₃	2,4-dicloro-6-metilpiridin-3-ila
A-557.	CF ₃	4-piridila
A-558.	CF ₃	3-cloropiridin-4-ila
A-559.	CF ₃	3-bromopiridin-4-ila
A-560.	CF ₃	3-metilpiridin-4-ila
A-561.	CF ₃	3,5-dicloropiridin-4-ila
A-562.	CF ₃	3,5-dibromopiridin-4-ila
A-563.	CF ₃	3,5-dimetilpiridin-4-ila
A-564.	CF ₃	4-pirimidinila
A-565.	CF ₃	5-cloropirimidin-4-ila
A-566.	CF ₃	5-fluoropirimidin-4-ila
A-567.	CF ₃	5-fluoro-6-cloropirimidin-4-ila
A-568.	CF ₃	2-metil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-569.	CF ₃	2,5-dimetil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-570.	CF ₃	5-metil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-571.	CF ₃	6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-572.	CF ₃	2-metil-5-fluoropirimidin-4-ila
A-573.	CF ₃	2-metil-5-cloropirimidin-4-ila
A-574.	CF ₃	5-cloro-6-metilpirimidin-4-ila
A-575.	CF ₃	5-cloro-6-etilpirimidin-4-ila

No.	R ⁴	R ⁵
A-576.	CF ₃	5-cloro-6-isopropilapirimidin-4-ila
A-577.	CF ₃	5-bromo-6-metilpirimidin-4-ila
A-578.	CF ₃	5-fluoro-6-metilpirimidin-4-ila
A-579.	CF ₃	5-fluoro-6-fluorometilpirimidin-4-ila
A-580.	CF ₃	2,6-dimetil-5-cloropirimidin-4-ila
A-581.	CF ₃	5,6-dimetilpirimidin-4-ila
A-582.	CF ₃	2,5-dimetilpirimidin-4-ila
A-583.	CF ₃	2,5,6-trimetilpirimidin-4-ila
A-584.	CF ₃	5-metil-6-metoxipirimidin-4-ila
A-585.	CF ₃	5-pirimidinila
A-586.	CF ₃	4-metilpirimidin-5-ila
A-587.	CF ₃	4,6-dimetilpirimidin-5-ila
A-588.	CF ₃	2,4,6-trimetilpirimidin-5-ila
A-589.	CF ₃	4-trifluorometil-6-metilpirimidin-5-ila
A-590.	CF ₃	2-pirimidinila
A-591.	CF ₃	4,6-dimetilpirimidin-2-ila
A-592.	CF ₃	4,5,6-trimetilpirimidin-2-ila
A-593.	CF ₃	4,6-ditrifluorometilpirimidin-2-ila
A-594.	CF ₃	4,6-dimetil-5-cloropirimidin-2-ila
A-595.	OCH ₃	fenila
A-596.	OCH ₃	2-fluorofenila
A-597.	OCH ₃	3-fluorofenila
A-598.	OCH ₃	4-fluorofenila
A-599.	OCH ₃	2-clorofenila
A-600.	OCH ₃	3-clorofenila
A-601.	OCH ₃	4-clorofenila
A-602.	OCH ₃	3-bromofenila
A-603.	OCH ₃	4-bromofenila
A-604.	OCH ₃	2-trifluorometilfenila
A-605.	OCH ₃	3-trifluorometilfenila
A-606.	OCH ₃	4-trifluorometilfenila
A-607.	OCH ₃	2-(metiltio)fenila
A-608.	OCH ₃	3-(metiltio)fenila
A-609.	OCH ₃	4-(metiltio)fenila
A-610.	OCH ₃	2-metoxifenila
A-611.	OCH ₃	3-metoxifenila
A-612.	OCH ₃	4-metoxifenila
A-613.	OCH ₃	4-nitrofenila
A-614.	OCH ₃	4-cianofenila
A-615.	OCH ₃	4-terc-butilfenila
A-616.	OCH ₃	4-isopropilfenila
A-617.	OCH ₃	3-etoxifenila
A-618.	OCH ₃	4-etoxifenila
A-619.	OCH ₃	4-n-propoxifenila
A-620.	OCH ₃	3-isopropoxifenila
A-621.	OCH ₃	4-isopropoxifenila
A-622.	OCH ₃	4-n-butoxifenila
A-623.	OCH ₃	4-terc-butoxifenila
A-624.	OCH ₃	4-(metoksiiminometil)fenila
A-625.	OCH ₃	4-(1-(metoksiimino)etil)fenila
A-626.	OCH ₃	2,3-difluorofenila
A-627.	OCH ₃	2,4-difluorofenila
A-628.	OCH ₃	2,5-difluorofenila

No.	R ⁴	R ⁵
A-629.	OCH ₃	3,4-difluorofenila
A-630.	OCH ₃	3,5-difluorofenila
A-631.	OCH ₃	2,6-difluorofenila
A-632.	OCH ₃	2,4,6-trifluorofenila
A-633.	OCH ₃	2,4,5-trifluorofenila
A-634.	OCH ₃	2,3,4-trifluorofenila
A-635.	OCH ₃	2,3,5-trifluorofenila
A-636.	OCH ₃	3,4,5-trifluorofenila
A-637.	OCH ₃	2,3-diclorofenila
A-638.	OCH ₃	2,5-diclorofenila
A-639.	OCH ₃	3,5-diclorofenila
A-640.	OCH ₃	2,6-diclorofenila
A-641.	OCH ₃	2,3-dimetilfenila
A-642.	OCH ₃	2,4-dimetilfenila
A-643.	OCH ₃	2,5-dimetilfenila
A-644.	OCH ₃	2,4,5-trimetilfenila
A-645.	OCH ₃	2,3-dimetoxifenila
A-646.	OCH ₃	2,4-dimetoxifenila
A-647.	OCH ₃	3,4-dimetoxifenila
A-648.	OCH ₃	2,4-bis(trifluorometil)fenila
A-649.	OCH ₃	3,5-bis(trifluorometil)fenila
A-650.	OCH ₃	2-metil-3-metoxifenila
A-651.	OCH ₃	2-metil-4-metoxifenila
A-652.	OCH ₃	2-metil-6-metoxifenila
A-653.	OCH ₃	3-cloro-4-fluorofenila
A-654.	OCH ₃	2-cloro-4-fluorofenila
A-655.	OCH ₃	2-cloro-6-fluorofenila
A-656.	OCH ₃	4-cloro-2-fluorofenila
A-657.	OCH ₃	5-cloro-2-fluorofenila
A-658.	OCH ₃	4-fluoro-3-metilfenila
A-659.	OCH ₃	2-fluoro-4-metilfenila
A-660.	OCH ₃	4-fluoro-2-metilfenila
A-661.	OCH ₃	2-fluoro-3-metoxifenila
A-662.	OCH ₃	2-fluoro-4-metoxifenila
A-663.	OCH ₃	2-fluoro-6-metoxifenila
A-664.	OCH ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenila
A-665.	OCH ₃	4-cloro-3-metilfenila
A-666.	OCH ₃	2-cloro-4-metilfenila
A-667.	OCH ₃	2-cloro-6-metilfenila
A-668.	OCH ₃	5-cloro-2-metilfenila
A-669.	OCH ₃	3-cloro-2-metilfenila
A-670.	OCH ₃	2-cloro-4-metoxifenila
A-671.	OCH ₃	2-cloro-6-metoxifenila
A-672.	OCH ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenila
A-673.	OCH ₃	3-fluoro-4-metilfenila
A-674.	OCH ₃	3-fluoro-4-isopropilfenila
A-675.	OCH ₃	4-fluoro-3-metilfenila
A-676.	OCH ₃	3-fluoro-4-metoxifenila
A-677.	OCH ₃	3-fluoro-4-etoxifenila
A-678.	OCH ₃	3-fluoro-4-trifluorometilfenila
A-679.	OCH ₃	3-cloro-4-metilfenila
A-680.	OCH ₃	3-cloro-4-metoxifenila
A-681.	OCH ₃	3-cloro-4-etoxifenila

No.	R ⁴	R ⁵
A-682.	OCH ₃	3-cloro-4-trifluorometilfenila
A-683.	OCH ₃	3-metil-4-metoxifenila
A-684.	OCH ₃	4-cloro-2,5-difluorofenila
A-685.	OCH ₃	4-terc-butila-2-fluorofenila
A-686.	OCH ₃	2-fluoro-4-isopropilfenila
A-687.	OCH ₃	4-etoxi-2-fluorofenila
A-688.	OCH ₃	4-acetila-2-fluorofenila
A-689.	OCH ₃	2-tienila
A-690.	OCH ₃	5-metiltiofen-2-ila
A-691.	OCH ₃	4-metiltiofen-2-ila
A-692.	OCH ₃	5-clorotiofen-2-ila
A-693.	OCH ₃	3-cianotiofen-2-ila
A-694.	OCH ₃	5-formiltiofen-2-ila
A-695.	OCH ₃	5-acetiltiofen-2-ila
A-696.	OCH ₃	5-(metoxiiminometila)tiofen-2-ila
A-697.	OCH ₃	5-(1-(metoxiimino)etila)tiofen-2-ila
A-698.	OCH ₃	4-bromotiofen-2-ila
A-699.	OCH ₃	3,5-diclorotiofen-2-ila
A-700.	OCH ₃	3-tienila
A-701.	OCH ₃	2-metiltiofen-3-ila
A-702.	OCH ₃	2,5-diclorotiofen-3-ila
A-703.	OCH ₃	2,4,5-tricloro-tiofen-3-ila
A-704.	OCH ₃	2-furila
A-705.	OCH ₃	5-metilfuran-2-ila
A-706.	OCH ₃	5-clorofuran-2-ila
A-707.	OCH ₃	4-metilfuran-2-ila
A-708.	OCH ₃	3-cianofuran-2-ila
A-709.	OCH ₃	5-acetilfuran-2-ila
A-710.	OCH ₃	3-furila
A-711.	OCH ₃	2-metilfuran-3-ila
A-712.	OCH ₃	2,5-dimetilfuran-3-ila
A-713.	OCH ₃	2-piridila
A-714.	OCH ₃	3-fluoropiridin-2-ila
A-715.	OCH ₃	3-cloropiridin-2-ila
A-716.	OCH ₃	3-bromopiridin-2-ila
A-717.	OCH ₃	3-trifluorometilpiridin-2-ila
A-718.	OCH ₃	3-metilpiridin-2-ila
A-719.	OCH ₃	3-etilpiridin-2-ila
A-720.	OCH ₃	3,5-difluoropiridin-2-ila
A-721.	OCH ₃	3,5-dicloropiridin-2-ila
A-722.	OCH ₃	3,5-dibromopiridin-2-ila
A-723.	OCH ₃	3,5-dimetilpiridin-2-ila
A-724.	OCH ₃	3-fluoro-5-trifluorometilpiridin-2-ila
A-725.	OCH ₃	3-cloro-5-fluoropiridin-2-ila
A-726.	OCH ₃	3-cloro-5-metilpiridin-2-ila
A-727.	OCH ₃	3-fluoro-5-cloropiridin-2-ila
A-728.	OCH ₃	3-fluoro-5-metilpiridin-2-ila
A-729.	OCH ₃	3-metil-5-fluoropiridin-2-ila
A-730.	OCH ₃	3-metil-5-cloropiridin-2-ila
A-731.	OCH ₃	5-nitropiridin-2-ila
A-732.	OCH ₃	5-cianopiridin-2-ila
A-733.	OCH ₃	5-metoxicarbonilapiridin-2-ila
A-734.	OCH ₃	5-trifluorometilpiridin-2-ila

No.	R ⁴	R ⁵
A-735.	OCH ₃	5-metilpiridin-2-ila
A-736.	OCH ₃	4-metilpiridin-2-ila
A-737.	OCH ₃	6-metilpiridin-2-ila
A-738.	OCH ₃	3-piridila
A-739.	OCH ₃	2-cloropiridin-3-ila
A-740.	OCH ₃	2-bromopiridin-3-ila
A-741.	OCH ₃	2-metilpiridin-3-ila
A-742.	OCH ₃	2,4-dicloropiridin-3-ila
A-743.	OCH ₃	2,4-dibromopiridin-3-ila
A-744.	OCH ₃	2,4-difluoropiridin-3-ila
A-745.	OCH ₃	2-fluoro-4-cloropiridin-3-ila
A-746.	OCH ₃	2-cloro-4-fluoropiridin-3-ila
A-747.	OCH ₃	2-cloro-4-metilpiridin-3-ila
A-748.	OCH ₃	2-metil-4-fluoropiridin-3-ila
A-749.	OCH ₃	2-metil-4-cloropiridin-3-ila
A-750.	OCH ₃	2,4-dimetilpiridin-3-ila
A-751.	OCH ₃	2,4,6-tricloropiridin-3-ila
A-752.	OCH ₃	2,4,6-tribromopiridin-3-ila
A-753.	OCH ₃	2,4,6-trimetilpiridin-3-ila
A-754.	OCH ₃	2,4-dicloro-6-metilpiridin-3-ila
A-755.	OCH ₃	4-piridila
A-756.	OCH ₃	3-cloropiridin-4-ila
A-757.	OCH ₃	3-bromopiridin-4-ila
A-758.	OCH ₃	3-metilpiridin-4-ila
A-759.	OCH ₃	3,5-dicloropiridin-4-ila
A-760.	OCH ₃	3,5-dibromopiridin-4-ila
A-761.	OCH ₃	3,5-dimetilpiridin-4-ila
A-762.	OCH ₃	4-pirimidinila
A-763.	OCH ₃	5-cloropirimidin-4-ila
A-764.	OCH ₃	5-fluoropirimidin-4-ila
A-765.	OCH ₃	5-fluoro-6-cloropirimidin-4-ila
A-766.	OCH ₃	2-metil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-767.	OCH ₃	2,5-dimetil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-768.	OCH ₃	5-metil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-769.	OCH ₃	6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-770.	OCH ₃	2-metil-5-fluoropirimidin-4-ila
A-771.	OCH ₃	2-metil-5-cloropirimidin-4-ila
A-772.	OCH ₃	5-cloro-6-metilpirimidin-4-ila
A-773.	OCH ₃	5-cloro-6-etilpirimidin-4-ila
A-774.	OCH ₃	5-cloro-6-isopropilpirimidin-4-ila
A-775.	OCH ₃	5-bromo-6-metilpirimidin-4-ila
A-776.	OCH ₃	5-fluoro-6-metilpirimidin-4-ila
A-777.	OCH ₃	5-fluoro-6-fluorometilpirimidin-4-ila
A-778.	OCH ₃	2,6-dimetil-5-cloropirimidin-4-ila
A-779.	OCH ₃	5,6-dimetilpirimidin-4-ila
A-780.	OCH ₃	2,5-dimetilpirimidin-4-ila
A-781.	OCH ₃	2,5,6-trimetilpirimidin-4-ila
A-782.	OCH ₃	5-metil-6-metoxipirimidin-4-ila
A-783.	OCH ₃	5-pirimidinila
A-784.	OCH ₃	4-metilpirimidin-5-ila
A-785.	OCH ₃	4,6-dimetilpirimidin-5-ila
A-786.	OCH ₃	2,4,6-trimetilpirimidin-5-ila
A-787.	OCH ₃	4-trifluorometil-6-metilpirimidin-5-ila

No.	R ⁴	R ⁵
A-788.	OCH ₃	2-pirimidinila
A-789.	OCH ₃	4,6-dimetilpirimidin-2-ila
A-790.	OCH ₃	4,5,6-trimetilpirimidin-2-ila
A-791.	OCH ₃	4,6-ditri fluorometilpirimidin-2-ila
A-792.	OCH ₃	4,6-dimetil-5-cloropirimidin-2-ila
A-793.	Cl	fenila
A-794.	Cl	2-fluorofenila
A-795.	Cl	3-fluorofenila
A-796.	Cl	4-fluorofenila
A-797.	Cl	2-clorofenila
A-798.	Cl	3-clorofenila
A-799.	Cl	4-clorofenila
A-800.	Cl	3-bromofenila
A-801.	Cl	4-bromofenila
A-802.	Cl	2-trifluorometilfenila
A-803.	Cl	3-trifluorometilfenila
A-804.	Cl	4-trifluorometilfenila
A-805.	Cl	2-(metiltio)fenila
A-806.	Cl	3-(metiltio)fenila
A-807.	Cl	4-(metiltio)fenila
A-808.	Cl	2-metoxifenila
A-809.	Cl	3-metoxifenila
A-810.	Cl	4-metoxifenila
A-811.	Cl	4-nitrofenila
A-812.	Cl	4-cianofenila
A-813.	Cl	4-terc-butilfenila
A-814.	Cl	4-isopropilfenila
A-815.	Cl	3-etoxifenila
A-816.	Cl	4-etoxifenila
A-817.	Cl	4-n-propoxifenila
A-818.	Cl	3-isopropoxifenila
A-819.	Cl	4-isopropoxifenila
A-820.	Cl	4-n-butoxifenila
A-821.	Cl	4-terc-butoxifenila
A-822.	Cl	4-(metoksiiminometil)fenila
A-823.	Cl	4-(1-(metoksiimino)etil)fenila
A-824.	Cl	2,3-difluorofenila
A-825.	Cl	2,4-difluorofenila
A-826.	Cl	2,5-difluorofenila
A-827.	Cl	3,4-difluorofenila
A-828.	Cl	3,5-difluorofenila
A-829.	Cl	2,6-difluorofenila
A-830.	Cl	2,4,6-trifluorofenila
A-831.	Cl	2,4,5-trifluorofenila
A-832.	Cl	2,3,4-trifluorofenila
A-833.	Cl	2,3,5-trifluorofenila
A-834.	Cl	3,4,5-trifluorofenila
A-835.	Cl	2,3-diclorofenila
A-836.	Cl	2,5-diclorofenila
A-837.	Cl	3,5-diclorofenila
A-838.	Cl	2,6-diclorofenila
A-839.	Cl	2,3-dimetilfenila
A-840.	Cl	2,4-dimetilfenila

No.	R ⁴	R ⁵
A-841.	Cl	2,5-dimetilfenila
A-842.	Cl	2,4,5-trimetilfenila
A-843.	Cl	2,3-dimetoxifenila
A-844.	Cl	2,4-dimetoxifenila
A-845.	Cl	3,4-dimetoxifenila
A-846.	Cl	2,4-bis(trifluorometil)fenila
A-847.	Cl	3,5-bis(trifluorometil)fenila
A-848.	Cl	2-metil-3-metoxifenila
A-849.	Cl	2-metil-4-metoxifenila
A-850.	Cl	2-metil-6-metoxifenila
A-851.	Cl	3-cloro-4-fluorofenila
A-852.	Cl	2-cloro-4-fluorofenila
A-853.	Cl	2-cloro-6-fluorofenila
A-854.	Cl	4-cloro-2-fluorofenila
A-855.	Cl	5-cloro-2-fluorofenila
A-856.	Cl	4-fluoro-3-metilfenila
A-857.	Cl	2-fluoro-4-metilfenila
A-858.	Cl	4-fluoro-2-metilfenila
A-859.	Cl	2-fluoro-3-metoxifenila
A-860.	Cl	2-fluoro-4-metoxifenila
A-861.	Cl	2-fluoro-6-metoxifenila
A-862.	Cl	2-fluoro-4-trifluorometilfenila
A-863.	Cl	4-cloro-3-metilfenila
A-864.	Cl	2-cloro-4-metilfenila
A-865.	Cl	2-cloro-6-metilfenila
A-866.	Cl	5-cloro-2-metilfenila
A-867.	Cl	3-cloro-2-metilfenila
A-868.	Cl	2-cloro-4-metoxifenila
A-869.	Cl	2-cloro-6-metoxifenila
A-870.	Cl	2-cloro-4-trifluorometilfenila
A-871.	Cl	3-fluoro-4-metilfenila
A-872.	Cl	3-fluoro-4-isopropilfenila
A-873.	Cl	4-fluoro-3-metilfenila
A-874.	Cl	3-fluoro-4-metoxifenila
A-875.	Cl	3-fluoro-4-etoxifenila
A-876.	Cl	3-fluoro-4-trifluorometilfenila
A-877.	Cl	3-cloro-4-metilfenila
A-878.	Cl	3-cloro-4-metoxifenila
A-879.	Cl	3-cloro-4-etoxifenila
A-880.	Cl	3-cloro-4-trifluorometilfenila
A-881.	Cl	3-metil-4-metoxifenila
A-882.	Cl	4-cloro-2,5-difluorofenila
A-883.	Cl	4-terc-butila-2-fluorofenila
A-884.	Cl	2-fluoro-4-isopropilfenila
A-885.	Cl	4-etoxi-2-fluorofenila
A-886.	Cl	4-acetila-2-fluorofenila
A-887.	Cl	2-tienila
A-888.	Cl	5-metiltiofen-2-ila
A-889.	Cl	4-metiltiofen-2-ila
A-890.	Cl	5-clorotiofen-2-ila
A-891.	Cl	3-cianotiofen-2-ila
A-892.	Cl	5-formiltiofen-2-ila
A-893.	Cl	5-acetiltiofen-2-ila

No.	R ⁴	R ⁵
A-894.	Cl	5-(metoksiiminometil)tiofen-2-ila
A-895.	Cl	5-(1-(metoksiimino)etil)tiofen-2-ila
A-896.	Cl	4-bromotiofen-2-ila
A-897.	Cl	3,5-diclorotiofen-2-ila
A-898.	Cl	3-tienila
A-899.	Cl	2-metiltiofen-3-ila
A-900.	Cl	2,5-diclorotiofen-3-ila
A-901.	Cl	2,4,5-triclorotiofen-3-ila
A-902.	Cl	2-furila
A-903.	Cl	5-metilfuran-2-ila
A-904.	Cl	5-clorofuran-2-ila
A-905.	Cl	4-metilfuran-2-ila
A-906.	Cl	3-cianofuran-2-ila
A-907.	Cl	5-acetilfuran-2-ila
A-908.	Cl	3-furila
A-909.	Cl	2-metilfuran-3-ila
A-910.	Cl	2,5-dimetilfuran-3-ila
A-911.	Cl	2-piridila
A-912.	Cl	3-fluoropiridin-2-ila
A-913.	Cl	3-cloropiridin-2-ila
A-914.	Cl	3-bromopiridin-2-ila
A-915.	Cl	3-trifluorometilpiridin-2-ila
A-916.	Cl	3-metilpiridin-2-ila
A-917.	Cl	3-etilpiridin-2-ila
A-918.	Cl	3,5-difluoropiridin-2-ila
A-919.	Cl	3,5-dicloropiridin-2-ila
A-920.	Cl	3,5-dibromopiridin-2-ila
A-921.	Cl	3,5-dimetilpiridin-2-ila
A-922.	Cl	3-fluoro-5-trifluorometilpiridin-2-ila
A-923.	Cl	3-cloro-5-fluoropiridin-2-ila
A-924.	Cl	3-cloro-5-metilpiridin-2-ila
A-925.	Cl	3-fluoro-5-cloropiridin-2-ila
A-926.	Cl	3-fluoro-5-metilpiridin-2-ila
A-927.	Cl	3-metil-5-fluoropiridin-2-ila
A-928.	Cl	3-metil-5-cloropiridin-2-ila
A-929.	Cl	5-nitropiridin-2-ila
A-930.	Cl	5-cianopiridin-2-ila
A-931.	Cl	5-metoxycarbonilapiridin-2-ila
A-932.	Cl	5-trifluorometilpiridin-2-ila
A-933.	Cl	5-metilpiridin-2-ila
A-934.	Cl	4-metilpiridin-2-ila
A-935.	Cl	6-metilpiridin-2-ila
A-936.	Cl	3-piridila
A-937.	Cl	2-cloropiridin-3-ila
A-938.	Cl	2-bromopiridin-3-ila
A-939.	Cl	2-metilpiridin-3-ila
A-940.	Cl	2,4-dicloropiridin-3-ila
A-941.	Cl	2,4-dibromopiridin-3-ila
A-942.	Cl	2,4-difluoropiridin-3-ila
A-943.	Cl	2-fluoro-4-cloropiridin-3-ila
A-944.	Cl	2-cloro-4-fluoropiridin-3-ila
A-945.	Cl	2-cloro-4-metilpiridin-3-ila
A-946.	Cl	2-metil-4-fluoropiridin-3-ila

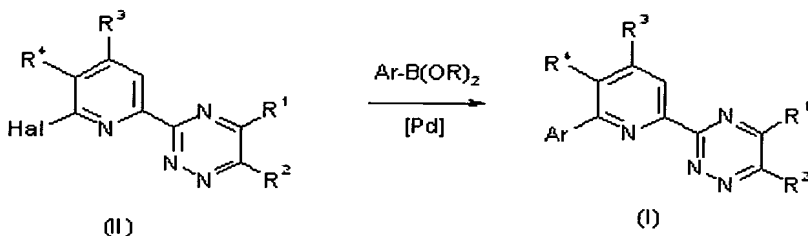
No.	R ⁴	R ⁵
A-947.	Cl	2-metil-4-cloropiridin-3-ila
A-948.	Cl	2,4-dimetilpiridin-3-ila
A-949.	Cl	2,4,6-tricloropiridin-3-ila
A-950.	Cl	2,4,6-tribromopiridin-3-ila
A-951.	Cl	2,4,6-trimetilpiridin-3-ila
A-952.	Cl	2,4-dicloro-6-metilpiridin-3-ila
A-953.	Cl	4-piridila
A-954.	Cl	3-cloropiridin-4-ila
A-955.	Cl	3-bromopiridin-4-ila
A-956.	Cl	3-metilpiridin-4-ila
A-957.	Cl	3,5-dicloropiridin-4-ila
A-958.	Cl	3,5-dibromopiridin-4-ila
A-959.	Cl	3,5-dimetilpiridin-4-ila
A-960.	Cl	4-pirimidinila
A-961.	Cl	5-cloropirimidin-4-ila
A-962.	Cl	5-fluoropirimidin-4-ila
A-963.	Cl	5-fluoro-6-cloropirimidin-4-ila
A-964.	Cl	2-metil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-965.	Cl	2,5-dimetil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-966.	Cl	5-metil-6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-967.	Cl	6-trifluorometilpirimidin-4-ila
A-968.	Cl	2-metil-5-fluoropirimidin-4-ila
A-969.	Cl	2-metil-5-cloropirimidin-4-ila
A-970.	Cl	5-cloro-6-metilpirimidin-4-ila
A-971.	Cl	5-cloro-6-etilpirimidin-4-ila
A-972.	Cl	5-cloro-6-isopropilpirimidin-4-ila
A-973.	Cl	5-bromo-6-metilpirimidin-4-ila
A-974.	Cl	5-fluoro-6-metilpirimidin-4-ila
A-975.	Cl	5-fluoro-6-fluorometilpirimidin-4-ila
A-976.	Cl	2,6-dimetil-5-cloropirimidin-4-ila
A-977.	Cl	5,6-dimetilpirimidin-4-ila
A-978.	Cl	2,5-dimetilpirimidin-4-ila
A-979.	Cl	2,5,6-trimetilpirimidin-4-ila
A-980.	Cl	5-metil-6-metoxipirimidin-4-ila
A-981.	Cl	5-pirimidinila
A-982.	Cl	4-metilpirimidin-5-ila
A-983.	Cl	4,6-dimetilpirimidin-5-ila
A-984.	Cl	2,4,6-trimetilpirimidin-5-ila
A-985.	Cl	4-trifluorometil-6-metilpirimidin-5-ila
A-986.	Cl	2-pirimidinila
A-987.	Cl	4,6-dimetilpirimidin-2-ila
A-988.	Cl	4,5,6-trimetilpirimidin-2-ila
A-989.	Cl	4,6-ditrifluorometilpirimidin-2-ila
A-990.	Cl	4,6-dimetil-5-cloropirimidin-2-ila

Os compostos de acordo com a presente invenção de fórmula geral I podem ser preparados analogamente à arte anterior citada no início, utilizando-se métodos padrão de síntese orgânica.

Os compostos de fórmula I, em que R⁵ é opcionalmente fenila ou heteroarila substituída podem ser preparados, por exemplo, de acordo com

o processo mostrado no Esquema 1:

Esquema 1:



No Esquema 1, R¹, R², R³ e R⁴ são como definidos acima. Ar é opcionalmente fenila substituída ou hetarila de 5 ou 6 membros
5 opcionalmente substituída. R é H ou C₁-C₄-alquila ou, junto com outras moléculas Ar-B(OU)₂, forma um anidrido fenilborônico. Hal é cloro, bromo ou iodo.

De acordo com o Esquema 1, a 2-(6-halopiridin-2-il)triazina de fórmula II é reagida com um derivativo do ácido (het)arilborônico de
10 fórmula geral Ar-B(OU)₂ sob as condições de um acoplamento Suzuki, i.e. na presença de um catalisador de paládio sob condições de reação por si conhecidas, como descrito, por exemplo, em Acc. Chem. Res. 15, pp. 178-184 (1982), Chem. Rev. 95, pp. 2457-2483 (1995), e na literatura citada ali, e
15 also em J. Org. Chem. 68, p. 9412 (2003). Catalisadores adequados são em particular tetrakis(trifenilfosfino)paládio(0), cloreto de bis(trifenilfosfino)-paládio(II), cloreto de bis(acetonitril)paládio(II), o complexo [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paládio(II) cloreto/diclorometano, bis[1,2-bis(difenilfosfino)etano]paládio(0) e cloreto de [1,4-bis(difenilfosfino)butano]paládio(II). A quantidade do catalisador é
20 usualmente de 0.1 a 10 % mol, com base no composto II. A relação molar do composto II para o derivativo do ácido (het)arilborônico é tipicamente na faixa de 1:2 a 2:1.

De uma maneira análoga à do Esquema 1, os compostos de fórmula I, em que R⁵ é alquila, cicloalquila, benzila ou heteroarilmetila
25 opcionalmente substituída, podem ser preparados via uma reação de

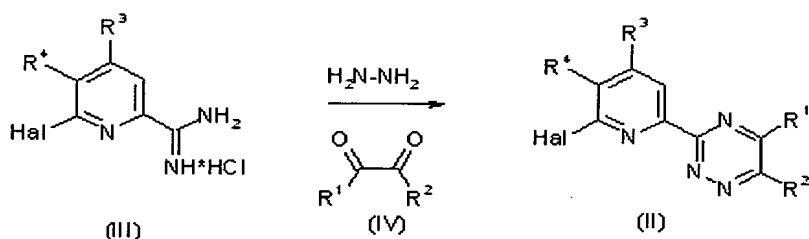
acoplamento catalisada por metal de transição, reagindo-se o composto II com um composto organometálico Met-R⁵, em que R⁵ é como definido acima e Met é um radical MgX, SnR³ ou ZnX (X = cloro, bromo ou iodo, R = alquila), por exemplo, no sentido de um acoplamento Stille ou acoplamento Kumada.

De uma maneira análoga à do Esquema 1, os compostos de fórmula I, em que R⁵ é alcóxi, haloalcóxi, cicloalcóxi, fenóxi ou heteroarilóxi opcionalmente substituídos podem ser preparados reagindo-se o composto II com o apropriado alcóxido OR⁵, em que R⁵ é como definido acima, no sentido de uma substituição nucleofílica.

Quanto a sua parte, as 3-(6-halopiridin-2-il)triazinas de fórmula II podem ser preparadas pelos métodos mostrados nos esquemas abaixo dos correspondentes compostos de amidina de fórmula III.

A preparação dos compostos II, em que R¹, R² independentemente entre si são alquila, haloalquila ou juntos com os átomos de carbono a que são ligados formam carbociclo ou um heterociclo saturado de acordo com a definição acima podem ser conseguida, por exemplo, de acordo com a síntese mostrada no Esquema 2.

Esquema 2:



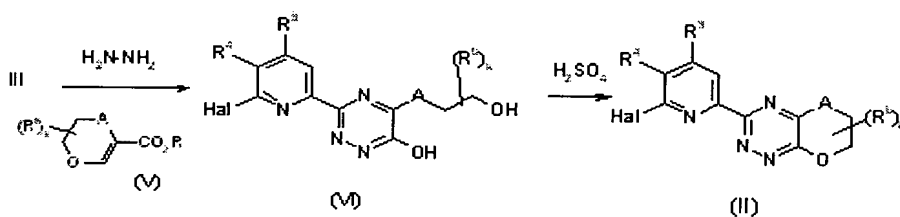
No Esquema 2, Hal, R³ e R⁴ são como definidos acima. R¹ e R² independentemente entre si são C₁-C₈-alquila, C₁-C₈-haloalquila ou juntos com os átomos de carbono a que são ligados formam um carbociclo ou um heterociclo saturado, por exemplo um dos ciclos Q-1, Q-4 ou Q-8 mencionados acima. De acordo com o Esquema 2, o composto de amidina de fórmula III é, sucessivamente ou em uma reação de um pote, reagido com

hidrazina e o composto IV, fornecendo o composto de fórmula II. Em geral, a reação com a hidrazina, que é tipicamente empregada como hidrato de hidrazina, é realizada primeiro. Esta é seguida pela adição do composto IV. Se apropriado, a temperatura é aumentada para trazer a reação ao término.

5 Os compostos de fórmula IV são conhecidos ou podem ser preparados por processos padrão, por exemplo, de acordo com EP 267 378, Tetrahedron Letters, 2003, p. 2307, Tetrahedron Letters, 1992, p. 8131, Tetrahedron Letters, 1987, p. 551, J. Molec. Catalysis 208 (1-2), 2004, pp. 135-145. 3,4-Dioxaxolano pode ser preparado, por exemplo, oxidando-se o
 10 3,4-bisidroxioxolano com N-bromossuccinimida e tetracloreto de carbono em piridina (vide Tetrahedron Letters, 44 (2003) p. 4909) ou com ácido o-iodosobenzóico em sulfóxido de dimetila (vide Tetrahedron Letters, 35 (1994) S. 8019). Os compostos de amidina III são igualmente conhecidos ou podem ser preparados, analogamente aos métodos descritos em US 2003/0087940 A1
 15 e Bioorg. Med. Chem. Lett. 1571-1574 (2003).

De uma maneira análoga ao Esquema II, os compostos de fórmula II, em que R¹ e R² juntos com os átomos de carbono a que são ligados são um radical Q-2 ou Q-3, podem ser preparados pela rota de síntese mostrada nos Esquemas 3 e 4:

20 Esquema 3:



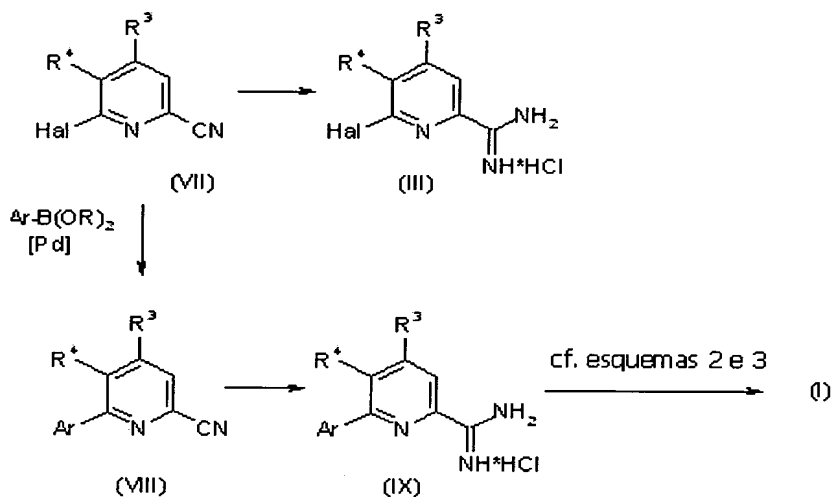
No Esquema 3, Hal, k, R^b, R³ e R⁴ são como definidos acima. A é CH₂ ou uma ligação química. R é C₁-C₄-alquila, em particular metila ou etila. De acordo com o esquema 3, o composto de amidina III é reagido sucessivamente com hidrazina e o éster de fórmula V. Com respeito às
 25 condições de reação, o que foi citado acima para o Esquema 2 aplica-se

analogamente. O composto bisidróxi de fórmula VI, obtido desta maneira, é então submetido a uma desidratação ciclizante, por exemplo, por tratamento com ácido sulfúrico. Os ésteres de fórmula V são conhecidos o podem ser preparados analogamente aos processos conhecidos pela literatura (vide J. Heterocicl. Chem., 32 (1995) p. 735 e Liebigs Ann. Chem. 1974, pp. 468-476).

Quanto a sua parte, os compostos de fórmula geral III podem ser preparados dos correspondentes compostos de 2-cianopiridina de forma de realização VII (vide Esquema 4). Para este fim, o composto de 2-cianopiridina VIII é, utilizando-se o método descrito em US 4.873.248, convertido por sucessivo tratamento com alcóxido de metal alcalino, tais como metóxido ou etóxido de sódio, e subsequente reação com cloreto de amônio, no composto III. Em vez dos cloridretos, é também possível utilizarem-se os hidrobrometos, acetatos, sulfatos ou formiatos nas subseqüentes etapas mostradas nos Esquemas 1 a 3. As cianopiridinas de fórmula VII são conhecidas, por exemplo, pelas US 2003/087940, WO 2004/026305, WO 01/057046 e Bioorg. Med. Chem. Lett. pp. 1571-1574 (2003), ou podem ser preparadas por processos de preparação conhecidos.

De acordo com uma segunda rota de síntese (vide Esquema 4), os compostos de acordo com a presente invenção, em que R^5 é um radical Ar como definido no Esquema 1, podem ser preparados das cianopiridinas VII. Para este fim, o composto VII é inicialmente acoplado com o composto do ácido (het)arilborônico $Ar-B(OH)_2$, como descrito para o Esquema 1, e a resultante 6-(het)aril-2-cianopiridina é convertida sob as condições de reação descritas para os compostos VII no composto de amidina IX. O composto IX pode então ser convertido sob as condições mencionadas para os Esquemas 2 e 3 no correspondente composto de triazina.

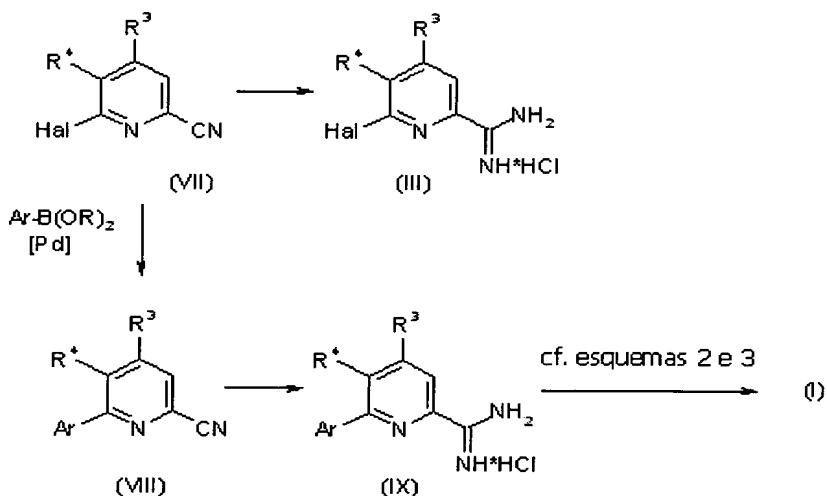
Esquema 4:



Além disso, os compostos de fórmula VIIIa, em que R^5 tem um dos significados mencionados acima, em particular um significado diferente de Ar, são conhecidos. Empregando-se métodos análogos aos Esquemas 2 a 4, os compostos VIIIa podem ser convertidos nos correspondentes compostos I de acordo com a presente invenção:

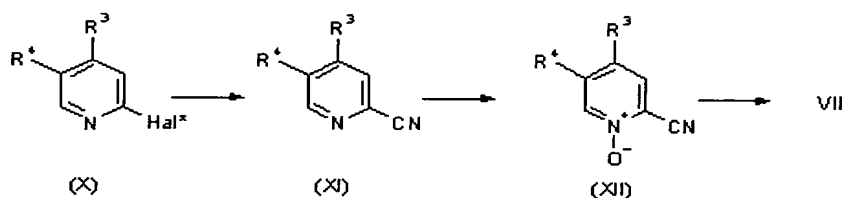
5

Esquema 4a:



Os compostos de fórmula geral VII podem, se já não forem conhecidos, ser preparados em particular pelo processo mostrado no Esquema 5.

Esquema 5:



No Esquema 5, R³ e R⁴ são como definidos acima, Hal* é cloro, bromo ou iodo.

A conversão da 2-halopiridina X na 2-cianopiridina XI é realizada usando-se métodos padrão de química orgânica, reagindo-se X com íons cianeto, por exemplo, com cianeto de potássio (vide EP-A97460, exemplo de preparação 1), cianeto de cobre(I) (vide EP-A 34917, exemplo de preparação 3) ou cianeto de trimetilsilila. O composto XI, obtido desta maneira, é então convertido por tratamento com um perácido usando-se métodos por si conhecidos no N-óxido piridina XII. A conversão de XI em XII pode ser realizada analogamente aos processos conhecidos, por exemplo, tratando-se XI com peróxido de hidrogênio em um ácido orgânico, tal como ácido fórmico, ácido acético, ácido cloroacético ou ácido trifluoroacético (vide, por exemplo, J. Org. Chem. 55, pp. 738-741 (1990) e Organic Synthesis, Collect. Vol. IV, pp. 655-656 (1963)) ou reagindo-se XI com um perácido orgânico, tal como ácido meta-cloroperbenzóico, em um solvente inerte, por exemplo um hidrocarboneto halogenado, tal como diclorometano ou dicloroetano (vide, por exemplo, Synthetic Commun. 22(18), p. 2645, (1992); J. Med. Chem. 2146 (1998)). A conversão de XI em XII pode também ser realizada analogamente ao método descrito por K. B. Sharpless (J. Org. Chem. 63(5), p. 7740 (1998)), reagindo-se XI em um hidrocarboneto halogenado, tal como diclorometano ou dicloroetano, na presença de quantidades catalíticas (por exemplo, 5 % em peso) de compostos de rênio (VII), tais como metiltrioxorrênio (H₃CrO₃), com peróxido de hidrogênio.

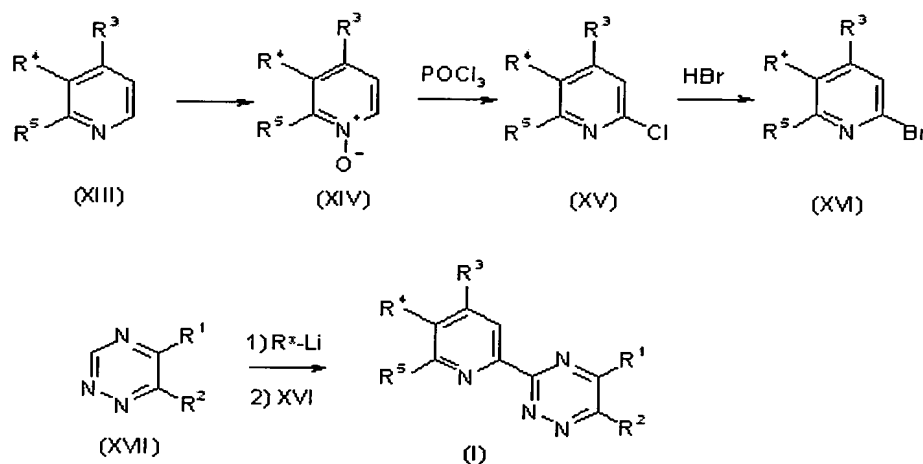
XII é então reagido com um agente halogenante, tal como POCl₃ ou POBR³, que produz o correspondente composto VII. No caso da

conversão de XII em VII, o agente halogenante é geralmente empregado em excesso, com base na estequiometria da reação. A reação pode ser realizada em um solvente orgânico inerte e é frequentemente realizada na ausência de um solvente, o agente halogenante então geralmente atuando como solvente.

- 5 A temperatura de reação é usualmente na faixa de 20 °C ao ponto de ebulição do agente halogenante. Se apropriado, é vantajoso inicialmente introduzir um átomo de cloro na posição-2 do N-óxido de piridina, usando-se um agente clorante, tal como POCl₃, e então realizar uma troca de halogênio, por exemplo, por tratamento com HBr ou um agente iodante, fornecendo um
- 10 composto de fórmula VII em que Hal = Br ou I.

Os compostos I de acordo com a presente invenção podem, além disso, ser preparados de acordo com a síntese mostrada no Esquema 6:

Esquema 6:



No Esquema 6, R¹, R², R³, R⁴ e R⁵ são como definidos acima.

- 15 R^x é, por exemplo, C₁₋₆ alquila, especialmente n-butila ou fenila.

De acordo com o Esquema 6, em uma primeira etapa o composto de piridina XIII é, de acordo com métodos padrão de química orgânica, convertido no correspondente N-óxido XIV. Os métodos mencionados no Esquema 5, para a conversão do composto XI no composto

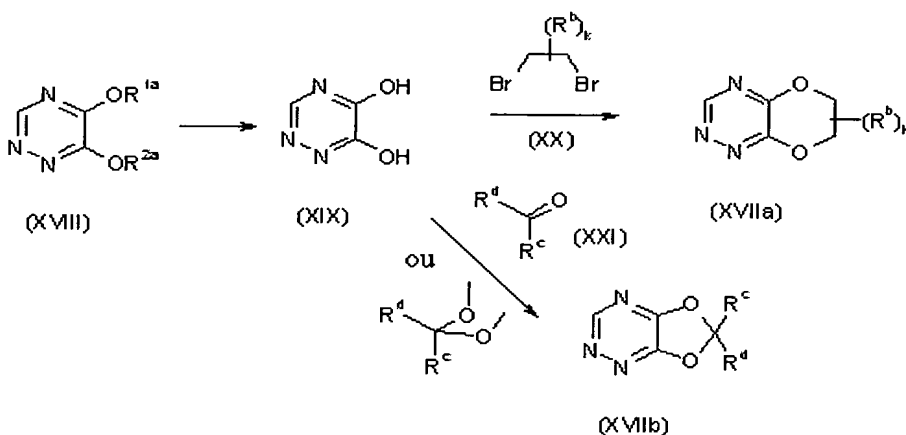
20 XII, podem ser aplicados correspondentemente. Por reação com um agente clorante, tal como POCl₃, o N-óxido XIV é então convertido na

correspondente 2-cloropiridina XV. Os métodos mostrados no Esquema 5, para a conversão do composto XII no composto VII, podem ser aplicados correspondentemente. Isto é então seguido por uma troca de cloro-bromo de acordo com os métodos padrão de química orgânica, por exemplo, tratando-se a cloropiridina XV com HBr analogamente ao método mencionado na US 5.271.217 e Can. J. Chem. 75 (2) (1997) p. 169.

A bromopiridina obtida desta maneira é então acoplada com o composto de triazina XVII. Para este fim, o composto de triazina de fórmula XVII é, por tratamento com uma base de lítio, em particular um composto de C₁₋₆-alquilítio, tal como n-butilítio ou fenilítio, convertida no correspondente composto de lítio-triazina, que é então reagido com o composto de bromopiridina XVI. A reação de XVI com o composto litiado XVII pode ser realizada analogamente ao método descrito em Tetrahedron Lett. 41(10) (2000) p. 1653.

Os compostos de triazina XVII são conhecidos ou podem ser preparados analogamente aos métodos conhecidos para preparar compostos de triazina. Os compostos de triazina XVII, em que R¹ e R² são radicais ligados via oxigênio, podem ser preparados de 5,6-dialcóxi-1,2,4-triazinas, tais como 5,6-dimetóxi-1,2,4-triazina (vide Chem. Ber. 109 (1976), p.1113):

Esquema 7:



No Esquema 7, R^b e k são como definidos acima. R^{1a} e R^{1b} são

C₁-C₆-alquila, em particular metila. R^c e R^d independentemente entre si são hidrogênio ou C₁-C₄-alquila. A conversão de XVIII na 5,6-bisidróxi-1,2,4-triazina pode ser realizada analogamente ao método descrito em Chem. Ber. 109 (1976), p.1113. A bisidroxitriazina XIX, obtida desta maneira, pode então ser reagida com um 1,2-dibromoalcano XX, preferivelmente na presença de uma base, tal como um hidróxido de metal alcalino ou alcóxido de metal alcalino, analogamente ao método descrito em Heterocicl. Chem. 27 (1990) p. 151, que fornece a triazina XVIIa condensada. Além disso, a bisidroxitriazina XIX pode, analogamente ao método descrito em Chem. Berichte 124(3) (1991) p. 481, J. Chem. Socl., Perkin Trans 1, 1998, p. 3561; Synthesis (1986), p. 122, ser reagida com uma cetona ou um aldeído XXI, que fornece a triazina condensada XVIIb.

As misturas de reação, obtidas pelos processos mostrados nos Esquemas 1 a 7 são elaboradas de uma maneira costumeira, por exemplo, misturando-se com água, separando-se as fases e, se apropriado, purificação cromatográfica dos produtos brutos. Alguns dos intermediários e produtos finais são obtidos na forma de óleos viscosos incolores ou ligeiramente amarronzados, que são purificados ou liberados dos componentes voláteis sob pressão reduzida e em temperatura moderadamente elevada. Se os intermediários e produtos finais forem obtidos como sólidos, a purificação pode também ser realizada por recristalização ou digestão.

Se compostos individuais I não podem ser obtidos pelas rotas descritas acima, eles podem ser preparados por derivatização de outros compostos I.

Se a síntese produzir misturas de isômeros, uma separação é geralmente, entretanto, não necessariamente requerida, uma vez que em alguns casos os isômeros individuais podem ser interconvertidos durante elaboração para uso ou durante aplicação (por exemplo, sob a ação da luz, ácidos ou bases). Tais conversões podem também ocorrer após uso, por

exemplo, no caso de tratamento de plantas, na planta tratada ou no fungo nocivo a ser controlado.

Os compostos de fórmula I são adequados como fungicidas. Eles são distinguidos pela excelente atividade contra um largo espectro de fungos fitopatogênicos das classes dos Ascomycetes, Deuteromycetes, Oomycetes e Basidiomycetes, em particular da classe dos Oomycetes. Alguns deles são sistemicamente ativos e podem ser usados em proteção de colheita como fungicidas foliares, como fungicidas para revestimento de semente e como fungicidas de solo.

10 Eles são particularmente importantes no controle de um grande número de fungos em várias plantas de colheita, tais como trigo, centeio, cevada, aveias, arroz, milho, grama, bananas, algodão, soja, café, cana de açúcar, videiras, plantas frutíferas e ornamentais e hortaliças e leguminosas, tais como pepinos, feijões, tomates, batatas e cucúrbitas e também nas sementes destas plantas.

Elas são especialmente adequadas para controlar as seguintes doenças de plantas:

- *Alternaria species* em hortaliças e leguminosas, colza de semente oleaginosa, beterraba, frutas, arroz, soja e também batatas (por exemplo, *A. solani* ou *A. alternata*) e tomates (por exemplo, *A. solani* ou *A. alternata*) e *Alternaria ssp.* (cabeça negra) em trigo,

- *Alphanomyces species* em beterraba e hortaliças e legumes,
 - *Ascochita species* em cereais e hortaliças e legumes, por exemplo, *Ascochita tritici* (mancha de folha) em trigo,

25 - *Bipolaris* e *Drechslera species* on milho, cereais, arroz e gramado (por exemplo *D. maydis* em milho, *D. teres* em cevada, *D. tritici-repentis* em trigo),

- *Blumeria graminis* (míldio pulverulento) em cereais (por exemplo trigo ou cevada),

- *Botrytis cinerea* (mofo cinza) em morangos, hortaliças e legumes, flores, videiras e trigo,
- *Bremia lactucae* em alface,
- *Cercospora species* em milho, soja, arroz e beterraba, por exemplo, *Cercospora sojina* (pústula da folha) ou *Cercospora kikuchii* (pústula da folha) em soja,
- *Cladosporium herbarum* (mofo negro) em trigo,
- *Cochliobolus species* em milho, cereais e arroz (por exemplo *Cochliobolus sativus* em cereais e *Cochliobolus miyabeanus* em arroz),
- *Colletotricum species* em soja, algodão e outras plantas (por exemplo *C. acutatum* em várias plantas e, por exemplo, *Colletotrichum truncatum* (antracnose) em soja),
- *Corynespora cassiicola* (pústula da folha) em soja,
- *Dematofora necatrix* (podridão do caule/raiz) em soja,
- *Diaporthe faseolorum* (doença do caule) em soja,
- *Drechslera species*, *Pirenofora species* em milho, cereais, arroz e gramado, em cevada (por exemplo *D. teres*) e em trigo (por exemplo *D. tritici-repentis*),
- Esca em videiras, causada por *Phaeoacremonium chlamydosporium*, *Ph. Aleophilum*, e *Formitipora punctata* (syn. *Fellinus punctatus*),
- *Elsinoe ampelina* em videiras,
- *Epicoccum spp.* (cabeça negra) em trigo,
- *Exserohilum species* em milho,
- *Erysife cichoracearum* e *Sphaerotheca fuliginea* em pepinos,
- *Fusarium* e *Verticillium species* (por exemplo *V. dahliae*) em várias plantas: por exemplo *F. graminearum* ou *F. culmorum* (podridão da raiz) em cereais (por exemplo trigo ou cevada) ou, por exemplo, *F. oxysporum* em tomates e *Fusarium solani* (doença do caule) em soja,

- *Gaeumanomyces graminis* em cereais (por exemplo trigo ou cevada),
- *Gibberella species* em cereais e arroz (por exemplo *Gibberella fujikuroi* em arroz),
- 5 - *Glomerella cingulata* em videiras e outras plantas,
- Complexo de mancha de grãos em arroz,
- *Guignardia budwelli* em videiras,
- *Helminthosporium species* (por exemplo *H. graminicola*) em milho e arroz,
- 10 - *Isariopsis clavispora* em videiras,
- *Macrophomina phaseolina* (podridão da raiz/caule) em soja,
- *Microdochium nivale* em cereais (por exemplo trigo ou cevada),
- *Microsphaera diffusa* (míldio pulverulento) em soja,
- 15 - *Mycosphaerella species* em cereais, bananas e amendoins (*M. graminicola* em trigo, *M. fijiensis* em bananas),
- *Peronospora species* em repolho (por exemplo *P. brassicae*), plantas bulbosas (por exemplo *P. destructor*) e, por exemplo, *Peronospora manshurica* (míldio penujento) em soja,
- 20 - *Phakopsara pachirhizi* e *Phakopsara meibomiae* em soja,
- *Phialofora gregata* (doença do caule) em soja,
- *Phomopsis species* em soja, girassóis e videiras (*P. viticola* em videiras, *P. heliantii* em girassóis),
- *Phitophthora species* em várias plantas, por exemplo *P. capsici* em pimentas sino, *Phitophthora megasperma* (podridão de folha/caule) em soja, *Phitophthora infestans* em batatas e tomates,
- 25 - *Plasmopara viticola* em videiras,
- *Podosphaera leucotricha* em maçãs,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* em cereais,

- *Pseudoperonospora* species em lúpulos e pepinos (por exemplo *P. cubensis* em pepinos ou *P. humilii* em lúpulos),
- *Pseudopezicula tracheiphilae* em videiras,
- *Puccinia* species em várias plantas, por exemplo *P. triticina*,
- 5 *P. striiformans*, *P. hordei* ou *P. graminis* em cereais (por exemplo trigo ou cevada) ou em aspargos (por exemplo *P. asparagi*),
- *Pirenofora* species em cereais,
- *Piricularia oryzae*, *Corticium sasakii*, *Sarocladium oryzae*, *S. attenuatum*, *Entyloma oryzae* em arroz,
- 10 - *Piricularia grisea* em gramado e cereais,
- *Pitium* spp. em gramado, arroz, milho, algodão, colza de semente oleaginosa, girassóis, beterraba, hortaliças e legumes e outras plantas (por exemplo *P. ultimum* ou *P. aphanidermatum*),
- *Ramularia collo-cygni* (manchas de folha fisiológicas) em
- 15 cevada,
- *Rhizoctonia* species (por exemplo *R. solani*) em algodão, arroz, batatas, gramado, milho, colza de semente oleaginosa, beterraba, hortaliças e legumes e em outras plantas, por exemplo *Rhizoctonia solani* (podridão da raiz/caule) em soja ou *Rhizoctonia cerealis* (mancha amarela)
- 20 em trigo ou cevada,
- *Rhynchosporium secalis* em cevada (queimadura), centeio e triticale,
- *Sclerotinia* species em colza de semente oleaginosa, girassóis e outras plantas, por exemplo, *Sclerotinia sclerotiorum* (doença do caule) ou
- 25 *Sclerotinia rolfsii* (doença do caule) em soja,
- *Septoria glycinas* (mancha marrom) em soja,
- *Septoria tritici* e *Stagonospora nodorum* em trigo,
- *Erysife* (syn. *Uncinula necator*) em videiras,
- *Setospaeria* species em milho e gramado,

- *Sphacelotheca reilina* em milho,
- *Stagonospora nodorum* (pústula da gluma) em trigo,
- *Tievaliopsis species* em soja e algodão,
- *Tilaletia species* em cereais,
- 5 - *Typhula incarnata* (mofo de neve) em trigo ou cevada,
- *Ustilago species* em cereais, milho e beterraba,
- *Venturia species* (sarna) em maçãs e peras (por exemplo *V. inaequalis* em maçãs).

Os compostos de fórmula I são, além disso, adequados para combater fungos nocivos na proteção de materiais (por exemplo, madeira, papel, dispersões de tinta, fibras ou tecidos) e na proteção de produtos armazenados. Na produção de madeira, particular atenção é dada aos seguintes fungos nocivos:

Ascomicetos, tais como *Ofiostoma* spp., *Ceratocistis* spp., *Aureobasidium pullulans*, *Sclerofoma* spp., *Chaetomium* spp., *Humicola* spp., *Petriella* spp., *Trichurus* spp.; Basidiomicetos, tais como *Coniofora* spp., *Coriolus* spp., *Gloeofilalum* spp., *Lentinus* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp. e *Tiromyces* spp., Deuteromicetos, tais como *Aspergilalus* spp., *Cladosporium* spp., *Penicilalium* spp., *Trichoderma* spp., *Alternaria* spp., *Paecilaomyces* spp. e Zigomicetos, tais como *Mucor* spp., adicionalmente na proteção de materiais as seguintes leveduras: *Candida* spp. e *Saccharomyces cerevisiae*.

Os compostos de fórmula I são empregados tratando-se os fungos ou as plantas, sementes, materiais ou solo a serem protegidos do ataque fúngico com uma quantidade fungicidamente eficaz dos compostos ativos. A aplicação pode ser realizada tanto antes como após a infecção dos materiais, plantas ou sementes pelos fungos.

Os agentes fungicidas geralmente compreendem entre 0,1 e 95%, preferivelmente entre 0,5 e 90% em peso do composto ativo.

Quando empregadas nas proteção de plantas, as quantidades aplicadas são, dependendo da espécie do efeito desejado, entre 0,01 e 2,0 kg de composto ativo por ha.

5 Em tratamento de semente, quantidades de composto ativo de 1 a 1000 g/100 kg, preferivelmente de 5 a 100 g/100 kg de semente são geralmente necessários.

10 Quando usados na proteção de materiais ou produtos armazenados, a quantidade do composto ativo aplicada depende da espécie de área de aplicação e do efeito desejado. Quantidades costumeiramente aplicadas na proteção de materiais são, por exemplo, 0,001 g a 2 kg, preferivelmente 0,005 g a 1 kg de composto ativo por metro cúbico de material tratado.

15 Os compostos de fórmula I podem estar presentes em diferentes modificações de cristal, que podem diferir em sua atividade biológica. Eles também fazem parte do assunto da presente invenção.

20 Os compostos de fórmula I podem ser convertidos nas formulações costumeiras, por exemplo, soluções, emulsões, suspensões, polvilhos, pós, pastas e grânulos. A forma de uso depende da finalidade pretendida particular; em cada caso, ela deve assegurar uma fina e uniforme distribuição do composto de acordo com a presente invenção.

As formulações são preparadas de uma maneira conhecida, por exemplo, estendendo-se o composto ativo com solventes e/ou veículos, se desejado, utilizando-se emulsificantes e dispersantes. Solventes/auxiliares adequados para esta finalidade são essencialmente:

25 - água, solventes aromáticos (por exemplo, produtos Solvesso, xileno), parafinas (por exemplo, frações de óleo mineral), álcoois (por exemplo, metanol, butanol, pentanol, benzil álcool), cetonas (por exemplo ciclohexanona, gama-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (glicol diacetato), glicóis, dimetilamidas do ácido graxo, ácidos

graxos e ésteres de ácido graxo. Em princípio, as misturas de solventes podem também ser usadas.

5 - veículos tais como minerais naturais moídos (por exemplo, caulins, argilas, talco, giz) e minerais sintéticos moídos (por exemplo, sílica, silicatos altamente dispersos); emulsificantes tais como emulsificantes não-ionogênicos e aniônicos (por exemplo, éteres de álcool graxo de polioxietileno, alquilsulfonatos e arilsulfonatos) e dispersantes tais como licores de refugo de lignossulfito e metilcelulose.

10 Tensoativos adequados usados são metal alcalino, metal alcalino terroso e sais de amônio de ácido lignossulfônico, ácido naftalenossulfônico, ácido fenolsulfônico, ácido dibutilnaftalenossulfônico, alquilarilsulfonatos, alquil sulfatos, alquilsufonatos, sulfatos de álcool graxo, ácidos graxos e glicol éteres de álcool graxo sulfatados, além disso, condensados de naftaleno e derivados de naftaleno sulfonados com
15 formaldeído, condensados naftaleno ou de ácido naftalenossulfônico com fenol e formaldeído, polioxietileno octilfenil éter, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenil poliglicol éteres, tributilfenil poliglicol éter, triestearilfenil poliglicoléter, alquilaril poliéter álcoois, condensados de álcool e óxido de etileno de álcool graxo, óleo de rícino etoxilado, alquil éteres de
20 polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, lauril álcool poliglicol éter acetal, sorbitol ésteres, licores de refugo de lignossulfito e metilcelulose.

25 Tensoativos adequados usados são metal alcalino, metal alcalino terroso e sais de amônio do ácido lignossulfônico, ácido naftalenossulfônico, ácido fenolsulfônico, ácido dibutilnaftalenossulfônico, alquilarilsulfonatos, alquil sulfatos, alquilsulfonatos, sulfatos de álcool graxo, ácidos graxos e glicol éteres de álcool graxo sulfatados, além disso condensados de naftaleno e derivados de naftaleno sulfonados com formaldeído, condensados de naftaleno ou de ácido naftalenossulfônico com fenol e formaldeído, polioxietileno octilfenil éter, isooctilfenol etoxilado,

octilfenol, nonilfenol, alquifenil poliglicol éteres, tributilfenil poliglicol éter, triestearilfenil poliglicol éter, alquilaril poliéter álcoois, condensados de óxido de etileno de álcool e de álcool graxo, óleo de rícino etoxilado, polioxietileno alquil éteres, polioxipropileno etoxilado, lauril álcool poliglicol éter acetal, sorbitol ésteres, licores de refugio de lignossulfito e metilcelulose.

Substâncias que são adequadas para a preparação de soluções, emulsões, pastas ou dispersões oleosas diretamente pulverizáveis, são frações de óleo mineral de ponto de ebulição de médio a elevado, tais como querosene ou óleo diesel, além disso, óleos de coaltar e óleos de origem vegetal ou animal, hidrocarbonetos cíclicos e aromáticos, por exemplo, tolueno, xileno, parafina, tetraidronaftaleno, naftalenos alquilados ou seus derivativos, metanol, etanol, propanol, butanol, cicloexanol, cicloexanona, isoforona, solventes altamente polares, por exemplo, dimetil sulfóxido, N-metil-pirrolidona e água.

Pós, materiais para produtos espalháveis e empoáveis podem ser preparados misturando-se ou concomitantemente moendo-se as substâncias ativas com um veículo sólido.

Grânulos, por exemplo, grânulos revestidos, grânulos impregnados e grânulos homogêneos, podem ser preparados ligando-se os compostos ativos em veículos sólidos. Exemplos de veículos sólidos são terras minerais tais como géis de sílica, silicatos, talco, caulim, attaclay, calcário, cal, giz, argila aluminosa ou ferruginosa, loess, argila, dolomita, terra diatomácea, sulfato de cálcio, sulfato de magnésio, óxido de magnésio, materiais sintéticos moídos, fertilizantes, tais como, por exemplo, sulfato de amônio, fosfato de amônio, nitrato de amônio, uréias e produtos de origem vegetal, tais como farinha de cereal, farinha de casca de árvore, serragem e farinha de casca de noz, pós de celulose e outros veículos sólidos.

Em geral, as formulações compreendem de 0,01 a 95 % em peso, preferivelmente de 0,1 a 90 % em peso do composto ativo. Os

compostos ativos são empregados em uma pureza de 90% a 100%, preferivelmente 95% a 100% (de acordo com o espectro NMR).

Os seguintes são exemplos de formulações:

1. Produtos para diluição com água

5 A Concentrados solúveis em água (SL, LS)

10 partes em peso dos compostos ativos são dissolvidas em 90 partes em peso de água ou em um solvente solúvel em água. Como alternativa, umectantes ou outros auxiliares são adicionados. O composto ativo dissolve-se na diluição com água. Desta maneira, uma formulação tendo um teor de 10 % em peso de composto ativo é obtida.

B Concentrados dispersáveis (DC)

15 20 partes em peso dos compostos ativos são dissolvidas em 70 partes em peso de ciclohexanona com adição de 10 partes em peso de um dispersante, por exemplo, polivinilpirrolidona. Diluição com água fornece uma dispersão. O teor de composto ativo é 20 % em peso.

C Concentrados emulsificáveis (EC)

20 15 partes em peso dos compostos ativos são dissolvidas em 75 partes em peso de xileno com adição de dodecilbenzenossulfonato de cálcio etoxilato de óleo de rícino (em cada caso 5 partes em peso). A diluição com água fornece uma emulsão. A formulação tem um teor de composto ativo de 15 % em peso.

D Emulsões (EW, EO, ES)

25 25 partes em peso dos compostos ativos são dissolvidas em 35 partes em peso de xileno com adição de dodecilbenzenossulfonato de cálcio e etoxilato de óleo de rícino (em cada caso 5 partes em peso). Esta mistura é introduzida em 30 partes em peso de água por meio de uma máquina de emulsificação (p. ex., Ultraturax) e transformada em uma emulsão homogênea. Diluição com água fornece uma emulsão. A formulação tem um teor de composto ativo de 25 % em peso.

E Suspensões (SC, OD, FS)

Em um moinho de bolas agitado, 20 partes em peso dos compostos ativos são cominuídas com adição de 10 partes em peso de dispersantes e umectantes e 70 partes em peso de água ou um solvente orgânico, para fornecer uma suspensão de composto ativo fina. Diluição com água fornece uma suspensão estável do composto ativo. O teor do composto ativo na formulação é de 20 % em peso.

F Grânulos dispersáveis em água e grânulos solúveis em água (WG, SG)

50 partes em peso dos compostos ativos são moídas finamente com adição de 50 partes em peso de dispersantes e umectantes e preparadas como grânulos dispersáveis em água ou solúveis em água, po meio de utensílios técnicos (por exemplo, extrusão, torre de pulverização, leito fluidizado). Diluição com água fornece uma dispersão ou solução estável do composto ativo. A formulação tem um teor de composto ativo de 50 % em peso.

G Pós dispersáveis em água e pós solúveis em água (WP, SP, SS, WS)

75 partes em peso dos compostos ativos são moídas em um moinho estator-rotor com adição de 25 partes em peso de dispersantes, umectantes e gel de sílica. A diluição com água fornece uma dispersão ou solução estável do composto ativo. O teor de composto ativo da formulação é de 75 % em peso.

H Formulações de Gel

Em um moinho de bolas, 20 partes em peso dos compostos ativos, 10 partes em peso do dispersante, 1 partes em peso do agente gelante e 70 partes em peso de água ou um solvente orgânico. são moídas para fornecer uma fina suspensão. Na diluição com água, uma suspensão estável, tendo um teor de composto ativo de 20 % em peso, é obtida.

2. Produtos a serem aplicados não diluídos

I Pós empoáveis (DP, DS)

5 partes em peso dos compostos ativos são moídas finamente e misturadas intimamente com 95 partes em peso de caulim finamente dividido. Isto fornece um produto empoável tendo um teor de composto ativo de 5 % em peso.

5 J Grânulos (GR, FG, GG, MG)

0,5 partes em peso dos compostos ativos são moídos finamente e associadas com 99,5 partes em peso de veículos. Os métodos atuais são extrusão, secagem por pulverização ou leiteo fluidizado. Isto fornece grânulos a serem aplicados indiluídos tendo um teor de composto ativo de 0,5 % em peso.

10

K Soluções ULV (UL)

10 partes em peso dos compostos ativos são dissolvidas e, 90 partes em peso de um solvente orgânico, por exemplo, xileno. Isto fornece um produto a ser aplicado indiluído, tendo um teor de composto ativo de 10 % em peso.

15

Para tratamento de semente, é usualmente feito uso de concentrados solúveis em água (LS), suspensões (FS), pós empoáveis (DS), pós dispersáveis em água e solúveis em água (WS, SS), emulsões (ES), concentrados emulsificáveis (EC) e formulações em gel (GF). Estas formulações podem ser aplicadas à semente em forma indiluída ou, preferivelmente, diluída. A aplicação pode ser realizada antes da semeadura.

20

Os compostos ativos podem ser usados como tais, na forma de suas formulações ou nas formas de uso preparadas deles, por exemplo, na forma de soluções, pós, suspensões ou dispersões diretamente pulverizáveis, dispersões oleosas, pastas, produtos empoáveis, materiais para espalhamento, ou grânulos, por meio de pulverização, atomização, polvilhamento, espalhamento ou verteeção. As formas de uso dependem inteiramente das finalidades pretendidas; elas são destinadas a assegurar em cada caso a mais fina possível distribuição dos compostos ativos de acordo com a presente

25

invenção.

As formas de uso aquosas podem ser preparadas de concentrados de emulsão, pastas ou pós umectáveis (pós umectáveis, dispersões oleosas) por adição de água. Para preparar as emulsões, 5 pastas ou dispersões oleosas, as substâncias como tais ou dissolvidas em um óleo ou solvente, podem ser homogeneizadas em água por meio de um umidificador, agente de pegajosidade, dispersante ou emulsificante. Entretanto, é também possível prepararem-se concentrados compostos de substância ativa, umectante, agente de pegajosidade, dispersante ou 10 emulsificante, se apropriado, solvente ou óleo e tais concentrados são adequados para diluição com água.

As concentrações do composto ativo nas preparações prontas para uso podem ser variadas dentro de faixas relativamente grandes. Em geral, elas são entre 0,0001 e 10%, preferivelmente entre 0,01 e 1%.

15 Os compostos ativos podem também ser usados com grande sucesso no processo de volume ultra-baixo (ULV), sendo possível aplicarem-se formulações com mais do que 95 % em peso do composto ativo ou mesmo aplicar o composto ativo sem aditivos.

20 Óleos de vários tipos, agentes umectantes, adjuvantes, herbicidas, fungicidas, outros pesticidas ou bactericidas podem ser adicionados aos compostos ativos, mesmo, se apropriado, não até imediatamente antes do uso (tanque de mistura). Estes agentes podem ser misturados com as composições de acordo com a presente invenção em um relação em peso de 1 : 100 a 100 : 1, preferivelmente de 1 : 10 a 10 : 1.

25 Adjuvantes adequados neste sentido são em particular: polissiloxanos organicamente modificados, por exemplo, Break Thru S 240®, alcoxiltosde álcool, por exemplo, Atplus 245®, Atplus MBA 103®, Plurafac LF 300® e Lutensol ON 30®; copolímeros em bloco EO/PO, por exemplo, Pluronic RPE 2035® e Genapol B®; etoxiltosde álcool, por exemplo,

Lutensol XP 80®; edioctilsulfossuccinato de sódio, por exemplo, Leofen RA®.

Os agentes de acordo com a presente invenção podem, na forma de uso como fungicidas, também estar presentes junto com outros compostos ativos, por exemplo, com herbicidas, inseticidas, reguladores do crescimento, fungicidas ou também com fertilizantes. Misturando-se os compostos I ou as composições compreendendo-os na forma de uso como fungicidas com outros fungicidas, em muitos casos um alargamento do espectro da atividade fungicida é conseguido.

A seguinte lista de fungicidas, com que os compostos de acordo com a presente invenção podem ser usados em conjunto, é destinada a ilustrar as possíveis combinações sem ficar limitado a elas:

estrobilurinas

azoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina, fluoxastrobina, cresoxim-metila, metominostrobin, picoxistrobina, piraclostrobina, trifloxistrobina, orisastrobina, metil (2-cloro-5-[1-(3-metilbenziloxiimino)etil]benzil) carbamato, metil (2-cloro-5-[1-(6-metilpiridin-2-ilmetoxiimino)etil]benzil)carbamato, metil 2-(orto-(2, 5-dimetilfeniloximetilene)fenil)-3-metoxiacrilto;

carboxamidas

-carboxanilidas: benalaxila, benodanila, boscalid, carboxina, mepronila, fenfuram, fenexamid, flutolanila, furametpir, metalaxila, ofurace, oxadixila, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida, tiadinila, N-(4'-bromobifenil-2-il)-4-difluorometil-2-metiltiazol-5-carboxamida, N-(4'-trifluorometilbifenil-2-il)-4-difluorometil-2-metiltiazol-5-carboxamida, N-(4'-cloro-3'-fluorobifenil-2-il)-4-difluorometil-2-metiltiazol-5-carboxamida, N-(3',4'-dicloro-4-fluorobifenil-2-il)-3-difluorometil-1-metilpirazol-4-carboxamida, N-(2-cianofenil)-3,4-dicloroisotiazol-5-carboxamida;

-morfolidas do ácido carboxílico: dimetomorf, flumorf;

-benzamidás: flumetover, fluopicolida (picobenzamid), zoxamida;

-outros carboxamidás: carpropamid, diclocimet, mandipropamid, N-(2-(4-[3-(4-clorofenil)prop-2-inilóxi]-3-metoxifenil)etil)-2-metanossulfonilmino-3-metilbutiramida, N-(2-(4-[3-(4-clorofenil)prop-2-inilóxi]-3-metoxifenil)etil)-2-etanossulfonilmino-3-metilbutiramida;

azóis

-triazóis: bitercanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, enilconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, flusilazol, fluquinconazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanila, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimenol, triadimefon, triticonazol;

-imidazóis: ciazofamid, imazalila, pefurazoato, procloraz, triflumizol;

-benzimidazóis: benomila, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol;

-outros: etaboxam, etridiazol, himexazol;

Compostos de heterociclila nitrogenosos

-piridinas: fluazinam, pirifenox, 3-[5-(4-clorofenil)-2, 3-dimetilisoxazolidin-3-il]-piridina;

-pirimidinas: bupirimato, ciprodinila, ferinzone, fenarimol, mepanipirim, nuarimol, pirimetanila;

-piperazinas: triforina;

-pirróis: fludioxonila, fenciclonila;

-morfolinas: aldimorf, do demorf, fenpropimorf, tridemorf;

-dicarboximidás: iprodiona, procimidona, vinclozolina;

-outros: acibenzolar-S-metila, anilazina, captan, captafol, dazomet, diclomezina, fenoxanila, folpet, fenpropidina, famoxadona, fenamidona, octilinona, probenazol, proquinazid, piroquilon, quinoxifen,

triciclazol, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo [1,5]-pirimidina, 2-butóxi-6-iodo-3-propilcromen-4-ona, N, N-dimetil-3-(3-bromo-6-fluoro-2-metilindol-1-sulfonil)-[1, 2,4]triazol-1-sulfonamida;
carbamatos editiocarbamatos

5 -ditiocarbamatos: ferbam, mancozeb, maneb, metiram, metam, propineb, tiram, zinab, ziram;

 -carbamatos: dietofencarb, flubentiavalicarb, iprovalicarb, propamocarb, metil 3-(4-clorofenil)-3-(2-isopropoxicarbonilmino-3-metilbutirilmino) propionato, 4-fluorofenil N-(1-(1-(4-cianofenil)etanossulfonil)but-2-il)carbamato;

10 outros fungicidas

 -guanidinas: dodina, iminoctadina, guazatina;

 -antibióticos: casugamicina, polioxinas, estreptomicina, validamicina A;

15 -compostos organometálicos: sais de fentina;

 -compostos heterociclila contendo enxofre: isoprotilano, ditianon;

 -compostos de organofósforo: edifenfos, fosetila, fosetil-alumínio, iprobenfos, pirazofos, tolclufos-metila, ácido fosforoso e seus sais;

20 -compostos de organocloro: tiofanato-metila, clorotalonila, diclofluanid, tolilfluanid, flusulfamida, ftalida, hexaclorobenzeno, pencicuron, quintozeno;

 -derivativos de nitrofenila: binapacрила, dinocap, dinobuton;

25 -compostos ativos inorgânicos: mistura Bordeaux, acetato de cobre, hidróxido de cobre, oxiclureto de cobre, sulfato de cobre básico, enxofre;

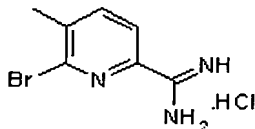
 -outros: espiroxamina, ciflufenamid, cimoxanila, metrafenona.

Exemplos de preparação:

Exemplo 1: 5,6-Dietil-3-[6-(4-fluorofenil)-5-metilpiridin-2-il]-

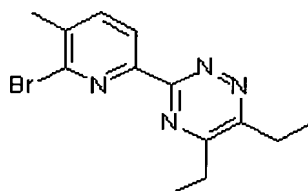
[1,2,4]-triazina

1) Preparação de cloridreto de 6-bromo-5-metilpiridina-2-carboxamida



2,2 g de uma solução de metóxido de sódio com a
 5 concentração de 30% em metanol foram adicionados a 4,90 g (25 mmol) de 6-
 bromo-5-metilpiridin-2-carbonitrila [preparação: vide US 2003/0087940 A1 e
 Bioorg. Med. Chem. Lett. 1571-1574 (2003)] em 60 ml de metanol, e a
 mistura foi agitada a 23°C por 7 h. 1,5 g de cloreto de amônio foram então
 10 adicionados, e a mistura foi agitada a 23°C por outras 8 horas. Após remoção
 do solvente, metil terc-butil éter (MtBE) foi adicionado e o produto foi
 filtrado com sucção. Produção: 4.2 g como um sólido branco que foi reagido
 sem mais purificação.

2) Preparação de 3-(6-bromo-5-metilpiridin-2-il)-5,6-dietil-
 [1,2,4]-triazina

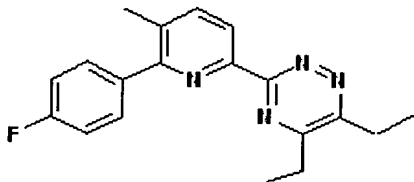


15 2,4 g (48 mmol) de hidróxido de hidrazínio foram adicionados
 a uma solução de 10 g (40 mmol) do composto preparado na Etapa 1 em 100
 ml de etanol. Após 30 min, 4,6 g (40 mmol) de 3,4-hexanodiona foram
 adicionados e a mistura foi agitada sob refluxo por 5 horas e então permitida
 repousar a 23 °C por 12 horas. Água e n-pentano foram adicionados à solução
 20 de reação e o produto precipitado foi filtrado com sucção. Produção: 9, 9 g de
 produto.

$^1\text{H-NMR}$ (δ , CDCl_3 ,): 1,4 (m); 2,5 (s); 2, 9 (m); 3, 1 (m); 7, 7

(m) e 8,4 (m).

3) Preparação de 5,6-dietil-3-[6-(4-fluorofenil)-5-metilpiridin-2-il]-[1,2,4]-triazina

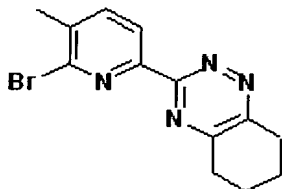


0,21 g de ácido 4-fluorofenilborônico e 0,41 g de carbonato de sódio em 20 ml de água foram adicionados sucessivamente a uma solução de 0,4 g do composto preparado na Etapa 2 em 20 ml de etileno glicoldimetil éter. Após adição de cerca de 30 mg de dicloreto de [1,4 - bis(difenilfosfino)butano]paládio(II), a mistura foi agitada sob refluxo por 5 horas. A solução de reação foi então dividida entre água e MtBE. A fase orgânica foi separada, o solvente foi removido sob pressão reduzida e o resíduo foi cromatografado em gel de sílica usando-se cicloexano/MtBE (1:1). Isto forneceu 0,24 g de produto.

P.f. 108°C

Exemplo 2: 3-[6-(4-Fluorofenil)-5-metilpiridin-2-il]-5,6,7,8-tetraidrobenzo-[1,2,4]-triazina

1) Preparação de 3-(6-bromo-5-metilpiridin-2-il)-5,6,7,8-tetraidrobenzo-[1,2,4]-triazina

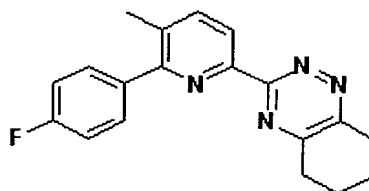


2,4 g (48 mmol) de hidróxido de hidrazínio foram adicionados a uma solução de 10 g (40 mmol) de cloridreto de 6-bromo-5-metilpiridino-2-carboxamida em 100 ml de etanol (EtOH). Após 30 min, 4,5 g (40 mmol) de cicloexano-1,2-diona foram adicionados, e a mistura foi agitada sob refluxo por 7 horas. A solução de reação foi então dividida entre água e

MtBE. A fase orgânica foi separada, o solvente foi removido sob pressão reduzida e o resíduo foi cromatografado em gel de sílica usando-se cicloexano/MtBE (1:1) e MtBE/EtOH (1:1). Produção: 5,5 g de produto.

¹H-NMR (δ , CDCl₃,): 1,9 (m); 2,5 (s); 2, 8 (m); 3,1 (m); 3,2 (m); 7,7 (m) e 8,45 (m).

2) Preparação de 3-[6-(4-fluorofenil)-5-metilpiridin-2-il]-5,6,7,8-tetraidro-benzo-[1,2,4]-triazina



0,22 g de ácido 4-fluorofenilborônico e 0,41 g de carbonato de sódio em 20 ml de água foram adicionados sucessivamente a uma solução de 0,4 g do composto preparado na Etapa 1 em 20 ml de etileno glicoldimetil éter. Após adição de cerca de 30 mg de dicloreto de [1,4 - bis(difenilfosfino)butano]paládio(II), a mistura foi agitada sob refluxo por 5 horas. A solução de reação foi então dividida entre água e MtBE. A fase orgânica foi separada, o solvente foi removido sob pressão reduzida e o resíduo foi cromatografado em gel de sílica usando-se cicloexano/MtBE (1:1). Isto forneceu 0,13 g de produto.

P.f. 105°C

Os compostos de fórmula geral I descritos na Tabela 1 foram preparados de uma maneira análoga:

20 Tabela 1:

No.	R ⁵	R ⁴	R ³	R ¹	R ²	Dados fis. (°C)/[M+H] ⁺
1	4-fluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	108
2	4-fluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		105
3	4-fluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	112-115
4	fenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	70-73
5	4-fluorofenila	H	H	CH ₃	CH ₃	151-154
6	fenila	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	193-196

No.	R ⁵	R ⁴	R ³	R ¹	R ²	Dados fís. (°C)/[M+H] ⁺
7	3,4 -difluorofenila	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	139-142
8	3,4 ,5-trifluorofenila	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	169
9	3,5-difluorofenila	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	158
10	3-cloro-4-fluorofenila	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	120
11	3-metil-4-fluorofenila	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	154
12	4-clorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	133-137
13	4-metilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	128-130
14	4-metoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	118-120
15	4-cianofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	171-173
16	4-formamilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	122-124
17	4-terc-butilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	97-101
18	4-isopropilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	100-103
19	4-trifluorometilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	131-137
20	2-clorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	103-106
21	2-fluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	129-132
22	2-metilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	114-120
23	2,4 -difluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	142-144
24	3-clorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	95-98
25	3-metilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	61-64
26	3-metoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	óleo
27	4-acetilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	124-126
28	4-etoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	103-107
29	3,4 -dimetoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	99-102
30	3,5-diclorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	146-148
31	fenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		161
32	4-fluorofenila	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		140-143
33	3-cloro-4-fluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	124-128
34	4-fenóxipenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	125-128
35	4-tiometilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	123-126
36	3,4 -diclorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	145-148
37	3-cloro-4-metoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	127-130
38	3-fluoro-4-etoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	96-99
39	3,5-dimetilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 333
40	3-cloro-4-iso-propoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 397

No.	R ⁵	R ⁴	R ³	R ¹	R ²	Dados fís. (°C)/[M+H] ⁺
41	3-cloro-4-etoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	116-119
42	2-metoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	97-100
43	3-fluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H:323
44	3-etoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	89-92
45	3-fluoro-4-metóxi	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	117-120
46	3,4 -difluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	121-124
47	4-etilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	102-106
48	3,5-difluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	111-113
49	3-isopropoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 363,2
50	2, 3-difluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	114-117
51	2,5-difluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	114-118
52	2,5-diclorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	117-120
53	3-metil-4-fluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	92-95
54	2,4 -dimetoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 365,2
55	2, 3-dimetilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	125-130
56	2,5-dimetilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 333,2
57	2-etoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	89-96
58	4-trifluorometoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	113-117
59	3,4 ,5-trifluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	157-160
60	4-n-propoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	113-115
61	3-fluoro-4-metilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	119-122
62	4-iso-propoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	91-95
63	4-n-butoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 377,2
64	4-clorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		165-168
65	2-clorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		175-178
66	2-metilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		156-159
67	2,4 -difluorofenmila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		142-+145
68	2,4 -diclorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		173-176
69	4-metoxifenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		159-163
70	2-metoxifenila	CH	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		144-147
71	2-fluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		148-152
72	2, 3-dimetilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		142-145
73	2-etilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		140-142
74	2-trifluorometilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		163-166
75	4-trifluorometilfenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		155-158
76	2-metil-4-fluorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	M+H: 337, 3
77	3-metil-4-metóxi	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	101-108
78	3-metil-4-clorofenila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	105-109

No.	R ⁵	R ⁴	R ³	R ¹	R ²	Dados fís. (°C)/[M+H] ⁺
79	tiofen-2-ila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	14-144
80	4-metiltiofen-3-ila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	98-102
81	6-fluoropiridin-3-ila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	126-129
82	piridin-3-ila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	93-97
83	6-metóxipiridin-3-ila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	113-117
84	2-cloropiridin-3-ila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	93-99
85	6-cloropiridin-3-ila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	143-147
86	piridin-4-ila	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	127-130

Teste quanto à atividade fungicida:

Os compostos ativos foram preparados separadamente ou junto com uma solução estoque com 25 mg de composto ativo, que foi elaborado a 10 ml usando-se uma mistura de acetona e/ou dimetil sulfóxido (DMSO) e o emulsificante Wettoll® EM 31 (agente umectante tendo ação emulsificante e dispersante, baseado em alquilfenóis etoxilados) em uma relação volumétrica de solvente/emulsificante de 99 para 1. A mistura foi então preparada com água a 100 ml. Esta solução estoque foi diluída com a mistura de solvente/emulsificante/água descrita na concentração de composto ativo citada abaixo.

Exemplo de Uso 1 – Atividade contra praga prematura de tomate causada por *Alternaria solani*

Folhas de tomateiros em pote foram pulverizadas até o ponto de escorrimento com uma suspensão aquosa tendo a concentração de composto ativo citada abaixo. No dia seguinte, as plantas tratadas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Alternaria solani* que continha $0,17 \times 10^6$ esporos/ml em uma solução de biomalte 2% aquosa. As plantas de teste foram então colocadas em uma câmara saturada com vapor d'água em temperaturas de 20 a 22 °C. Após 5 dias, a doença das plantas de controle infectadas não tratadas tinham se desenvolvido a um tal ponto que a infecção de todas as plantas pôde ser determinada visualmente em %.

Neste teste, as plantas que tinham sido tratadas com 250 ppm

de composto ativo do exemplo 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11 ou 33 apresentaram uma infecção de no máximo 5%, enquanto que as plantas não tratadas foram 90% infectadas.

5 Exemplo de uso 2 – Atividade contra mofo cinza em folhas de pimenta sino causado por *Botrytis cinerea*, 1 dia aplicação protetora

10 Folhas de pimenta sino do cultivar “Neusiedler Ideal Elite” foram, após 2 a 3 folhas estarem bem desenvolvidas, pulverizadas ao ponto de escorrer com uma suspensão aquosa tendo a concentração de composto ativo citada abaixo. No dia seguinte, as plantas tratadas foram inoculadas com uma suspensão de esporos de *Botrytis cinerea*, que continha $1,7 \times 10^6$ esporos / ml em uma solução de biomalte 2% aquosa. As plantas de teste foram então colocadas em uma câmara climatizada escura a 22 a 24 °C e elevada umidade atmosférica. Após 5 dias, a extensão da infecção fúngica nas folhas puderam ser determinadas visualmente em %.

15 Neste teste, as plantas que tinham sido tratadas com 250 ppm do composto ativo do exemplo 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 31 ou 33 apresentaram uma infecção de no máximo 10%, enquanto que as plantas não tratadas foram 90% infectadas.

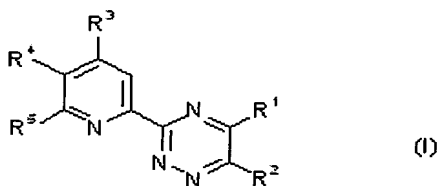
20 Exemplo de uso 3 – Atividade contra pústula em rede de cevada, causada por *Pyrenophora teres*, aplicação de proteção de 1 dia

25 Folhas de mudas de cevada em pote foram pulverizadas ao ponto de escorrimento com uma suspensão aquosa tendo a concentração de composto ativo citada abaixo. 24 horas após o revestimento de pulverização ter secado, as plantas de teste foram inoculadas com uma suspensão de esporos aquosa de *Pyrenophora* [sin. *Drechslera*) *teres*, o patógeno de pústula em rede. As plantas de teste foram então colocadas em uma estufa em temperaturas entre 20 e 24 °C e 95 a 100% de umidade atmosférica relativa. Após 6 dias, a extensão do desenvolvimento da doença foi determinada visualmente em % infecção da inteira área de folha.

Neste teste, as plantas que tinham sido tratadas com 250 ppm de composto ativo do exemplo 31 apresentaram uma infecção de no máximo 10%, enquanto que as plantas não-tratadas foram 90% infestadas.

REIVINDICAÇÕES

1. Compostos de 3-(piridin-2-il)-[1,2,4]-triazina, caracterizados pelo fato de serem de fórmula geral I



em que:

5 R^1 , R^2 , independentemente entre si, são OH, halogênio, NO_2 , NH_2 , $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquila, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -haloalquila, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -haloalcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquilmino ou di($\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquil)amino,

ou juntos com os átomos de carbono a que são ligados podem formar um carbociclo ou heterociclo saturado de 5, 6 ou 7 membros que, além
10 dos membros do anel de carbono, tem um ou dois heteroátomos selecionados do grupo consistindo de oxigênio e enxofre como membros do anel, em que o carbociclo e o heterociclo são não substituídos ou têm 1, 2, 3 ou 4 grupos $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquila como substituintes;

15 R^3 é hidrogênio, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquila, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -haloalquila, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -haloalcóxi, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -cicloalquila, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -cicloalquilmetila, ou halogênio;

R^4 é hidrogênio, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquila, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -haloalquila, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -haloalcóxi ou halogênio;

20 R^5 é $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquila, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -haloalquila, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -haloalcóxi, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -cicloalquila, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -cicloalquilóxi, heteroarila de 5 ou 6 membros, fenila, fenóxi, benzila, benzilóxi, heteroarilmetila ou heteroarilóxi de 5 ou 6 membros ou heteroarilóxi de 5 ou 6 membros, em que os radicais cíclicos mencionados acima são não substituídos ou podem ter 1, 2, 3, 4 ou 5 radicais R^a , em que

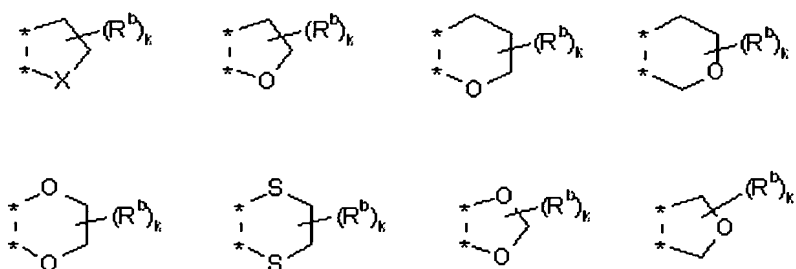
25 R^a é selecionado do grupo consistindo de OH, SH, halogênio, NO_2 , NH_2 , CN, COOH, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquila, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -haloalquila,

C₁-C₈-haloalcóxi, C₁-C₈-alquilmino, di(C₁-C₈-alquil)amino, C₁-C₈-alquiltio, C₁-C₈-haloalquiltio, C₁-C₈-alquilsulfinila, C₁-C₈-haloalquilsulfinila, C₁-C₈-alquilsulfonila, C₁-C₈-haloalquilsulfonila, C₃-C₈-cicloalquila, fenila, fenóxi e radicais de fórmula C(=Z)R^{aa}, em que Z é O, S, N(C₁-C₈-alquila), N(C₁-C₈-alcóxi), N(C₃-C₈-alquenilóxi) ou N(C₃-C₈-alquinilóxi) e R^{aa} é hidrogênio, C₁-C₈-alquila, C₁-C₈-alcóxi, NH₂, C₁-C₈-alquilamino ou di(C₁-C₈-alquil)amino, ou dois radicais R^a ligados aos átomos de carbono adjacentes juntos com os átomos de carbono a que são ligados podem também formar um carbociclo saturado de 5, 6 ou 7 membros, um anel benzeno ou um heterociclo de 5, 6 ou 7 membros que, além dos membros do anel de carbono, tem um ou dois heteroátomos selecionados do grupo consistindo de oxigênio e enxofre como membros do anel, em que o carbociclo e o heterociclo são não substituídos ou têm 1, 2, 3 ou 4 grupos C₁-C₄-alquila como substituintes;

ou um sal agriculturalmente útil de compostos de fórmula I.

2. Compostos de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de R¹ e R², independentemente entre si, serem selecionados do grupo consistindo de flúor, cloro, C₁-C₄-alquila, metóxi, etóxi, CF₃, CHF₂, OCF₃ e OCHF₂.

3. Compostos de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de R¹ e R², juntos com os átomos de carbono do anel triazina a que eles são ligados, serem um dos seguintes anéis:



em que

*são os átomos do anel triazina;

k é 0, 1, 2, 3 ou 4;

R^b é C_1 - C_4 -alquila; e

X é $(CH_2)_n$, em que $n = 1, 2$ ou 3 e em que 1, 2, 3 ou 4 dos átomos de hidrogênio de $(CH_2)_n$ serem substituídos por R^b se $k \neq 0$.

4. Compostos de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de R^1 e R^2 serem C_1 - C_4 alquila ou, juntos com os átomos de carbono do anel triazina a que eles são ligados, serem um anel de fórmula



em que

*são os átomos do anel triazina;

k é 0, 1, 2, 3 ou 4;

- 10 R^b é C_1 - C_4 -alquila; e

X é $(CH_2)_n$, em que $n = 1, 2$ ou 3 e em que 1, 2, 3 ou 4 dos átomos de hidrogênio de $(CH_2)_n$ serem substituídos por R^b se $k \neq 0$.

5. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizados pelo fato de R^3 ser hidrogênio, flúor, cloro, C_1 - C_4 alquila, metóxi, etóxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 ou $OCHF_2$.

6. Compostos de acordo com a reivindicação 5, caracterizados pelo fato de R^3 ser hidrogênio.

7. Compostos de acordo com a reivindicação 5, caracterizados pelo fato de R^3 ser cloro, CF_3 , metila ou metóxi.

- 20 8. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizados pelo fato de R^4 ser hidrogênio, flúor, cloro, metila, etila, metóxi, etóxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 ou $OCHF_2$.

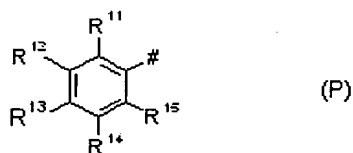
9. Compostos de acordo com a reivindicação 8, caracterizados pelo fato de R^4 ser hidrogênio, flúor, cloro ou metila.

- 25 10. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizados pelo fato de R^a ser selecionado do grupo consistindo de halogênio, C_1 - C_4 alquila, C_1 - C_4 alcóxi, C_1 - C_4

alquilcarbonila, C₁-C₄ alcoxicarbonila e radicais de fórmula C(=N-O-C₁-C₈-alquila)R^{aa}, em que R^{aa} é hidrogênio ou C₁-C₄ alquila.

11. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizados pelo fato de R⁵ ser fenila, fenóxi ou benzila, em que o anel fenila tem 1,2, 3, 4 ou 5 radicais R^a.

12. Compostos de acordo com a reivindicação 10, caracterizados pelo fato de o anel fenila de fenila, fenóxi ou benzila ter a fórmula geral P.



em que # é o ponto de ligação ao resto da molécula;

10 R¹¹ é hidrogênio, flúor, cloro, CH₃, OCH₃, OCHF₂, OCF₃ ou CF₃;

R¹², R¹⁴ independentemente entre si são hidrogênio, cloro, flúor, CH₃, OCH₃, OCHF₂, OCF₃ ou CF₃, em que um dos radicais R¹² e R¹⁴ pode também ser NO₂, C(O)CH₃ ou COOCH₃;

15 R¹³ é hidrogênio, flúor, cloro, ciano, OH, CHO, NO₂, NH₂, metilamino, dimetilamino, dietilamino, C₁-C₄-alquila, C₃-C₈-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi, CO(A²), em que A² é C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-alcóxi, ou um grupo C(R^{13a})=NOR^{13b} em que R^{13a} é hidrogênio ou metila e R^{13b} é C₁-C₄-alquila, propargila ou alila, ou R¹² e R¹³ juntos formam um grupo O-CH₂-O; e

R¹⁵ é hidrogênio, flúor, cloro ou C₁-C₄-alquila.

13. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 9, caracterizados pelo fato de R⁵ ser C₁₋₆ alquila ou C₁₋₆ haloalquila.

25 14. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 9, caracterizados pelo fato de R⁵ ser selecionado do grupo

consistindo de heteroarila de 5 membros que tem 1, 2, 3 ou 4 átomos de nitrogênio ou 1 heteroátomo selecionado do grupo consistindo de oxigênio e enxofre e opcionalmente 1, 2 ou 3 átomos de nitrogênio como átomos do anel e hetarila de 6 membros que tem 1, 2, 3 ou 4 átomos de nitrogênio como membros do anel, em que a hetarila de 5 e 6 membros pode ter 1, 2, 3 ou 4 substituintes R^a.

15. Compostos de acordo com a reivindicação 14, caracterizados pelo fato de R⁵ ser selecionado do grupo consistindo de furila, tienila, piridinila e pirimidinila, que são em cada caso não substituídos ou têm 1, 2 ou 3 substituintes R^a.

16. Uso de compostos de fórmula I como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 15 ou de um seu sal, caracterizado pelo fato de ser para combater fungos fitopatogênicos.

17. Agente para proteção de colheita, caracterizado pelo fato de compreender um veículo sólido ou líquido e um composto de fórmula I como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 15 e/ou um seu sal.

18. Semente, caracterizada pelo fato de compreender um composto de fórmula I como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 15 e/ou um seu sal.

19. Processo para combater fungos fitopatogênicos, caracterizado pelo fato de os fungos ou os materiais, plantas, solo ou semente a serem protegidos contra ataque fúngico serem/ser tratado(s) com uma quantidade eficaz de um composto de fórmula I, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 15 ou um seu sal.

RESUMO

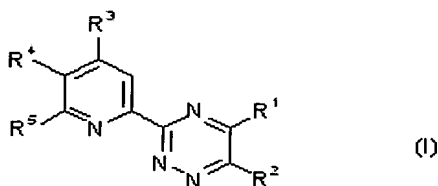
“COMPOSTOS, USO DE COMPOSTOS, AGENTE PARA PROTEÇÃO DE COLHEITA, SEMENTE, E, PROCESSO PARA COMBATER FUNGOS FITOPATOGÊNICOS”

5 A invenção refere-se a 3-(piridin-2-il)-[1,2,4]-triazinas de fórmula (I) e seu uso no controle de fungos parasíticos e a herbicidas que contêm ditos compostos como um seu ingrediente eficaz. Na fórmula (I), R¹ e R² representam independentemente OH, halogênio, NO₂, NH₂, C₁-C₈ alquila, C₁-C₈ alcóxi, C₁-C₈ halogenalquila, C₁-C₈ halogenalcóxi, C₁-C₈ alquilamino ou di(C₁-C₈ alquil)amino ou sua forma, junto com os átomos a
10 que eles são ligados, um carbociclo ou heterociclo de cinco, seis ou sete membros saturado, que, além dos membros do anel de carbono, tem um ou dois heteroátomos selecionados de oxigênio ou enxofre como os membros do anel, o carbociclo é o heterociclo sendo não substituídos ou tendo 1, 2, 3 ou 4
15 grupos C₁-C₄ alquila como substituintes; R³ representa hidrogênio, C₁-C₄ alquila, C₁-C₄ alcóxi, C₁-C₄ halogenalquila, C₁-C₄ halogenalcóxi, C₃-C₆ cicloalquila, C₃-C₆ cicloalquilmetila ou halogênio; R⁴ representa hidrogênio, C₁-C₄ alquila, C₁-C₄ alcóxi, C₁-C₄ halogenalquila, C₁-C₄ halogenalcóxi ou halogênio; R⁵ representa C₁-C₈ alquila, C₁-C₈ halogenalquila, C₁-C₈ alcóxi,
20 C₁-C₈ halogenalcóxi, C₃-C₈ cicloalquila, C₃-C₈ cicloalquilóxi, heteroarila, fenila, fenóxi, benzila, benzilóxi de cinco ou seis membros, heteroarilmetila de cinco ou seis membros ou heteroarilóxi de cinco ou seis membros, ditos grupos sendo não substituídos ou tendo 1, 2, 3, 4 ou 5 grupos R^a.

A requerente apresenta novas vias das reivindicações para conformar o pedido com o Relatório Preliminar Internacional sobre Patenteabilidade.

REIVINDICAÇÕES

1. Compostos de 3-(piridin-2-il)-[1,2,4]-triazina, caracterizados pelo fato de serem de fórmula geral I



em que:

5 R^1 , R^2 , independentemente entre si, são OH, halogênio, NO_2 , NH_2 , $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquila, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -haloalquila, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -haloalcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquilmino ou di($\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquil)amino,

ou juntos com os átomos de carbono a que são ligados podem formar um carbociclo ou heterociclo saturado de 5, 6 ou 7 membros que, além dos membros do anel de carbono, tem um ou dois heteroátomos selecionados do grupo consistindo de oxigênio e enxofre como membros do anel, em que o carbociclo e o heterociclo são não substituídos ou têm 1, 2, 3 ou 4 grupos $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquila como substituintes;

15 R^3 é hidrogênio, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquila, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -haloalquila, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -haloalcóxi, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -cicloalquila, $\text{C}_3\text{-C}_6$ -cicloalquilmetila, ou halogênio;

R^4 é hidrogênio, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquila, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -haloalquila, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -haloalcóxi ou halogênio;

20 R^5 é $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquila, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -haloalquila, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -haloalcóxi, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -cicloalquila, $\text{C}_3\text{-C}_8$ -cicloalquilóxi, heteroarila de 5 ou 6 membros, fenila, fenóxi, benzila, benzilóxi, heteroarilmetila ou heteroarilóxi de 5 ou 6 membros ou heteroarilóxi de 5 ou 6 membros, em que os radicais cíclicos mencionados acima são não substituídos ou podem ter 1, 2, 3, 4 ou 5 radicais R^a , em que

25 R^a é selecionado do grupo consistindo de OH, SH, halogênio, NO_2 , NH_2 , CN, COOH, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquila, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alcóxi, $\text{C}_1\text{-C}_8$ -haloalquila,

C₁-C₈-haloalcóxi, C₁-C₈-alquilmino, di(C₁-C₈-alquil)amino, C₁-C₈-alquiltio, C₁-C₈-haloalquiltio, C₁-C₈-alquilsulfinila, C₁-C₈-haloalquilsulfinila, C₁-C₈-alquilsulfonila, C₁-C₈-haloalquilsulfonila, C₃-C₈-cicloalquila, fenila, fenóxi e radicais de fórmula C(=Z)R^{aa}, em que Z é O, S, N(C₁-C₈-alquila), N(C₁-C₈-alcóxi), N(C₃-C₈-alquenilóxi) ou N(C₃-C₈-alquinilóxi) e R^{aa} é hidrogênio, C₁-C₈-alquila, C₁-C₈-alcóxi, NH₂, C₁-C₈-alquilamino ou di(C₁-C₈-alquil)amino, ou dois radicais R^a ligados aos átomos de carbono adjacentes juntos com os átomos de carbono a que são ligados podem também formar um carbociclo saturado de 5, 6 ou 7 membros, um anel benzeno ou um heterociclo de 5, 6 ou 7 membros que, além dos membros do anel de carbono, tem um ou dois heteroátomos selecionados do grupo consistindo de oxigênio e enxofre como membros do anel, em que o carbociclo e o heterociclo são não substituídos ou têm 1, 2, 3 ou 4 grupos C₁-C₄-alquila como substituintes;

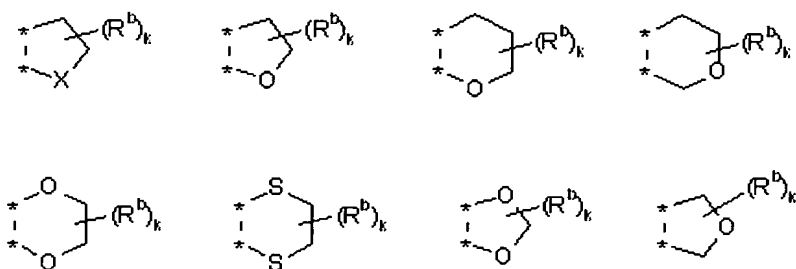
ou um sal agriculturalmente útil de compostos de fórmula I, com a exceção de:

- 2,6-bis-(5,6-dimetil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
- 2,6-bis-(5,6-dietil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
- 2,6-bis-(5,6-dipropil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
- 2,6-bis-(5,6-diisopropil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
- 2,6-bis-(5,6-dibutil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
- 2,6-bis-(5,6-diisobutil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
- 2,6-bis-(5,6-dipentil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
- 2,6-bis-(5,6-diexil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
- 2,6-bis-(5,6-dieptil-1,2,4-triazin-3-il)piridina;
- 3-[6-2,2'-bipiridil]-5,6-dimetil-1,2,4-triazina;
- 3-[6-2,2'-bipiridil]-5,6-dietil-1,2,4-triazina;
- 3-[6-2,2'-bipiridil]-5,6-dipropil-1,2,4-triazina;
- 3-[6-2,2'-bipiridil]-5,6-dibutil-1,2,4-triazina;
- 5,6-dietil-3-[6-(2-piridil)-4-metoxipiridin-2-il]-1,2,4-triazina;

3-(6-metilpiridin-2-il)-5,6-dimetil-1,2,4-triazina;
 3-(6-metilpiridin-2-il)-5,6-dietil-1,2,4-triazina;
 2,6-bis-(5,6-dimetóxi-1,2,4-triazin-3-il)piridina; e
 2,6-bis-(5,6-dietóxi-1,2,4-triazin-3-il)piridina.

5 2. Compostos de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de R^1 e R^2 , independentemente entre si, serem selecionados do grupo consistindo de flúor, cloro, C_1 - C_4 -alquila, metóxi, etóxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 e $OCHF_2$.

10 3. Compostos de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de R^1 e R^2 , juntos com os átomos de carbono do anel triazina a que eles são ligados, serem um dos seguintes anéis:



em que

*são os átomos do anel triazina;

k é 0, 1, 2, 3 ou 4;

15 R^b é C_1 - C_4 -alquila; e

X é $(CH_2)_n$, em que $n = 1, 2$ ou 3 e em que 1, 2, 3 ou 4 dos átomos de hidrogênio de $(CH_2)_n$ serem substituídos por R^b se $k \neq 0$.

20 4. Compostos de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de R^1 e R^2 serem C_1 - C_4 alquila ou, juntos com os átomos de carbono do anel triazina a que eles são ligados, serem um anel de fórmula



em que

*são os átomos do anel triazina;

k é 0, 1, 2, 3 ou 4;

R^b é C_1 - C_4 -alquila; e

X é $(CH_2)_n$, em que $n = 1, 2$ ou 3 e em que 1, 2, 3 ou 4 dos átomos de hidrogênio de $(CH_2)_n$ serem substituídos por R^b se $k \neq 0$.

5. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizados pelo fato de R^3 ser hidrogênio, flúor, cloro, C_1 - C_4 alquila, metóxi, etóxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 ou $OCHF_2$.

6. Compostos de acordo com a reivindicação 5, caracterizados pelo fato de R^3 ser hidrogênio.

7. Compostos de acordo com a reivindicação 5, caracterizados pelo fato de R^3 ser cloro, CF_3 , metila ou metóxi.

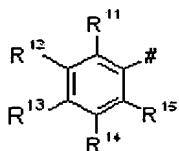
8. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizados pelo fato de R^4 ser hidrogênio, flúor, cloro, metila, etila, metóxi, etóxi, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 ou $OCHF_2$.

9. Compostos de acordo com a reivindicação 8, caracterizados pelo fato de R^4 ser hidrogênio, flúor, cloro ou metila.

10. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizados pelo fato de R^a ser selecionado do grupo consistindo de halogênio, C_1 - C_4 alquila, C_1 - C_4 alcóxi, C_1 - C_4 alquilcarbonila, C_1 - C_4 alcóxicarbonila e radicais de fórmula $C(=N-O-C_1-C_8$ -alquila) R^{aa} , em que R^{aa} é hidrogênio ou C_1 - C_4 alquila.

11. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizados pelo fato de R^5 ser fenila, fenóxi ou benzila, em que o anel fenila tem 1,2, 3, 4 ou 5 radicais R^a .

12. Compostos de acordo com a reivindicação 10, caracterizados pelo fato de o anel fenila de fenila, fenóxi ou benzila ter a fórmula geral P.



(P)

em que # é o ponto de ligação ao resto da molécula;

R^{11} é hidrogênio, flúor, cloro, CH_3 , OCH_3 , $OCHF_2$, OCF_3 ou CF_3 ;

R^{12} , R^{14} independentemente entre si são hidrogênio, cloro, flúor, CH_3 , OCH_3 , $OCHF_2$, OCF_3 ou CF_3 , em que um dos radicais R^{12} e R^{14} pode também ser NO_2 , $C(O)CH_3$ ou $COOCH_3$;

R^{13} é hidrogênio, flúor, cloro, ciano, OH, CHO, NO_2 , NH_2 , metilamino, dimetilamino, dietilamino, C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_8 -cicloalquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -haloalquila, C_1 - C_4 -haloalcóxi, $CO(A^2)$, em que A^2 é C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -alcóxi, ou um grupo $C(R^{13a})=NOR^{13b}$ em que R^{13a} é hidrogênio ou metila e R^{13b} é C_1 - C_4 -alquila, propargila ou alila, ou R^{12} e R^{13} juntos formam um grupo $O-CH_2-O$; e

R^{15} é hidrogênio, flúor, cloro ou C_1 - C_4 -alquila.

13. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 9, caracterizados pelo fato de R^5 ser C_{1-6} alquila ou C_{1-6} haloalquila.

14. Compostos de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 9, caracterizados pelo fato de R^5 ser selecionado do grupo consistindo de heteroarila de 5 membros que tem 1, 2, 3 ou 4 átomos de nitrogênio ou 1 heteroátomo selecionado do grupo consistindo de oxigênio e enxofre e opcionalmente 1, 2 ou 3 átomos de nitrogênio como átomos do anel e hetarila de 6 membros que tem 1, 2, 3 ou 4 átomos de nitrogênio como membros do anel, em que a hetarila de 5 e 6 membros pode ter 1, 2, 3 ou 4 substituintes R^a .

15. Compostos de acordo com a reivindicação 14, caracterizados pelo fato de R^5 ser selecionado do grupo consistindo de furila, tienila, piridinila e pirimidinila, que são em cada caso não substituídos ou têm 1, 2 ou 3 substituintes R^a .

16. Uso de compostos de fórmula I como definidos em

qualquer uma das reivindicações 1 a 15 ou de um seu sal, caracterizado pelo fato de ser para combater fungos fitopatogênicos.

5 17. Agente para proteção de colheita, caracterizado pelo fato de compreender um veículo sólido ou líquido e um composto de fórmula I como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 15 e/ou um seu sal.

18. Semente, caracterizada pelo fato de compreender um composto de fórmula I como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 15 e/ou um seu sal.

10 19. Processo para combater fungos fitopatogênicos, caracterizado pelo fato de os fungos ou os materiais, plantas, solo ou semente a serem protegidos contra ataque fúngico serem/ser tratado(s) com uma quantidade eficaz de um composto de fórmula I, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 15 ou um seu sal.