



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

(21) BR 112020010583-0 A2



(22) Data do Depósito: 26/11/2018

(43) Data da Publicação Nacional: 10/11/2020

(54) Título: NOVOS BICICLOS DE ISOTIAZOL-AZEPINONA, PROCESSOS PARA SUA PREPARAÇÃO E SEU USO COMO HERBICIDAS E/OU REGULADORES DE CRESCIMENTO DE PLANTAS

(51) Int. Cl.: C07D 513/04; A01N 43/90.

(30) Prioridade Unionista: 29/11/2017 EP 17204340.8.

(71) Depositante(es): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT.

(72) Inventor(es): JULLIEN REY; JÖRG TIEBES; DAYNA MICHELLE STURGESS; HANSJÖRG DIETRICH; ANU BHEEMIAIH MACHETTIRA.

(86) Pedido PCT: PCT EP2018082541 de 26/11/2018

(87) Publicação PCT: WO 2019/105887 de 06/06/2019

(85) Data da Fase Nacional: 27/05/2020

(57) Resumo: NOVOS BICICLOS DE ISOTIAZOL-AZEPINONA, PROCESSOS PARA SUA PREPARAÇÃO E SEU USO COMO HERBICIDAS E/OU REGULADORES DE CRESCIMENTO DE PLANTAS. A invenção refere-se ao campo técnico de herbicidas e/ou reguladores de crescimento de plantas. Especificamente, a invenção refere-se a bicciclos de isotiazol-azepinona e composições compreendendo os referidos novos bicciclos de isotiazol-azepinona. Além disso, a presente invenção refere-se a processos para a preparação dos referidos novos bicciclos de isotiazol-azepinona e seu uso como herbicidas e/ou reguladores de crescimento de plantas.

NOVOS BICICLOS DE ISOTIAZOL-AZEPINONA, PROCESSOS PARA SUA PREPARAÇÃO E SEU USO COMO HERBICIDAS E/OU REGULADORES DE CRESCIMENTO DE PLANTAS

[1] A invenção refere-se ao campo técnico de herbicidas e/ou reguladores de crescimento de plantas. Especificamente, a invenção refere-se a biciclos de isotiazol-azepinona e composições compreendendo os referidas novos biciclos de isotiazol-azepinona. Além disso, a presente invenção refere-se a processos para a preparação dos referidos novos biciclos de isotiazol-azepinona e seu uso como herbicidas e/ou reguladores de crescimento de plantas.

[2] Em sua aplicação, os agentes de proteção de culturas conhecidos até o momento para o controle seletivo de plantas nocivas em culturas de plantas úteis ou compostos ativos para o controle de vegetação indesejada às vezes apresentam desvantagens, seja (a) que eles não possuem atividade herbicida suficiente ou são insuficientes contra plantas prejudiciais específicas, (b) que o espectro de plantas prejudiciais que podem ser controladas com um composto ativo não é amplo o suficiente, (c) que sua seletividade em culturas de plantas úteis é muito baixa e/ou (d) que tem um perfil toxicologicamente desfavorável.

[3] Além disso, alguns compostos ativos que podem ser usados como reguladores de crescimento de plantas para várias plantas úteis causam rendimentos de colheita reduzidos indesejados em outras plantas úteis ou não são compatíveis com a planta de colheita ou estão apenas dentro de uma faixa estreita de taxa de aplicação. Alguns dos compostos ativos conhecidos não podem ser produzidos economicamente em escala industrial devido a precursores e reagentes difíceis de obter, ou eles têm apenas uma estabilidade química insuficiente.

[4] O estado da técnica anterior descreve vários isotiazóis e isotiazolamidas.

[5] O documento WO 2016/102435 divulga isotiazolamidas e seu uso como fungicidas.

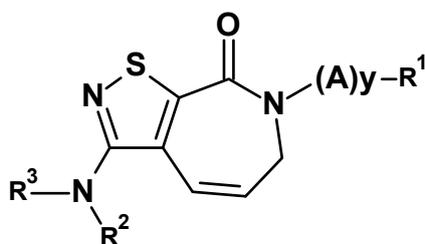
[6] O documento WO 2016/102420 divulga isotiazolamidas e seu uso como herbicidas e/ou reguladores de crescimento de plantas.

[7] Assim, ainda há necessidade de herbicidas alternativos, em particular herbicidas altamente ativos, particularmente úteis a baixas taxas de aplicação e/ou com boa compatibilidade com plantas cultivadas, para aplicação seletiva em culturas de plantas ou uso em terras não cultivadas. Também é desejável fornecer compostos ativos químicos alternativos que possam ser utilizados de maneira vantajosa como herbicidas ou reguladores de crescimento de plantas.

[8] É, portanto, um objetivo da presente invenção fornecer compostos com atividade herbicida que sejam altamente eficazes contra plantas nocivas economicamente importantes, mesmo a taxas de aplicação relativamente baixas e que possam ser usadas seletivamente em plantas de cultura.

[9] Verificou-se agora que os compostos da fórmula (G1) a seguir e/ou seus sais atendem ao (s) objetivo (s).

[10] A presente invenção refere-se principalmente a compostos das fórmulas (G1) e/ou seus sais



[11] (G1)

[12] em que

[13] A é CR⁶R⁷,

[14] R^1 é hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_2-C_8) -alquenila, (C_2-C_8) -alquinila, $NR^{13}R^{14}$, $R^{13}R^{14}N$ - (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alcoxi, (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alquiltio, (C_1-C_8) -alquilsulfinila, (C_1-C_8) -alquilsulfonila, (C_1-C_8) -alquiltio- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alquilsulfinil- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alquilsulfonil- (C_1-C_8) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_8) -cicloalquenila, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquenil- (C_1-C_8) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalcoxi, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_8) -alcoxi, arila, aril- (C_1-C_8) -alquila, heteroarila, heteroaril- (C_1-C_8) -alquila, heterociclila, heterociclil- (C_1-C_8) -alquila, ariloxi, heteroariloxi, heterocicliloxi, um resíduo bicíclico ou heterobicíclico, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, oxo, nitro, hidroxila, ciano, $NR^{13}R^{14}$, (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -haloalquila, (C_1-C_8) -alcoxi, (C_1-C_8) -haloalcoxi, (C_1-C_8) -alquiltio, (C_1-C_8) -alquilsulfinila, (C_1-C_8) -alquilsulfonila, (C_1-C_8) -haloalquiltio, (C_1-C_8) -haloalquilsulfinila, (C_1-C_8) -haloalquilsulfonila, (C_1-C_8) -alcoxicarbonila, (C_1-C_8) -haloalcoxicarbonila, (C_1-C_8) -alquilcarboxi, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alcoxicarbonil- (C_1-C_8) -alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil- (C_1-C_8) -alquila, $R^{13}R^{14}N$ -carbonila, e em que heterociclila tem grupos oxo q, e em que cada um dos resíduos heterocíclicos acima mencionados, além dos átomos de carbono, possui, respectivamente, membros a partir do grupo consistindo em $N(R^{12})_m$, O e $S(O)_n$,

[15] R^2 , R^3 são respectivamente independentemente hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_2-C_8) -alquenila, (C_2-C_8) -alquinila, (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -alquilcarbonila, (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -

alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila,
 hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonila, e em que
 heterociclila tem grupos oxo q, e em que cada um dos resíduos
 heterocíclicos acima mencionados, além dos átomos de carbono,
 possui, respectivamente, membros a partir do grupo
 consistindo em N(R¹²)_m, O e S(O)_n,

[16] ou

[17] NR²R³ é -N=CR⁸R⁹ ou -N=S(O)_nR¹⁰R¹¹,

[18] R⁶, R⁷ são respectivamente
 independentemente hidrogênio, ciano, halogênio, (C₁-C₈)-
 alquila, (C₂-C₈)-alquenila, (C₂-C₈)-alquinila, ou (C₃-C₈)-
 cicloalquila,

[19] ou

[20] R⁶ e R⁷, junto com o átomo de carbono ao qual
 estão ligados, formam um anel heterocíclico ou carbocíclico
 de 3 a 6 membros, que compreende respectivamente, além dos
 átomos de carbono, membros do anel p a partir do grupo
 consistindo em N(R¹²)_m, O e S(O)_n e em que o referido anel é
 não substituído ou é substituído por um ou mais resíduos a
 partir do grupo consistindo em halogênio, nitro, hidroxila,
 ciano, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₈)-
 alcoxi, (C₁-C₈)-haloalcoxi, (C₁-C₈)-alquiltio, (C₁-C₈)-
 alquilsulfinila, (C₁-C₈)-alquilsulfonila, (C₁-C₈)-
 haloalquiltio, (C₁-C₈)-haloalquilsulfinila, (C₁-C₈)-
 haloalquilsulfonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonila, (C₁-C₈)-
 haloalcoxicarbonila, (C₁-C₈)-alquilcarboxi, (C₃-C₈)-
 cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-
 alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila,
 hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonila e tem grupos
 oxo q,

[21] R⁸, R⁹ são respectivamente
 independentemente hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₂-C₆)-
 alquenila, (C₂-C₆)-alquinila, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₂-C₆)-

alqueniloxi, (C₂-C₆)- (C₂-C₆)-alquiniloxi, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₆)-alcoxi-(C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₆)-alcoxi-(C₂-C₆)-alcoxi-(C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₄)-alquiltio-(C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₄)-alquilsulfinil-(C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₄)-alquilsulfonil-(C₁-C₃)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquenila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₈)-alquila, arila, aril-(C₁-C₈)-alquila, heteroarila, heteroaril-(C₁-C₈)-alquila, heterociclila, heterociclil-(C₁-C₈)-alquila, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₈)-alcoxi, (C₁-C₈)-haloalcoxi, (C₁-C₈)-alquiltio, (C₁-C₈)-alquilsulfinila, (C₁-C₄)-alquilsulfonila, (C₁-C₈)-haloalquiltio, (C₁-C₈)-haloalquilsulfinila, (C₁-C₈)-haloalquilsulfonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonila, (C₁-C₈)-haloalcoxicarbonila, (C₁-C₈)-alquilcarboxi, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonila e tem grupos oxo q,

[22] ou

[23] R⁸ e R⁹, junto com o átomo de carbono ao qual estão ligados, formam um anel não saturado, parcialmente saturado ou saturado de 3 a 8 membros, que compreende respectivamente, além dos átomos de carbono, membros do anel p a partir do grupo consistindo em N(R¹²)_m, O e S(O)_n e em que o referido anel é não substituído ou é substituído por um ou mais resíduos a partir do grupo consistindo em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₈)-alcoxi, (C₁-C₈)-haloalcoxi, (C₁-C₈)-alquiltio, (C₁-C₈)-alquilsulfinila, (C₁-C₈)-alquilsulfonila, (C₁-C₈)-haloalquiltio, (C₁-C₈)-haloalquilsulfinila, (C₁-C₈)-haloalquilsulfonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonila, (C₁-C₈)-

haloalcoxicarbonila, (C₁-C₈)-alquilcarboxi, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonil e tem grupos oxo q,

[24] R¹⁰, R¹¹ são respectivamente independentemente (C₁-C₈)-alquila, (C₂-C₈)-alquenila, (C₂-C₈)-alquinila, (C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alquiltio-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alquilsulfinil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alquilsulfonil-(C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquenila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₈)-alquila, arila, aril-(C₁-C₈)-alquila, heteroarila, heteroaril-(C₁-C₈)-alquila, heterociclila ou heterociclil-(C₁-C₈)-alquila, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₈)-alcoxi, (C₁-C₈)-haloalcoxi, (C₁-C₈)-alquiltio, (C₁-C₈)-alquilsulfinila, (C₁-C₈)-alquilsulfonila, (C₁-C₈)-haloalquiltio, (C₁-C₈)-haloalquilsulfinila, (C₁-C₈)-haloalquilsulfonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonila, (C₁-C₈)-haloalcoxicarbonila, (C₁-C₈)-alquilcarboxi, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonila e em que heterociclila tem grupos oxo q, e em que cada um dos resíduos heterocíclicos acima mencionados, além dos átomos de carbono, possui, respectivamente, membros a partir do grupo consistindo em N(R¹²)_m, O e S(O)_n,

[25] ou

[26] R¹⁰ e R¹¹, juntamente com o átomo de enxofre ao qual estão ligados, formam um anel não saturado, parcialmente saturado ou saturado de 3 a 8 membros, que compreende

respectivamente, além dos átomos de carbono e além do átomo de enxofre, membros do anel p a partir do grupo consistindo em $N(R^{12})_m$, O e $S(O)_n$ e em que o referido anel é não substituído ou é substituído por um ou mais resíduos a partir do grupo consistindo em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, $NR^{13}R^{14}$, (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -haloalquila, (C_1-C_8) -alcoxi, (C_1-C_8) -haloalcoxi, (C_1-C_8) -alquiltio, (C_1-C_8) -alquilsulfinila, (C_1-C_8) -alquilsulfonila, (C_1-C_8) -haloalquiltio, (C_1-C_8) -haloalquilsulfinila, (C_1-C_4) -haloalquilsulfonila, (C_1-C_8) -alcoxicarbonila, (C_1-C_8) -haloalcoxicarbonila, (C_1-C_8) -alquilcarboxi, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alcoxicarbonil- (C_1-C_8) -alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil- (C_1-C_8) -alquila, $R^{13}R^{14}N$ -carbonila e tem grupos oxo q,

[27] R^{12} é hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -haloalquila, (C_2-C_8) -alquenila, (C_2-C_8) -haloalquenila, (C_2-C_8) -alquinila, (C_2-C_8) -haloalquinila, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_8) -halocicloalquila, (C_3-C_8) -cicloalquenila, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_8) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquenil- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alquilcarbonila ou (C_1-C_8) -haloalquilcarbonila,

[28] R^{13} , R^{14} são respectivamente independentemente hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_2-C_8) -alquenila, (C_2-C_8) -alquinila, (C_2-C_8) -alquenilcarbonila, (C_2-C_8) -alquinilcarbonila, (C_1-C_8) -alquilcarbonila, (C_1-C_8) -alquilsulfonila, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_8) -cicloalquenila, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_8) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquenil- (C_1-C_8) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquilcarbonila, (C_3-C_8) -cicloalquenilcarbonila, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_8) -alquilcarbonila, (C_3-C_8) -cicloalquenil- (C_1-C_8) -alquilcarbonila, arila, arilcarbonila, arylsulfonila, hetarila, hetarilcarbonila, hetarilsulfonila, heterociclila, heterociclilcarbonila, heterociclilsulfonila, em que todos

esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NH_2 , $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquilamina, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -dialquilamina, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalquila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alcoxi, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalcoxi, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquiltio, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquilsulfinila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquilsulfonila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalquiltio, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalquilsulfinila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalquilsulfonila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alcoxicarbonila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalcoxicarbonila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquilcarboxi, $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ -cicloalquila, $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ -cicloalquil- $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alcoxicarbonil- $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil- $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquila e em que heterociclila tem grupos oxo q, e em que cada um dos resíduos heterocíclicos acima mencionados, além dos átomos de carbono, possui, respectivamente, membros a partir do grupo consistindo em $\text{N}(\text{R}^{12})_m$, O e $\text{S}(\text{O})_n$,

[29] ou

[30] R^{13} e R^{14} , juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual estão ligados, formam um anel não saturado, parcialmente saturado ou saturado de 3 a 8 membros, que compreende respectivamente, além dos átomos de carbono e além do átomo de nitrogênio, membros do anel p a partir do grupo consistindo em $\text{N}(\text{R}^{12})_m$, O e $\text{S}(\text{O})_n$ e em que o referido anel é não substituído ou é substituído por um ou mais resíduos a partir do grupo consistindo em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NH_2 , $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquilamina, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -dialquilamina, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalquila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alcoxi, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalcoxi, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquiltio, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquilsulfinila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquilsulfonila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalquiltio, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalquilsulfinila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalquilsulfonila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alcoxicarbonila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -haloalcoxicarbonila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquilcarboxi, $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ -cicloalquila, $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ -cicloalquil- $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquila, $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alcoxicarbonil- $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ -alquila,

hidroxicarbonila, hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila e tem grupos oxo q,

[31] n é independentemente selecionado a partir de 0, 1 ou 2,

[32] m é independentemente selecionado a partir de 0 ou 1,

[33] p é independentemente selecionado a partir de 0, 1, 2 ou 3,

[34] q é independentemente selecionado a partir de 0, 1 ou 2,

[35] y é 0 ou 1, 2.

[36] Sais para os fins da presente invenção são preferivelmente sais agroquimicamente ativos dos compostos de acordo com a invenção.

[37] Sais agroquimicamente ativos incluem sais de adição de ácidos de ácidos inorgânicos e orgânicos, bem como sais de bases habituais. Exemplos de ácidos inorgânicos são os ácidos halogênicos, tais como fluoreto de hidrogênio, cloreto de hidrogênio, brometo de hidrogênio e iodeto de hidrogênio, ácido sulfúrico, ácido fosfórico e ácido nítrico e sais ácidos, tais como bissulfato de sódio e bissulfato de potássio. Ácidos orgânicos úteis incluem, por exemplo, ácido fórmico, ácido carbônico e ácidos alcanóicos, tais como ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido tricloroacético e ácido propiônico, e também ácido glicólico, ácido tiociânico, ácido láctico, ácido succínico, ácido cítrico, ácido benzóico, ácido cinâmico, ácido oxálico, ácidos graxos saturados ou mono- ou diinsaturados com 6 a 20 átomos de carbono, monoésteres alquilsulfúricos, ácidos alquilsulfônicos (ácidos sulfônicos com radicais alquila de cadeia linear ou ramificada com 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfônicos ou ácidos arildisulfônicos (radicais aromáticos, tais como fenila e naftila, que possuem um ou

dois grupos de ácido sulfônico), ácidos alquilfosfônicos (ácidos fosfônicos com radicais alquila de cadeia linear ou ramificada com 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilfosfônicos ou ácidos arildifosfônicos (radicais aromáticos, tais como fenila e naftila, que possuem um ou dois radicais de ácido fosfônico), onde os radicais alquila e arila podem conter outros substituintes, por exemplo ácido p-toluenossulfônico, ácido salicílico, ácido p-aminosalicílico, ácido 2-fenoxibenzóico, ácido 2-acetoxibenzóico, etc.

[38] Os solvatos dos compostos da invenção ou seus sais são composições estequiométricas dos compostos com solventes.

[39] Grupos opcionalmente substituídos podem ser mono- ou polissubstituídos, em que os substituintes no caso de polissubstituições podem ser idênticos ou diferentes.

[40] Não estão incluídas combinações que são contrárias às leis naturais e que o versado na técnica excluiria, portanto, com base em seu conhecimento especializado. Estruturas em anel com três ou mais átomos de oxigênio adjacentes, por exemplo, são excluídas.

[41] Íons metálicos úteis são especialmente os íons dos elementos do segundo grupo principal, especialmente cálcio e magnésio, do terceiro e quarto grupo principal, especialmente alumínio, estanho e chumbo, e também do primeiro ao oitavo grupos de transição, especialmente cromo, manganês, ferro, cobalto, níquel, cobre, zinco e outros. É dada preferência particular aos íons metálicos dos elementos do quarto período. Aqui, os metais podem estar presentes nas várias valências que eles podem assumir.

[42] Os compostos desta invenção podem, por natureza de centros assimétricos ou por rotação restrita, estar presentes na forma de isômeros (enantiômeros,

diastereômeros). Qualquer isômero pode estar presente em que o centro assimétrico esteja na configuração (R)-, (S)-, ou (R,S).

[43] Também será apreciado que quando dois ou mais centros assimétricos estão presentes nos compostos da invenção, vários diastereômeros e enantiômeros das estruturas exemplificadas serão frequentemente possíveis, e que diastereômeros puros e enantiômeros puros representam modalidades preferidas. Pretende-se que estereoisômeros puros, diastereômeros puros, enantiômeros puros e suas misturas estejam dentro do escopo da invenção.

[44] Qualquer um dos compostos da presente invenção também pode existir em uma ou mais formas de isômeros geométricos, dependendo do número de ligações duplas no composto. Isômeros geométricos por natureza de substituintes sobre uma ligação dupla ou um anel podem estar presentes na forma *cis* (= *Z*-) ou *trans* (= *E*-). A invenção refere-se, assim, igualmente a todos os isômeros geométricos e a todas as misturas possíveis, em todas as proporções. Os isômeros geométricos podem ser separados de acordo com métodos gerais, que são conhecidos per se pelo versado na técnica.

[45] Salvo indicação em contrário, as seguintes definições se aplicam aos substituintes e resíduos utilizados ao longo desta especificação e reivindicações:

[46] Halogênio representa radicais de flúor, cloro, bromo e iodo. É dada preferência aos radicais flúor e cloro.

[47] Alquila representa um radical hidrocarboneto saturado de cadeia linear ou ramificada com 1 a 8 átomos de carbono. Exemplos não limitativos incluem metila, etila, propila, 1-metiletil (iso-propila), n-butila, 1-metilpropil (iso-butila), 2-metilpropil (sec-butila), 1,1-dimetiletil (terc.-butila), n-pentila, 1-metilbutila, 2-metilbutila, 3-metilbutila, 1,2-dimetilpropila, 1,1-dimetilpropila, 2,2-

dimetilpropila, 1-etilpropila, n-hexila, 1-metilpentila, 2-metilpentila, 3-metilpentila, 4-metilpentila, 1,2-dimetilbutila, 1,3-dimetilbutila, 2,3-dimetilbutila, 1,1-dimetilbutila, 2,2-dimetilbutila, 3,3-dimetilbutila, 1,1,2-trimetilpropila, 1,2,2-trimetilpropila, 1-etilbutila, 2-etilbutila, 1-etil-3-metilpropila, n-heptila, 1-metilhexila, 1-etilpentila, 2-etilpentila, 1-propilbutila, octila, 1-metilheptila, 2-metilheptila, 1-etilhexila, 2-etilhexila, 1-propilpentil and 2-propilpentila, in particular propila, 1-metiletila, butila, 1-metilbutila, 2-metilbutila, 3-metilbutila, 1,1-dimetiletila, 1,2-dimetilbutila, 1,3-dimetilbutila, pentila, 1-metilbutila, 1-etilpropila, hexila, 3-metilpentila, heptila, 1-metilhexila, 1-etil-3-metilbutila, 1-metilheptila, 1,2-dimetilhexila, 1,3-dimetiloctila, 4-metiloctila, 1,2,2,3-tetrametilbutila, 1,3,3-trimetilbutila, 1,2,3-trimetilbutila, 1,3-dimetilpentila, 1,3-dimetilhexila, 5-metil-3-hexila, 2-metil-4-heptila e 1-metil-2-ciclopropiletila. Preference is given to (C₁-C₄)-alquil representando um radical hidrocarboneto saturado de cadeia linear ou ramificada com 1 a 4 átomos de carbono, tais como metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, iso-butila, sec-butila, terc.-butila.

[48] Haloalquila representa em geral um radical alquila com 1 a 8 átomos de carbono, no qual 1 até todos os átomos de hidrogênio são substituídos por átomos de halogênio. Exemplos não limitativos incluem clorometila, diclorometila, triclorometila, fluorometila, difluorometila, trifluorometila, clorofluorometila, diclorofluorometila, clorodifluorometila, 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, 3-cloro-1-metilbutila, 2-cloro-1-metilbutila, 1-clorobutila, 3,3-dicloro-1-

metilbutila, 3-cloro-1-metilbutila, 1-metil-3-trifluorometilbutila, 3-metil-1-trifluorometilbutila.

[49] Cicloalquila representa em geral um radical alquila com 1 a 8 átomos de carbono, não qualificado 1 até todos os átomos de hidrogênio são substituídos por átomos de halogênio. Exemplos não limitativos incluem ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, ciclohexila, cicloheptila e ciclooctila.

[50] Halocicloalquila representa, em geral, um radical hidrocarboneto monocíclico saturado com 3 a 8, de preferência 3 a 6 átomos de carbono, no qual 1 a 7 átomos de hidrogênio são substituídos por átomos de halogênio. Exemplos não limitativos incluem clorociclopropila, diclorociclopropila, dibromociclopropila, fluorociclopropila, clorociclopentila e clorociclohexila.

[51] Alquenila representa, em geral, um radical hidrocarboneto monocíclico saturado com 3 a 8, preferivelmente 3 a 6 átomos de carbono, no qual 1 a 7 átomos de hidrogênio são substituídos por átomos de halogênio. Exemplos não limitativos incluem etenila, prop-1-enila, prop-2-enila, 1-metiletênica, but-1-enila, but-2-enila, but-3-enila, 1-metilprop-1-enila, 2-metilprop-1-enila, 1-metilprop-2-enila, 2-metilprop-2-enila, pent-1-enila, pent-2-enila, pent-3-enila, pent-4-enila, 1-metilbut-1-enila, 2-metilbut-1-enila, 3-metilbut-1-enila, 1-metilbut-2-enila, 2-metilbut-2-enila, 3-metilbut-2-enila, 1-metilbut-3-enila, 2-metilbut-3-enila, 3-metilbut-3-enila, 1,1-dimetilprop-2-enila, 1,2-dimetilprop-1-enila, 1,2-dimetilprop-2-enila, 1-etilprop-1-enila, 1-etilprop-2-enila, hex-1-enila, hex-2-enila, hex-3-enila, hex-4-enila, hex-5-enila, 1-metilpent-1-enila, 2-metilpent-1-enila, 3-metilpent-1-enila, 4-metilpent-1-enila, 1-metilpent-2-enila, 2-metilpent-2-enila, 3-metilpent-2-enila, 4-metilpent-2-enila, 1-metilpent-3-enila, 2-metilpent-

3-enila, 3-metilpent-3-enila, 4-metilpent-3-enila, 1-metilpent-4-enila, 2-metilent-4-enila, 3-metilpent-4-enila, 4-metilpent-4-enila, 1,1-dimetilbut-2-enila, 1,1,-dimetilbut-3-enila, 1,2-dimetilbut-1-enila, 1,2-dimetilbut-2-enila, 1,2-dimetilbut-3-enila, 1,3-dimetilbut-1-enila, 1,3-dimetilbut-2-enila, 1,3-dimetilbut-3-enila, 2,2-dimetilbut-3-enila, 2,3-dimetilbut-1-enila, 2,3-dimetilbut-2-enila, 2,3-dimetilbut-3-enila, 3,3-dimetilbut-1-enila, 3,3-dimetilbut-2-enila, 1-etilbut-1-enila, 1-etilbut-2-enila, 1-etilbut-3-enila, 2-etilbut-1-enila, 2-etilbut-2-enila, 2-etilbut-3-enila, 1,1,2-trimetilprop-2-enila, 1-etil-1-metilprop-2-enila, 1-etil-2-metilprop-1-enila e 1-etil-2-metilprop-2-enila.

[52] Cicloalquênila representam, em geral, um hidrocarboneto radical monocromático saturado com 3 a 8, preferivelmente 3 a 6 átomos de carbono, no qual 1 a 7 átomos de hidrogênio são substituídos por átomos de halogênio. Exemplos não limitativos incluem cicloopentenila, ciclohexenila, ciclohexadienila, cicloheptenila, ciclooctenila, ciclooctadienila, indanila e tetrahidronaftalenila.

[53] Alquinila representa um grupo hidrocarbila de cadeia linear ou ramificada com 2 a 8, preferivelmente 2 a 6, átomos de carbono e uma ligação tripla em qualquer posição.

[54] Exemplos não limitativos incluem etinila, prop-1-inila, prop-2-inila, but-1-inila, but-2-inila, but-3-inila, 1-metilprop-2-inila, pent-1-inila, pent-2-inila, pent-3-inila, pent-4-inila, 1-metilbut-2-inila, 1-metilbut-3-inila, 2-metilbut-3-inila, 3-metilbut-1-inila, 1,1-dimetilprop-2-inila, 1-etilprop-2-inila, hex-1-inila, hex-2-inila, hex-3-inila, hex-4-inila, hex-5-inila, 1-metilpent-2-inila, 1-metilpent-3-inila, 1-metilpent-4-inila, 2-metilpent-3-inila, 2-metilpent-4-inila, 3-metilpent-1-inila, 3-metilpent-4-inila, 4-metilpent-1-inila, 4-metilpent-2-inila, 1,1-dimetilbut-2-inila, 1,1-dimetilbut-3-inila, 1,2-

dimetilbut-3-inila, 2,2-dimetilbut-3-inila, 3,3-dimetilbut-1-inila, 1-etilbut-2-inila, 1-etilbut-3-inila, 2-etilbut-3-inila e 1-etil-1-metilprop-2-inila.

[55] Haloalquenila representa em geral um radical alquenila com 2 a 8 átomos de carbono, no qual 1 até todos os átomos de hidrogênio são substituídos por átomos de halogênio. Exemplos não limitativos incluem 3-bromo-2-propenila, 2-bromo-2-propenila, 3-cloro-2-propenila e 2-cloro-2-propenila.

[56] Haloalquinila representa geralmente um radical alquinila com 2 a 8 átomos de carbono, no qual 1 até todos os átomos de hidrogênio são substituídos por átomos de halogênio. Exemplos não limitativos incluem 2-iodopropinila e 2-bromopropinila.

[57] Alcoxi representa um radical alcoxi saturado, de cadeia linear ou ramificada, com 1 a 8 átomos. Exemplos não limitativos incluem metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletexi, butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi, 1,1-dimetiletexi.

[58] Haloalcoxi representa um radical alcoxi saturado, de cadeia linear ou ramificada, com 1 a 8 átomos, em que um até todos os átomos de hidrogênio são substituídos por átomos de halogênio. Exemplos não limitativos incluem clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi e 1,1,1-trifluoroprop-2-oxi.

[59] Alquiltio representa um radical tiol com um resíduo alquil saturado de cadeia linear ou ramificada com 1 a 8 átomos de carbono. Exemplos não limitativos incluem

metiltio, etiltio, n-propiltio, iso-propiltio, 1-metiletiltio, n-butiltio e terc.-butiltio.

[60] Alquilsulfinila representa radical (C₁-C₈)-alquil-S(O)- com um resíduo alquil saturado de cadeia linear ou ramificada com 1 a 8 átomos de carbono. Exemplos não limitativos incluem metilsulfinila, etilsulfinila, propilsulfinila, 1-metiletilsulfinila, butilsulfinila, 1-metilpropilsulfinila, 2-metilpropilsulfinila, 1,1-dimetiletilsulfinila, pentilsulfinila, 1-metilbutilsulfinila, 2-metilbutilsulfinila, 3-metilbutilsulfinila, 2,2-dimetilpropilsulfinila, 1-etilpropilsulfinila, hexilsulfinila, 1,1-dimetilpropilsulfinila, 1,2-dimetilpropilsulfinila, 1-metilpentilsulfinila, 2-metilpentilsulfinila, 3-metilpentilsulfinila, 4-metilpentilsulfinila, 1,1-dimetilbutilsulfinila, 1,2-dimetilbutilsulfinila, 1,3-dimetilbutilsulfinila, 2,2-dimetil-butilsulfinila, 2,3-dimetilbutilsulfinila, 3,3-dimetilbutilsulfinila, 1-etilbutilsulfinila, 2-etilbutilsulfinila, 1,1,2-trimetilpropilsulfinila, 1,2,2-trimetilpropilsulfinila, 1-etil-1-metilpropilsulfinila e 1-etil-2-metilpropilsulfinila.

[61] Alquilsulfonila representa um radical sulfona com um resíduo alquila saturado de cadeia linear ou ramificada com 1 a 8 átomos de carbono. Exemplos não limitativos incluem metilsulfonila, etilsulfonila, propilsulfonila, 1-metiletilsulfonila, butilsulfonila, 1-metilpropilsulfonila, 2-metilpropilsulfonila, 1,1-dimetiletilsulfonila, pentilsulfonila, 1-metilbutilsulfonila, 2-metilbutilsulfonila, 3-metilbutilsulfonila, 2,2-dimetilpropilsulfonila, 1-etilpropilsulfonila, hexilsulfonila, 1,1-dimetilpropilsulfonila, 1,2-dimetilpropilsulfonila, 1-metilpentilsulfonila, 2-metilpentilsulfonila, 3-metilpentilsulfonila, 4-

metilpentilsulfonila, 1,1-dimetilbutilsulfonila, 1,2-dimetilbutilsulfonila, 1,3-dimetilbutilsulfonila, 2,2-dimetil-butilsulfonila, 2,3-dimetilbutilsulfonila, 3,3-dimetilbutilsulfonila, 1-etilbutilsulfonila, 2-etilbutilsulfonila, 1,1,2-trimetilpropilsulfonila, 1,2,2-trimetilpropilsulfonila, 1-etil-1-metilpropilsulfonila e 1-etil-2-metilpropilsulfonila.

[62] Heterociclila representaa um radical heterocíclico monocíclico, saturado ou parcialmente insaturado, com um número total de 3 a 7, incluindo 2 a 6 átomos de carbono e 1 a 3 heteroátomos e/ou grupos hetero selecionados independentemente a partir do grupo consistindo em N, O, S, SO, SO₂ e Di-(C₁-C₄)-alquilsilila, qual sistema de anel pode ser ligado através de um átomo de carbono do anel ou, se possível, via um átomo de nitrogênio do anel. Exemplos não limitativos incluem oxirânica, aziridinila, oxetan-2-ila, oxetan-3-ila, azetidín-2-ila, azetidín-3-ila, tetrahidrofuran-2-ila, tetrahidrofuran-3-ila, tetrahidrotien-2-ila, tetrahidrotien-3-ila, pirrolidín-2-ila, pirrolidín-3-ila, tiolan-2-ila, tiolan-3-ila, sulfolan-2-ila, sulfolan-3-ila, isoxazolidín-3-ila, isoxazolidín-4-ila, isoxazolidín-5-ila, isotiazolidín-3-ila, isotiazolidín-4-ila, isotiazolidín-5-ila, pirazolidín-3-ila, pirazolidín-4-ila, pirazolidín-5-ila, oxazolidín-2-ila, oxazolidín-4-ila, oxazolidín-5-ila, tiazolidín-2-ila, tiazolidín-4-ila, tiazolidín-5-ila, imidazolidín-2-ila, imidazolidín-4-ila, 1,2,4-oxadiazolidín-3-ila, 1,2,4-oxadiazolidín-5-ila, 1,2,4-tiadiazolidín-3-ila, 1,2,4-tiadiazolidín-5-ila, 1,2,4-triazolidín-3-ila, 1,3,4-oxadiazolidín-2-ila, 1,3,4-tiadiazolidín-2-ila, 1,3,4-triazolidín-2-ila, 2,3-dihidrofur-2-ila, 2,3-dihidrofur-3-ila, 2,4-dihidrofur-2-ila, 2,4-dihidrofur-3-ila, 2,3-dihidrotien-2-ila, 2,3-dihidrotien-3-ila, 2,4-dihidrotien-2-ila, 2,4-dihidrotien-3-ila, 2-pirrolín-2-ila, 2-pirrolín-3-

ila, 3-pirrolin-2-ila, 3-pirrolin-3-ila, 2-isoxazolin-3-ila, 3-isoxazolin-3-ila, 4-isoxazolin-3-ila, 2-isoxazolin-4-ila, 3-isoxazolin-4-ila, 4-isoxazolin-4-ila, 2-isoxazolin-5-ila, 3-isoxazolin-5-ila, 4-isoxazolin-5-ila, 2-isotiazolin-3-ila, 3-isotiazolin-3-ila, 4-isotiazolin-3-ila, 2-isotiazolin-4-ila, 3-isotiazolin-4-ila, 4-isotiazolin-4-ila, 2-isotiazolin-5-ila, 3-isotiazolin-5-ila, 4-isotiazolin-5-ila, 2,3-dihidropirazol-1-ila, 2,3-dihidropirazol-2-ila, 2,3-dihidropirazol-3-ila, 2,3-dihidropirazol-4-ila, 2,3-dihidropirazol-5-ila, 3,4-dihidropirazol-1-ila, 3,4-dihidropirazol-3-ila, 3,4-dihidropirazol-4-ila, 3,4-dihidropirazol-5-ila, 4,5-dihidropirazol-1-ila, 4,5-dihidropirazol-3-ila, 4,5-dihidropirazol-4-ila, 4,5-dihidropirazol-5-ila, 2,3-dihidrooxazol-2-ila, 2,3-dihidrooxazol-3-ila, 2,3-dihidrooxazol-4-ila, 2,3-dihidrooxazol-5-ila, 3,4-dihidrooxazol-2-ila, 3,4-dihidrooxazol-3-ila, 3,4-dihidrooxazol-4-ila, 3,4-dihidrooxazol-5-ila, 3,4-dihidrooxazol-2-ila, 3,4-dihidrooxazol-3-ila, 3,4-dihidrooxazol-4-ila, piperidin-2-ila, piperidin-3-ila, piperidin-4-ila, 1,3-dioxan-5-ila, tetrahidropiran-2-ila, tetrahidropiran-3-ila, tetrahidropiran-4-ila, tetrahidrotiopiran-2-ila, tetrahidrotiopiran-3-ila, tetrahidrotiopiran-4-ila, hexahidropiridazin-3-ila, hexahidropiridazin-4-ila, hexahidropirimidin-2-ila, hexahidropirimidin-4-ila, hexahidropirimidin-5-ila, piperazin-2-ila, morfolin-2-ila, morfolin-3-ila, tiomorfolin-2-ila, tiomorfolin-3-ila, 1,1-dioxidotiomorfolin-2-ila, 1,1-dioxidotiomorfolin-3-ila, 1,3,5-hexahidrotriazin-2-ila e 1,2,4-hexahidrotriazin-3-ila.

[63] Arla representa grupos funcionais ou substituintes derivados de um anel aromático, geralmente um hidrocarboneto aromático, tal como fenila e naftila.

[64] Heteroarila e o anel de heteroarila em geral representa um radical heterocíclico aromático e monocíclico com um número total de 5 ou 6 átomos no anel, incluindo 1 a 5 átomos de carbono e até 4 heteroátomos independentemente selecionados a partir do grupo consistindo em N, O e S, em que o sistema de anel pode ser ativado através de um átomo de carbono do anel ou, se possível, via um átomo de nitrogênio do anel. Exemplos não limitativos incluem furila, pirrolila, tienila, pirazolila, imidazolila, tiazolila, oxazolila, isoxazolila, isotiazolila, triazolila, oxadiazolila, tiadiazolila, tetrazolila, piridila, pirimidinila, piridazinila, pirazinila, triazinil. Preferred are furila, tienila, pirazolila, imidazolila, tiazolila, oxazolila, isoxazolila, triazolila, oxadiazolila, tiadiazolila, piridila e pirimidinila.

[65] Oxo representa um átomo de oxigênio duplamente ligado.

[66] São preferidos compostos da fórmula (G1) e/ou seus sais, em que

[67] A é CR^6R^7 ,

[68] R^1 é hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_2-C_8) -alquenila, (C_2-C_8) -alquinila, (C_1-C_6) -alcoxi, (C_3-C_7) -cicloalquila, (C_3-C_7) -cicloalquenila, piridinila, furanila, tienila, oxanila ou fenila, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, oxo, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -haloalquila, (C_1-C_6) -alcoxi, (C_1-C_6) -haloalcoxi,

[69] R^2 , R^3 são respectivamente independentemente hidrogênio, piridinilcarbonila, furanilcarbonila, tienilcarbonila, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -alquilcarbonila, (C_2-C_6) -alquinilcarbonila, (C_1-C_6) -alquenilcarbonila, (C_1-C_6) -alcoxicarbonila, (C_3-C_8) -cicloalquilcarbonila, fenil- (C_1-C_6) -alquilcarbonila, (C_1-C_6) -

alquilcarboniloxi em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, oxo, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₁-C₆)-alcoxi,

[70] R⁶, R⁷ são respectivamente independentemente hidrogênio, ciano, halogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₂-C₆)-alquenila, (C₂-C₆)-alquinila, ou (C₃-C₈)-cicloalquila,

[71] y é 0 or 1, 2.

[72] Particularmente preferidos são compostos das fórmulas (G1) e/ou seus sais, em que

[73] A é CR⁶R⁷,

[74] R¹ é H, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, ciclo-hexila, ciclo-heptila ou fenila, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio,

[75] R³ é hidrogênio

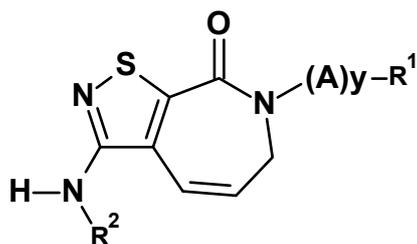
[76] R² é hidrogênio ou (C₁-C₄)-alquilcarbonila, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila,

[77] R⁶ é hidrogênio,

[78] R⁷ é hidrogênio ou metila,

[79] y é 0 ou 1.

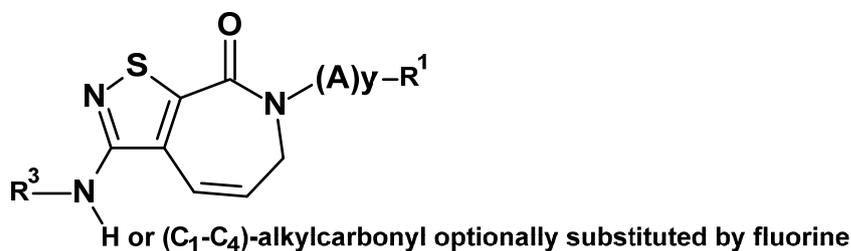
[80] Além disso, são preferidos compostos da fórmula (G1), em que R³ é igual a H. Estes compostos correspondem à fórmula (I):



(I)

[81] Compostos da fórmula (I), em que R^1 , R^2 , A e y tem o significado definido no contexto da fórmula (G1), preferivelmente tem o significado definido em uma das modalidades preferidas ou particularmente preferidas.

[82] Além disso, são preferidos compostos da fórmula (G1), em que R^2 é igual a H ou (C₁-C₄)-alquilcarbonila opcionalmente substituído por flúor. Estes compostos correspondem à fórmula (II):



(II)

(H ou (C₁-C₄)-alquilcarbonila substituído por flúor)

[83] Compostos da fórmula (II), em que R^1 , R^3 , A e y tem o significado definido no contexto da fórmula (G1), preferivelmente tem o significado definido em uma das modalidades preferidas ou particularmente preferidas.

[84] Na tabela 1 a seguir, compostos preferidos da fórmula (I) com definições específicas e preferidas de R^{1bis} e R^2 são mencionados (**onde $R^{1bis} = (A)_y-R^1$**).

[85] As abreviações e numerações das posições de substituintes usadas no contexto da presente invenção e na Tabela 1 são explicadas em detalhes na seção Exemplos a seguir.

Tabela 1: Compostos preferidos da fórmula (I)

Ex. No.	R^2	R^{1bis}
I-01	H	ciclopropilametila
I-02	H	ciclobutilametila
I-03	H	ciclopentilametila

I-04	H	ciclohexilametila
I-05	H	cicloheptilametila
I-06	H	ciclohexila
I-07	H	2-F-Benzila
I-08	H	3-F-Benzila
I-09	H	4-F-Benzila
I-10	H	2,3-diF-Benzila
I-11	H	2,4-diF-Benzila
I-12	H	2,5-diF-Benzila
I-13	H	2,6-diF-Benzila
I-14	H	2,4,6-triF-Benzila
I-15	H	2,3,5-triF-Benzila
I-16	H	2,4,5-triF-Benzila
I-17	H	2,3,6-triF-Benzila
I-18	H	3,4,5-triF-Benzila
I-19	H	2,3,4-triF-Benzila
I-20	COCHF ₂	ciclopropilametila
I-21	COCHF ₂	ciclobutilametila
I-22	COCHF ₂	ciclopentilametila
I-23	COCHF ₂	ciclohexilametila
I-24	COCHF ₂	cicloheptilametila
I-25	COCHF ₂	ciclohexila
I-26	COCHF ₂	2-F-Benzila
I-27	COCHF ₂	3-F-Benzila
I-28	COCHF ₂	4-F-Benzila
I-29	COCHF ₂	2,3-diF-Benzila
I-30	COCHF ₂	2,4-diF-Benzila
I-31	COCHF ₂	2,5-diF-Benzila
I-32	COCHF ₂	2,6-diF-Benzila
I-33	COCHF ₂	2,4,6-triF-Benzila
I-34	COCHF ₂	2,3,5-triF-Benzila
I-35	COCHF ₂	2,4,5-triF-Benzila
I-36	COCHF ₂	2,3,6-triF-Benzila
I-37	COCHF ₂	3,4,5-triF-Benzila

I-38	COCHF ₂	2,3,4-triF-Benzila
I-39	COCF ₃	ciclopropilametila
I-40	COCF ₃	ciclobutilametila
I-41	COCF ₃	ciclopentilametila
I-42	COCF ₃	ciclohexilametila
I-43	COCF ₃	cicloheptilametila
I-44	COCF ₃	ciclohexila
I-45	COCF ₃	2-F-Benzila
I-46	COCF ₃	3-F-Benzila
I-47	COCF ₃	4-F-Benzila
I-48	COCF ₃	2,3-diF-Benzila
I-49	COCF ₃	2,4-diF-Benzila
I-50	COCF ₃	2,5-diF-Benzila
I-51	COCF ₃	2,6-diF-Benzila
I-52	COCF ₃	2,4,6-triF-Benzila
I-53	COCF ₃	2,3,5-triF-Benzila
I-54	COCF ₃	2,4,5-triF-Benzila
I-55	COCF ₃	2,3,6-triF-Benzila
I-56	COCF ₃	3,4,5-triF-Benzila
I-57	COCF ₃	2,3,4-triF-Benzila
I-58	COCF ₂ CF ₃	ciclopropilametila
I-59	COCF ₂ CF ₃	ciclobutilametila
I-60	COCF ₂ CF ₃	ciclopentilametila
I-61	COCF ₂ CF ₃	ciclohexilametila
I-62	COCF ₂ CF ₃	cicloheptilametila
I-63	COCF ₂ CF ₃	ciclohexila
I-64	COCF ₂ CF ₃	2-F-Benzila
I-65	COCF ₂ CF ₃	3-F-Benzila
I-66	COCF ₂ CF ₃	4-F-Benzila
I-67	COCF ₂ CF ₃	2,3-diF-Benzila
I-68	COCF ₂ CF ₃	2,4-diF-Benzila
I-69	COCF ₂ CF ₃	2,5-diF-Benzila
I-70	COCF ₂ CF ₃	2,6-diF-Benzila
I-71	COCF ₂ CF ₃	2,4,6-triF-Benzila

I-72	COCF ₂ CF ₃	2,3,5-triF-Benzila
I-73	COCF ₂ CF ₃	2,4,5-triF-Benzila
I-74	COCF ₂ CF ₃	2,3,6-triF-Benzila
I-75	COCF ₂ CF ₃	3,4,5-triF-Benzila
I-76	COCF ₂ CF ₃	2,3,4-triF-Benzila
I-77	COCH ₂ CH ₃	ciclopropilametila
I-78	COCH ₂ CH ₃	ciclobutilametila
I-79	COCH ₂ CH ₃	ciclopentilametila
I-80	COCH ₂ CH ₃	ciclohexilametila
I-81	COCH ₂ CH ₃	cicloheptilametila
I-82	COCH ₂ CH ₃	ciclohexila
I-83	COCH ₂ CH ₃	2-F-Benzila
I-84	COCH ₂ CH ₃	3-F-Benzila
I-85	COCH ₂ CH ₃	4-F-Benzila
I-86	COCH ₂ CH ₃	2,3-diF-Benzila
I-87	COCH ₂ CH ₃	2,4-diF-Benzila
I-88	COCH ₂ CH ₃	2,5-diF-Benzila
I-89	COCH ₂ CH ₃	2,6-diF-Benzila
I-90	COCH ₂ CH ₃	2,4,6-triF-Benzila
I-91	COCH ₂ CH ₃	2,3,5-triF-Benzila
I-92	COCH ₂ CH ₃	2,4,5-triF-Benzila
I-93	COCH ₂ CH ₃	2,3,6-triF-Benzila
I-94	COCH ₂ CH ₃	3,4,5-triF-Benzila
I-95	COCH ₂ CH ₃	2,3,4-triF-Benzila
I-96	COOC(CH ₃) ₃	ciclohexilametila

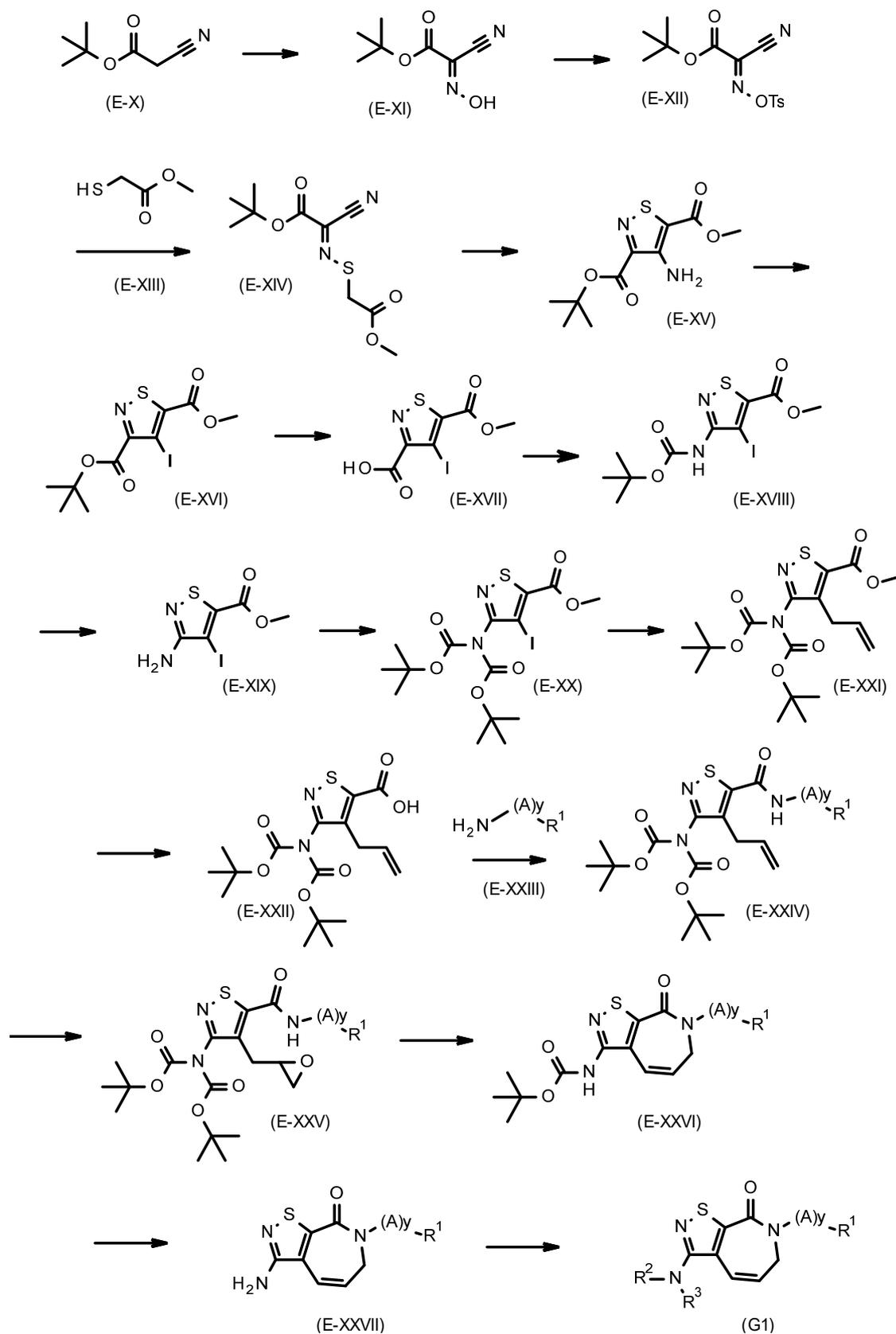
[86] Preferivelmente, um ou mais compostos da fórmula (G1), cada um como definido acima, e seus sais, são utilizados no contexto da presente invenção como herbicidas e/ou reguladores de crescimento de plantas, preferivelmente em culturas de plantas úteis e/ou plantas ornamentais, em que os elementos estruturais nas fórmulas (G1) têm cada um, independentemente um do outro, o significado definido em uma das modalidades preferidas ou particularmente preferidas.

[87] Além disso, um ou mais compostos das fórmulas (G1), cada um como definido acima, e seus sais, podem ser usados para controlar fungos nocivos fitopatogênicos.

[88] Além disso, a invenção se refere a um método para controle curativo ou preventivo dos fungos fitopatogênicos de plantas ou culturas.

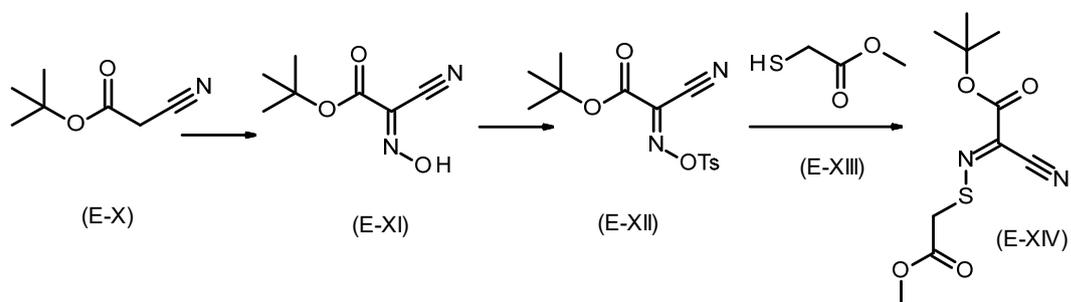
[89] A presente invenção também fornece processos para a preparação dos compostos das fórmulas gerais (G1) e/ou seus sais. Isso inclui processos que podem ser realizados de forma análoga a métodos conhecidos.

[90] Os compostos de acordo com a invenção podem ser obtidos usando diferentes rotas sintéticas mostradas nos seguintes Esquemas 1 a 6.



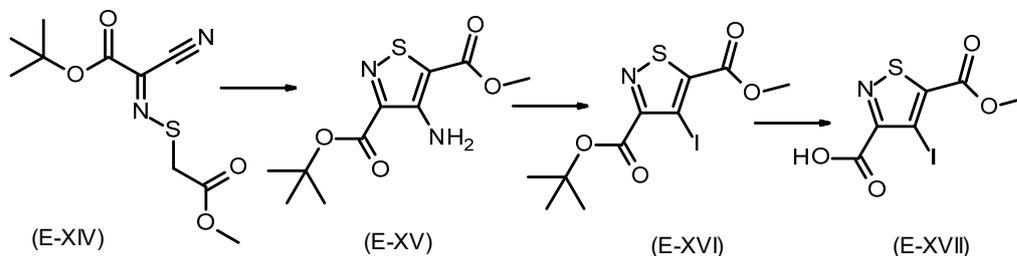
[91] Esquema 1: Visão geral da síntese para (G1)

[92] O composto (E-XIV) necessário para a ciclização pode ser prontamente preparado em três etapas a partir do éster cianoacético (E-X) (Esquema 2). Para esse fim, (E-X) reage inicialmente com NaNO_2 em ácido acético aquoso, que forma a oxima (E-XI), que pode ser convertida em uma segunda etapa no para-tolilsulfonato (E-XII). Para este fim, (E-XI) é agitado com um reagente de sulfonilação adequado, por exemplo, cloreto de para-tolilsulfonila e uma base orgânica, por exemplo piridina



[93] Esquema 2

[94] O tosionato resultante (E-XII) é reagido na terceira etapa com o tioglicolato (E-XIII), formando uma ligação N-S, para produzir o precursor da ciclização (E-XIV). Essa reação geralmente ocorre em um solvente orgânico comumente usado como o etanol, com o auxílio de uma base orgânica como a piridina (Esquema 2)



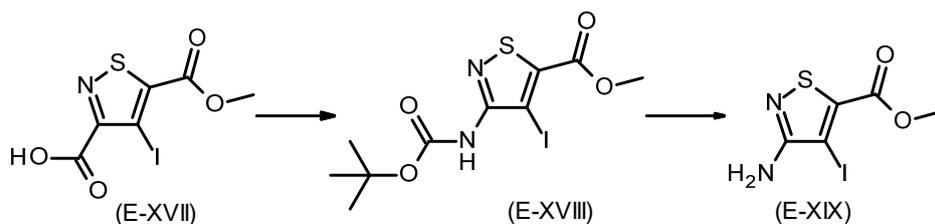
[95] Esquema 3

[96] O composto amina (E-XV) pode ser sintetizado a partir do composto (E-XIV) por ciclização, tratando-o primeiramente com uma base fraca, por exemplo, trietilamina

ou outras bases orgânicas e diretamente depois com HCl etanólico (Esquema 3).

[97] O éster (E-XVI) pode ser obtido do composto amino (E-XV) pela reação de Sandmeyer ou reações relacionadas. Por exemplo, (E-XV) pode ser feito reagir, por exemplo, com um nitrito de alquila, como nitrito de isoamila e iodo em um solvente inerte, como acetonitrila, a temperaturas entre 20 ° C e 150 ° C.

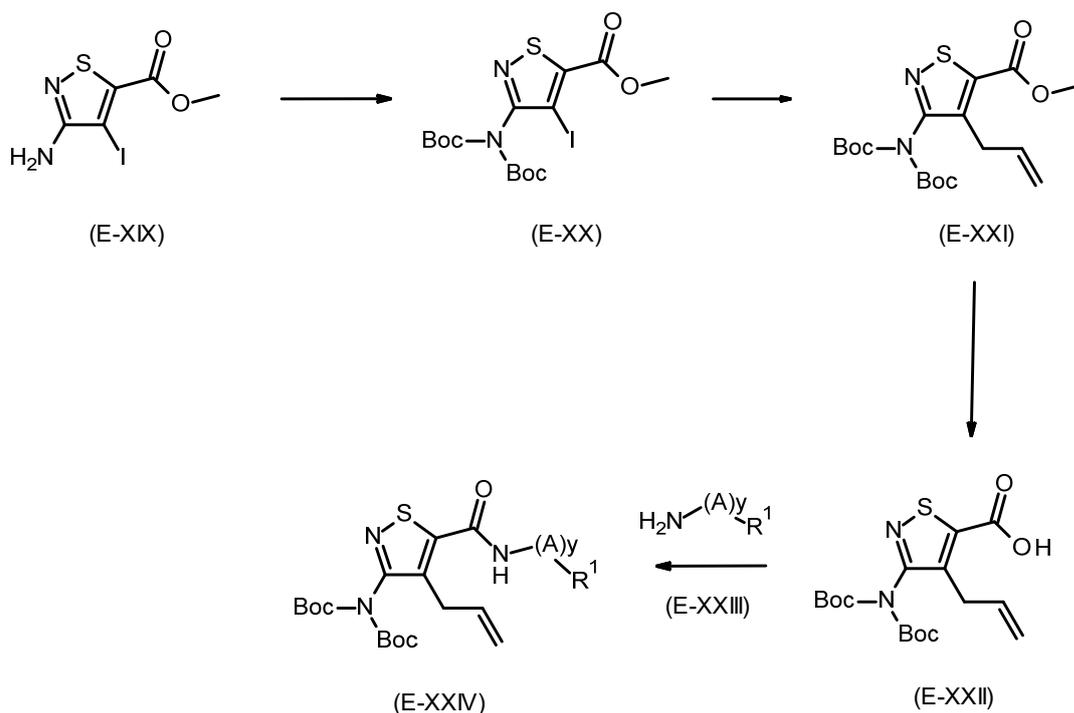
[98] O ácido (E-XVII) pode ser obtido, por exemplo, a partir do butil éster terciário (E-XVI) pela ação do ácido, como, por exemplo, ácido trifluoroacético (TFA) ou ácido mineral diluído na presença de trietilsilano (Esquema 3).



[99] Esquema 4

[100] O composto (E-XVIII) pode ser obtido, por exemplo, a partir do ácido (E-XVII) por degradação de Hoffman, rearranjo de Curtius ou Schmidt ou por uma reação relacionada, em que o carbamato de butila terciário, que é facilmente isolável, é obtido diretamente usando um procedimento de reação adequado (t-BuOH como solvente ou constituinte de solvente), preferivelmente na presença de t-BuOH, T3P (anidrido propilfosfônico), trimetilsilil azida e NEt₃ em um solvente como THF (tetra-hidrofurano) a temperaturas elevadas (tipicamente 70 ° C) (Esquema 4).

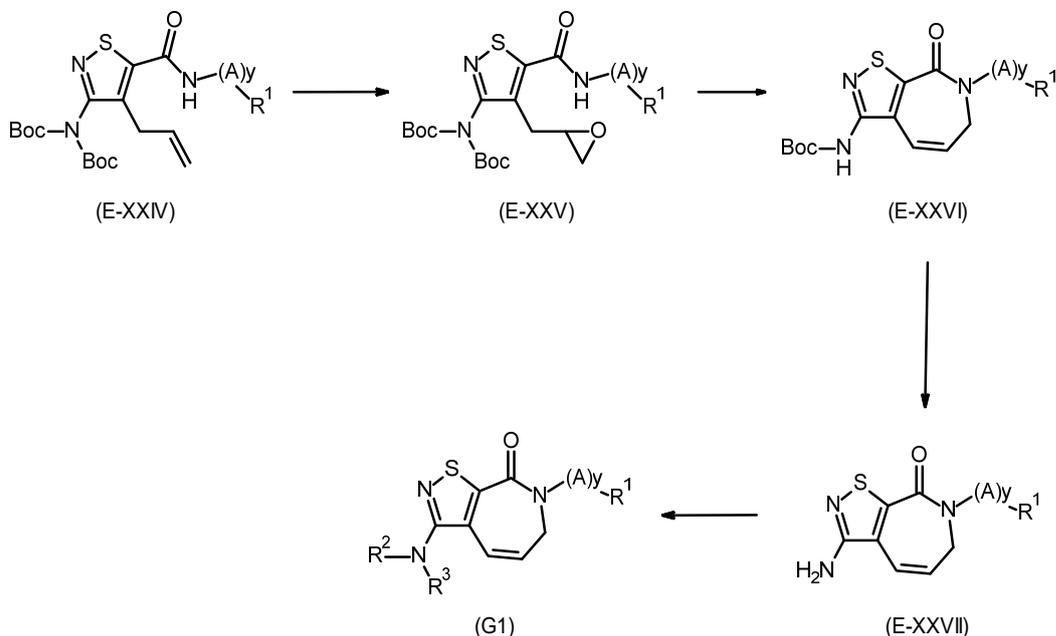
[101] Este carbamato de butila terciário (E-XVIII) pode ser clivado na amina livre (E-XIX) por tratamento com ácido, como, por exemplo, ácido trifluoroacético ou ácido mineral diluído.



[102] Esquema 5

[103] Os compostos da fórmula (E-XXIV) são formados a partir de compostos da fórmula (E-XIX) (Esquema 5). (E-XIX) é inicialmente protegido como um bis-carbamato usando anidrido de tertbutoxicarbonila na presença de uma base como NEt₃ no DCM ou acetonitrila. O grupo alila de (E-XXI) pode ser introduzido a partir de (E-XX) e realizando uma troca de halogênio e magnésio na presença de cloreto de isopropilmagnésio cloreto de lítio a -70 ° C em THF (tetra-hidrofurano) seguido pela adição de CuCN * 2LiCl (Chem. Eur J. 2009, 15, 1468) e brometo de alila com temperaturas variando entre -70 ° C e -30 ° C. O ácido (E-XXII) está disponível no éster correspondente (E-XXI) por clivagem básica de éster, por exemplo, com o auxílio de bases inorgânicas como NaOH ou LiOH ou outras bases em solventes aquosos ou misturas de solventes como MeOH e THF (tetra-hidrofurano). O intermediário (E-XXIV) pode ser obtido a partir do ácido correspondente (E-XXII) pelas reações comuns de amidação com aminas adequadas (E-XXIII), preferivelmente

na presença de T3P (anidrido propilfosfônico) e NEt₃ em um solvente como THF.



[104] Esquema 6

[105] O precursor de ciclização desejado (E-XXV) pode então ser obtido por meio de uma formação de epóxido usando *m*-CPBA (ácido metacloroperbenzóico) no DCM a temperaturas variando de 0 ° C e temperatura ambiente. A ciclização desejada de (E-XXV) a (E-XXVI) é alcançada com um excesso (> 2 equivalentes) de uma base forte como hidreto de sódio em THF com temperaturas variando entre 0 ° C e a temperatura ambiente. A desprotecção de carbamato na presença de ácido trifluoroacético em DCM à temperatura ambiente produziu o composto da fórmula (E-XXVII). Na etapa final, os substituintes na amina - R² e/ou R³ - são instalados usando reações conhecidas adequadas para a conversão de grupos amina livres em grupos amina correspondentemente substituídos. Por exemplo, são obtidas conversões adequadas com os correspondentes halogenetos de acila, anidridos ácidos ou similares, preferivelmente cloretos de acila R²COCl e/ou R³COCl, ou anidridos (R²CO)₂O, (R³CO)₂O e/ou R²CO(O)OCR³ usando

uma amina como NEt_3 , preferivelmente na presença de DMAP (4-dimetilaminopiridina) em um solvente adequado como DCM à temperatura ambiente e produzindo (G1).

[106] Os compostos (EX), (E-XI), (E-XII), (E-XIII), (E-XIV), (E-XV), (E-XVI), (E-XVII), (E-XVIII), (E-XIX), (E-XX) e (E-XXIII) são conhecidos e foram descritos no estado da técnica. Além disso, as rotas sintéticas para obtenção (E-XIX) foram descritas nos documentos WO 2016/102435 e WO 2016/102420.

[107] Dependendo do tipo de reação e das condições de reação usadas, o versado selecionará solventes orgânicos adequados, tais como:

- hidrocarbonetos alifáticos, como pentano, hexano, ciclo-hexano ou éter de petróleo;
- hidrocarbonetos aromáticos, como tolueno, o, m ou p-xileno,
- hidrocarbonetos halogenados, como cloreto de metileno, clorofórmio ou clorobenzeno,
- éteres, como dietil éter, diisopropil éter, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol e tetra-hidrofurano (THF),
- nitrilas como acetonitrila ou propionitrila,
- cetonas como acetona, metiletilcetona, dietilcetona e terc-butilmetilcetona,
- álcoois como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol e terc-butanol, e também
- dimetilsulfóxido, dimetilformamida, dimetilacetamida, sulfolano,
- misturas dos solventes orgânicos mencionados.

[108] Se os compostos descritos no contexto da presente invenção, em particular os intermediários e compostos da fórmula (G1) da presente invenção, forem obtidos

como sólidos, a purificação também poderá ser realizada por recristalização ou digestão.

[109] Os seguintes ácidos são geralmente adequados para a preparação dos sais de adição de ácido dos compostos da fórmula (G1): ácidos hidro-halogênicos, como ácido clorídrico ou ácido bromídrico, além disso, ácido fosfórico, ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácidos carboxílicos mono- ou bifuncionais e ácidos hidroxicarboxílicos, tais como ácido acético, ácido maleico, ácido succínico, ácido fumárico, ácido tartárico, ácido cítrico, ácido salicílico, ácido sórbico ou ácido láctico e também ácidos sulfônicos, tais como ácido p-toluenossulfônico e ácido 1,5-naftalenodissulfônico. Os compostos de adição de ácido da fórmula (G1) podem ser obtidos de maneira simples pelos métodos usuais para a formação de sais, por exemplo, dissolvendo um composto da fórmula (G1) em um solvente orgânico adequado, como, por exemplo, metanol, acetona, cloreto de metileno ou benzeno e adição de ácido a temperaturas de 0 a 100 ° C, e eles podem ser isolados de uma maneira conhecida, por exemplo, por filtração e, se apropriado, purificados por lavagem com um solvente orgânico inerte.

[110] Os sais de adição de base dos compostos da fórmula (G1) são preferivelmente preparados em solventes polares inertes, como, por exemplo, água, metanol ou acetona, a temperaturas de 0 a 100 ° C. Exemplos de bases que são adequadas para a preparação dos sais de acordo com a invenção são carbonatos de metais alcalinos, como carbonato de potássio, hidróxidos de metais alcalinos e hidróxidos de metais alcalino-terrosos, por exemplo NaOH ou KOH, hidretos de metais alcalinos e hidretos de metais alcalino-terrosos, por exemplo NaH, alcóxidos de metais alcalinos e alcóxidos de metais alcalino-terrosos, por exemplo metóxido de sódio ou

terc-butóxido de potássio ou amônia, etanolamina ou hidróxido de amônio quaternário.

[111]O que se entende por "solventes inertes" referidos nas variantes de processo acima são, respectivamente, solventes que são inertes nas respectivas condições de reação.

[112]Os compostos da fórmula (G1) usados no contexto da presente invenção ou de acordo com a invenção (e/ou seus sais) têm excelente eficácia herbicida contra um amplo espectro de plantas nocivas anuais monocotiledôneas e dicotiledôneas economicamente importantes. Os compostos ativos da fórmula (G1) também proporcionam um bom controle sobre plantas nocivas perenes que são difíceis de controlar e produzem brotos de rizomas, colmos e raízes ou outros órgãos perenes.

[113]A presente invenção também se refere a um método para controlar plantas indesejadas ou para regular o crescimento de plantas, preferivelmente em culturas de plantas, em que um ou mais compostos de acordo com a invenção é / são aplicados às plantas (por exemplo, plantas nocivas, como ervas daninhas monocotiledôneas ou dicotiledôneas ou plantas indesejadas), às sementes (por exemplo, grãos, sementes ou propágulos vegetativos, tais como tubérculos ou partes brotadas com brotos), ao solo no qual as plantas crescem (por exemplo, o solo de terras cultivadas ou não cultivadas) ou a área em que as plantas crescem (por exemplo, a área cultivada).

[114]Assim, em um aspecto adicional, a presente invenção refere-se a um método para controlar plantas prejudiciais ou para regular o crescimento de plantas, caracterizado por uma quantidade eficaz de

[115]- um ou mais compostos da fórmula (G1) e/ou seus sais, conforme definido acima, preferivelmente em uma

das modalidades preferidas, mais preferidas ou particularmente preferidas,

[116] ou

[117]- uma composição reguladora do crescimento de plantas herbicidas e/ou, como definido a seguir, compreendendo um ou mais compostos da fórmula (G1) e/ou seus sais, como aqui definido acima, preferivelmente em uma das modalidades preferidas, mais preferidas ou particularmente preferidas,

[118] é aplicado às plantas, sementes de plantas, ao sol, no qual as plantas crescem ou a área de cultura.

[119] Os compostos de acordo com a invenção podem ser implantados, por exemplo, antes da semeadura (se apropriado também por incorporação no solo), antes da emergência ou após a emergência. Exemplos específicos podem ser mencionados de alguns representantes da flora de ervas daninhas monocotiledôneas e dicotiledôneas que podem ser controladas pelos compostos de acordo com a invenção, sem que a enumeração seja restrita a certas espécies.

[120] Plantas prejudiciais monocotiledôneas dos gêneros: *Aegilops*, *Agropyron*, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Commelina*, *Cynodon*, *Cyperus*, *Dactyloctenium*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleocharis*, *Eleusine*, *Eragrostis*, *Eriochloa*, *Festuca*, *Fimbristylis*, *Heteranthera*, *Imperata*, *Ischaemum*, *Leptochloa*, *Lolium*, *Monochoria*, *Panicum*, *Paspalum*, *Phalaris*, *Phleum*, *Poa*, *Rottboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria*, *Sorghum*.

[121] Ervas daninhas dicotiledôneas dos gêneros: *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Anoda*, *Anthemis*, *Aphanes*, *Artemisia*, *Atriplex*, *Bellis*, *Bidens*, *Capsella*, *Carduus*, *Cassia*, *Centaurea*, *Chenopodium*, *Cirsium*, *Convolvulus*, *Datura*, *Desmodium*, *Emex*, *Erysimum*, *Euphorbia*, *Galeopsis*, *Galinsoga*, *Galium*, *Hibiscus*, *Ipomoea*, *Kochia*, *Lamium*, *Lepidium*,

Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

[122] Os compostos da fórmula (G1) a serem utilizados de acordo com a invenção ou os compostos da fórmula (G1) de acordo com a invenção e/ou seus sais foram considerados altamente eficazes no controle de plantas nocivas, tais como *Alopecurus myosuroides*, *Avena fatua*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Matricaria inodora* (= *Tripleurospermum maritimum* subsp. *inodorum*), *Pharbitis purpurea*, *Polygonum convolvulus* (= *Fallopia convolvulus*), *Stellaria media*, *Viola tricolor*, e *Veronica persica*.

[123] Quando os compostos da fórmula (G1) de acordo com a invenção são aplicados à superfície do solo antes da germinação, as mudas de ervas daninhas são completamente impedidas de emergir ou as ervas daninhas crescem até atingirem o estágio do cotilédone, mas depois param de crescer, e, eventualmente, depois de três a quatro semanas, morrem completamente.

[124] Se os compostos da fórmula (G1) forem aplicados após a emergência nas partes verdes das plantas, o crescimento será interrompido após o tratamento e as plantas nocivas permanecem no estágio de crescimento do momento da aplicação ou morrem completamente após certo tempo, de modo que a competição pelas ervas daninhas, prejudicial às plantas cultivadas, seja assim eliminada muito cedo e de maneira duradoura.

[125]Embora os compostos de acordo com a invenção exibam uma excelente atividade herbicida contra ervas daninhas monocotiledôneas e dicotiledôneas, plantas de culturas economicamente importantes, por exemplo, culturas dicotiledôneas dos gêneros *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*, *Helianthus*, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*, *Miscanthus*, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia*, ou monocotiledôneas dos gêneros *Allium*, *Ananas*, *Asparagus*, *Avena*, *Hordeum*, *Oryza*, *Panicum*, *Saccharum*, *Secale*, *Sorghum*, *Triticale*, *Triticum*, *Zea*, em particular *Zea* e *Triticum*, são danificadas apenas em uma extensão insignificante, ou não são danificadas, dependendo da estrutura do respectivo composto de acordo com a invenção e sua taxa de aplicação. Por essas razões, os presentes compostos são muito adequados para o controle seletivo do crescimento de plantas indesejadas em plantas, tais como plantas agricolamente úteis ou plantas ornamentais.

[126]Além disso, verificou-se que os compostos da fórmula (G1) a serem utilizados de acordo com a invenção ou os compostos da fórmula (G1) de acordo com a invenção e/ou seus sais mostram ação de emergência e pós-emergência excelente ou muito boa, e particularmente seletivamente em certas culturas, em especial em colza, soja, algodão e cereais (e aqui em especial em milho, cevada, trigo, centeio, aveia, triticale, variedades de milho, arroz).

[127]Além disso, os compostos de acordo com a invenção (dependendo de sua estrutura específica e taxa de aplicação) têm excelentes propriedades reguladoras do crescimento em plantas de cultura. Eles intervêm para regular o metabolismo da planta e, portanto, podem ser usados para influenciar controladamente os constituintes da planta e para facilitar a colheita, por exemplo, desencadeando a dessecação e o crescimento atrofiado. Além disso, eles também são

adequados para controlar e inibir geralmente o crescimento vegetativo indesejado sem destruir as plantas no processo. A inibição do crescimento vegetativo desempenha um papel importante em muitas culturas monocotiledôneas e dicotiledôneas, já que, por exemplo, o acamamento pode ser reduzido ou impedido completamente.

[128] Em virtude de suas propriedades herbicidas reguladoras do crescimento de plantas, os compostos ativos da fórmula (G1) também podem ser utilizados para o controle de plantas nocivas em culturas de plantas geneticamente modificadas ou plantas modificadas por mutagênese convencional. Em geral, as plantas transgênicas são notáveis por propriedades vantajosas especiais, por exemplo, por resistências a certos pesticidas, em particular certos herbicidas, resistências a doenças ou organismos vegetais que causam doenças de plantas, como certos insetos ou microorganismos, tais como fungos, bactérias ou vírus. Outras características específicas estão relacionadas, por exemplo, ao material colhido em relação à quantidade, qualidade, armazenabilidade, composição e constituintes específicos. Assim, são conhecidas plantas transgênicas cujo teor de amido é aumentado ou cuja qualidade de amido é alterada ou aquelas em que o material colhido possui uma composição diferente de ácidos graxos.

[129] É preferível, com vistas às culturas transgênicas, usar os compostos de acordo com a invenção e/ou seus sais em culturas transgênicas economicamente importantes de plantas e plantas ornamentais úteis, por exemplo, cereais como trigo, cevada, centeio, aveia, painço, arroz e milho ou outras culturas de beterraba sacarina, algodão, soja, colza, batata, tomate, ervilha e outros vegetais.

[130] É preferível empregar os compostos de acordo com a invenção como herbicidas em culturas de plantas úteis

que são resistentes, ou que foram tornadas resistentes por meios recombinantes, aos efeitos fitotóxicos dos herbicidas.

[131] Em virtude de suas propriedades reguladoras do crescimento de plantas e/ou herbicidas, os compostos ativos da fórmula (G1) também podem ser empregados para controlar plantas nocivas em culturas de plantas geneticamente modificadas conhecidas ou plantas geneticamente modificadas ainda a serem desenvolvidas. Em geral, as plantas transgênicas são distinguidas por propriedades especialmente vantajosas, por exemplo, por resistências a certos pesticidas, principalmente certos herbicidas, resistências a doenças de plantas ou organismos causadores de doenças de plantas, tais como certos insetos ou microorganismos, tais como fungos, bactérias ou vírus. Outras características específicas estão relacionadas, por exemplo, ao material colhido em relação à quantidade, qualidade, armazenabilidade, composição e constituintes específicos. Assim, são conhecidas plantas transgênicas, cujo teor de amido é aumentado ou cuja qualidade de amido é alterada ou aquelas em que o material colhido possui uma composição diferente de ácidos graxos. Outras propriedades particulares podem ser tolerância ou resistência a estressores abióticos, por exemplo, calor, baixas temperaturas, seca, salinidade e radiação ultravioleta.

[132] É preferível usar os compostos da fórmula (G1) de acordo com a invenção e/ou seus sais em culturas transgênicas economicamente importantes de plantas úteis e plantas ornamentais, por exemplo, cereais, tais como trigo, cevada, centeio, aveia, sorgo e painço, arroz, mandioca e milho ou outras culturas de beterraba sacarina, algodão, soja, colza, batata, tomate, ervilha e outros vegetais.

[133] É preferido empregar os compostos da fórmula (G1) de acordo com a invenção, tais como herbicidas em

culturas de plantas úteis que são resistentes, ou que foram tornadas resistentes por meios recombinantes, aos efeitos fitotóxicos dos herbicidas.

[134]Ao empregar os compostos ativos da fórmula (G1) de acordo com a invenção em culturas transgênicas, não apenas ocorrem os efeitos sobre as plantas prejudiciais observados em outras culturas, mas frequentemente também efeitos, que são específicos à aplicação em determinada cultura transgênica, por exemplo, um espectro alterado ou especificamente aumentado de ervas daninhas que podem ser controladas, taxas de aplicação alteradas que podem ser usadas para a aplicação, preferivelmente a combinabilidade com os herbicidas, aos quais a colheita transgênica é resistente e influenciando o crescimento e o rendimento da plantas transgênicas.

[135]Portanto, a invenção também se refere ao uso dos compostos da fórmula (G1) de acordo com a invenção e/ou seus sais como herbicidas para controlar plantas nocivas em plantas de cultura ou plantas úteis, opcionalmente em plantas transgênicas.

[136]É dada preferência à utilização pelo método pré ou pós-emergência em cereais, tais como trigo, cevada, centeio, aveia, milho e arroz, em especial no trigo pelo método pós-emergência.

[137]Também é dada preferência ao uso pelo método pré ou pós-emergência no milho, em particular pelo método pré-emergência no milho.

[138]Também é dada preferência ao uso pelo método de pré ou pós-emergência na soja, em particular pelo método de pós-emergência na soja.

[139]O uso de acordo com a invenção para o controle de plantas nocivas ou para a regulação do crescimento de plantas também inclui o caso em que o composto ativo da

fórmula (G1) ou seu sal não é formado a partir de uma substância precursora ("pró-fármaco") até após a aplicação sobre a planta, na planta ou no solo.

[140] A invenção também fornece o método (método de aplicação) para controlar plantas prejudiciais ou para regular o crescimento de plantas, que compreende a aplicação de uma quantidade eficaz de um ou mais compostos da fórmula (G1) e/ou seus sais nas plantas (plantas prejudiciais, se apropriado juntamente com as plantas úteis), sementes de plantas, no solo, no qual ou sobre o qual as plantas crescem ou a área de cultivo.

[141] Os compostos da fórmula (G1) de acordo com a invenção podem ser utilizados na forma de pós molháveis, concentrados emulsificáveis, soluções em spray, produtos para pulverização ou grânulos nas formulações habituais. Portanto, a invenção também fornece composições reguladoras de crescimento de plantas e/ou herbicidas que compreendem compostos da fórmula (G1) e/ou seus sais.

[142] Assim, em um aspecto adicional, a presente invenção se refere a uma composição reguladora de crescimento de plantas herbicidas e/ou, caracterizada por a referida composição compreender um ou mais compostos da fórmula (G1) e/ou seus sais, conforme definido acima, preferivelmente em uma das modalidades preferidas, mais preferidas ou particularmente preferidas,

[143] e uma ou mais substâncias adicionais selecionadas a partir de grupos (i) e/ou (ii):

[144] (i) uma ou mais outras substâncias agroquimicamente ativas, preferivelmente selecionadas a partir do grupo consistindo em inseticidas, acaricidas, nematocidas, outros herbicidas, fungicidas, protetores, fertilizantes e/ou outros reguladores de crescimento,

[145] (ii) um ou mais auxiliares de formulação habituais em proteção de culturas.

[146] Os compostos da fórmula (G1) e/ou seus sais podem ser formulados de várias maneiras, segundo os quais são necessários parâmetros físico-químicos e/ou biológicos. As formulações possíveis incluem, por exemplo: pós molháveis (WP), pós solúveis em água (SP), concentrados solúveis em água, concentrados emulsionáveis (EC), emulsões (EW), tais como emulsões óleo-em-água e água-em-óleo, soluções pulverizáveis, concentrados de suspensão (SC), dispersões à base de óleo ou água, soluções miscíveis em óleo, suspensões de cápsulas (CS), produtos de pulverização (DP), produtos para tratamento de sementes, grânulos para difusão e aplicação no solo, grânulos (GR) sob a forma de microgrânulos, grânulos pulverizáveis, grânulos revestidos e grânulos de adsorção, grânulos dispersáveis em água (WG), grânulos solúveis em água (SG), formulações ULV, microcápsulas e ceras.

[147] Esses tipos de formulações individuais são conhecidos em princípio e são descritos, por exemplo, em: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical technology], volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th ed. 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

[148] Os auxiliares de formulação necessários, tais como materiais inertes, surfactantes, solventes e outros aditivos são igualmente conhecidos e são descritos, por exemplo, em: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and

Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Enciclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Interface-active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th ed. 1986.

[149] Pós molháveis são preparações que podem ser dispersas uniformemente em água e, além do composto ativo, além de um diluente ou substância inerte, também compreendem tensioativos do tipo iônico e/ou não iônico (agentes molháveis, dispersantes), para exemplo alquilfenóis polioxietilados, álcoois graxos polioxietilados, aminas graxas polioxietiladas, sulfato de poliglicol éter de álcool graxo, alcanosulfonatos, alquilbenzenossulfonatos, lignossulfonato de sódio, 2,2 'dinafiltimetano-6,6'-dissulfonato de sódio, dibutilfenato de sódio ou dibutulfonato de sódio, dibutilfenato de sódio ou dibutilfenato de sódio. Para preparar os pós molháveis, os compostos herbicidas ativos são moídos finamente, por exemplo, em aparelhos usuais, tais como moinhos de martelo, sopradores e moinhos de jato de ar, e simultaneamente ou posteriormente misturados com os assistentes de formulação.

[150] Os concentrados emulsificáveis são produzidos dissolvendo o composto ativo em um solvente orgânico, por exemplo butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno ou então aromáticos ou hidrocarbonetos ou misturas dos solventes orgânicos com alto ponto de ebulição, com a adição de um ou mais tensioativos do tipo iônico e/ou não iônico (emulsificantes). Os emulsificantes utilizados podem, por exemplo, ser: sais alquilarilsulfônicos de cálcio, tais como dodecilbenzenossulfonato de cálcio, ou emulsificantes não iônicos, tais como poliglicol ésteres de ácidos graxos,

alquilarilpoliglicol éteres, poliglicol éteres de álcool graxo, produtos de condensação de óxido de propileno-óxido de etileno, produtos de condensação de polietilalquil ésteres, tais como, por exemplo, ésteres de ácido graxo de sorbitano, ésteres de polioxietileno sorbitano ou, por exemplo, ésteres de ácidos graxos de polioxietileno sorbitano.

[151] Os produtos para poeira são obtidos triturando o composto ativo com substâncias sólidas finamente distribuídas, por exemplo, talco, argilas naturais, como caulim, bentonita e pirofilita ou terra de diatomáceas.

[152] Os concentrados de suspensão podem ser à base de água ou de óleo. Eles podem ser produzidos, por exemplo, por moagem úmida por meio de moinhos comerciais de esferas com adição opcional de tensioativos, tais como já listado acima, por exemplo, para os outros tipos de formulação.

[153] Emulsões, por exemplo, emulsões de óleo-em-água (EW), podem ser preparadas, por exemplo, por meio de agitadores, moinhos de colóides e/ou misturadores estáticos usando solventes orgânicos aquosos e, se apropriado, tensioativos, como por exemplo já foram listados acima em conexão com outros tipos de formulação.

[154] Os grânulos podem ser produzidos pulverizando o composto ativo em material inerte granulado por adsorção ou aplicando concentrados ativos por meio de adesivos, por exemplo, álcool polivinílico, poliacrilato de sódio ou óleos minerais, na superfície de substâncias portadoras, tais como areia, caulinitas ou de material inerte granulado. Os compostos ativos adequados também podem ser granulados da maneira habitual para a produção de grânulos de fertilizantes - se desejado como uma mistura com fertilizantes.

[155] Os grânulos dispersáveis em água são produzidos geralmente pelos processos habituais, tais como secagem por pulverização, granulação em leito fluidizado,

granulação em pan, mistura com misturadores de alta velocidade e extrusão sem material inerte sólido.

[156] Para a produção de grânulos de panela, grânulos de leite fluidizado, grânulos extrusores e grânulos de spray, consulte, por exemplo, processos em "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, páginas 147 ff.; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8-57.

[157] Para mais detalhes sobre a formulação de protetores de culturas, ver, por exemplo, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, páginas 81-96 and J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

[158] As formulações agroquímicas compreendem geralmente de 0,1 a 99% em peso, em particular de 0,1 a 95% em peso, de composto ativo da fórmula (G1) e/ou seus sais.

[159] Em pós molháveis, a concentração do composto ativo é, por exemplo, cerca de 10 a 90% em peso; o restante totalizando 100% em peso consiste nos constituintes habituais da formulação. No caso de concentrados emulsionáveis, a concentração do composto ativo pode ser de cerca de 1 a 90, preferivelmente de 5 a 80% em peso. As formulações do tipo pó contêm de 1 a 30% em peso de composto ativo, preferivelmente usualmente de 5 a 20% em peso de composto ativo; as soluções pulverizáveis contêm de cerca de 0,05 a 80% em peso, de preferência de 2 a 50% em peso de composto ativo. No caso de grânulos dispersáveis em água, o conteúdo do composto ativo depende em parte da presença do composto ativo na forma líquida ou sólida e da utilização de auxiliares de granulação, cargas, etc. Nos grânulos dispersáveis em água, o

conteúdo do composto ativo situa-se, por exemplo, entre 1 e 95% em peso, preferivelmente entre 10 e 80% em peso.

[160] Além disso, as formulações de compostos ativos mencionadas compreendem opcionalmente os respectivos agentes adesivos, agentes molháveis, dispersantes, emulsificantes, penetrantes, conservantes, agentes anticongelantes e solventes, cargas, veículos e corantes, antiespumantes, inibidores de evaporação e agentes que influenciam o pH e a viscosidade. Exemplos de auxiliares de formulação são descritos, entre outros, em "Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations", ed. D. A. Knowles, Kluwer Academic Publishers (1998).

[161] Os compostos da fórmula (G1) e/ou seus sais podem ser empregados como tal ou na forma de suas preparações (formulações) combinados com outros compostos pesticidas ativos, tais como, por exemplo, inseticidas, acaricidas, nematocidas, herbicidas, fungicidas, protetores, fertilizantes e/ou reguladores de crescimento, por exemplo, como formulação final ou como misturas de tanques. As formulações de combinação podem ser preparadas com base nas formulações acima mencionadas, tendo em conta as propriedades físicas e a estabilidade dos compostos ativos a serem combinados.

[162] As razões em peso de herbicida (mistura) para protetor dependem geralmente da taxa de aplicação de herbicida e da eficácia do protetor em questão e podem variar dentro de limites amplos, por exemplo, na faixa de 200: 1 a 1: 200, de preferência 100: 1 a 1: 100, em particular 20: 1 a 1:20. Analogamente aos compostos da fórmula (G1) ou suas misturas, os protetores podem ser formulados com outros herbicidas / pesticidas e podem ser fornecidos e empregados como uma formulação final ou mistura de tanque com os herbicidas.

[163] Para aplicação, os herbicidas ou as formulações de herbicida / protetor presentes na forma comercial são, se apropriado, diluídos da maneira habitual, por exemplo, no caso de pós molháveis, concentrados emulsionáveis, dispersões e grânulos dispersáveis em água com água. Preparações na forma de pós, grânulos para aplicação no solo ou grânulos para soluções de difusão e pulverização geralmente não são mais diluídas com outras substâncias inertes antes da aplicação.

[164] A taxa de aplicação dos compostos da fórmula (G1) e/ou seus sais pode variar dentro de limites amplos. Para a aplicação, tal como herbicida para controle de plantas nocivas, por exemplo, geralmente é adequada uma faixa de 0,001 a 10,0 kg / ha de substância ativa, preferivelmente os compostos da fórmula (G1) e/ou seus sais são aplicados na faixa de 0,005 a 5 kg / ha, em particular na faixa de 0,01 a 1 kg / ha. Isso se aplica tanto à aplicação pré-emergência quanto à pós-emergência.

[165] Quando usado como regulador de crescimento de plantas, por exemplo, como estabilizador de colmo para plantas de cultura, tais como as mencionadas acima, preferivelmente plantas de cereais, tais como trigo, cevada, centeio, triticale, milho, arroz ou milho, a taxa de aplicação dos compostos da fórmula (G1) e/ou seus sais se situam, por exemplo, na faixa de 0,001 a 2 kg / ha ou mais de substância ativa, preferivelmente na faixa de 0,005 a 1 kg / ha, em particular na faixa de 10 a 500 g / ha de substância ativa. Isso se aplica tanto à aplicação pelo método de pré-emergência quanto pelo método de pós-emergência, sendo geralmente preferido o tratamento pós-emergência.

[166] A aplicação como estabilizador de colmo pode ocorrer em vários estágios do crescimento das plantas. É

preferível, por exemplo, a aplicação após a fase de perfilhamento, no início do crescimento longitudinal.

[167] Como alternativa, a aplicação como regulador do crescimento das plantas também é possível tratando a semente, que inclui várias técnicas para adubação e revestimento da semente. Aqui, a taxa de aplicação depende das técnicas particulares e pode ser determinada em testes preliminares.

[168] Os componentes que podem ser utilizados em combinação com os compostos ativos de acordo com a invenção em formulações mistas ou em misturas de tanques são, por exemplo, compostos ativos conhecidos, tais como são descritos em, por exemplo, Weed Research 26, 441-445 (1986), ou "The Pesticide Manual", 16th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2006, e literatura aqui citada, e que por exemplo atuam como inibidores da acetolactato sintase, acetil-CoA-carboxilase, celulose-sintase, enolpiruvilshikimat-3-fosfato-sintase, glutamina-sintetase, p-hidroxifenil-piruvat-dioxigenase, fitoendesatase, fitoendesatase I, fotossistema II, e/ou protoporfirinogênio-oxidase.

[169] Exemplos de compostos ativos que podem ser mencionados como herbicidas ou reguladores de crescimento de plantas conhecidos na literatura e que podem ser combinados com os compostos de acordo com a invenção são os seguintes (compostos são descritos por "nome comum" de acordo com a Organização Internacional de Padronização (ISO) ou por nome químico ou por um número de código habitual) e sempre compreenda todas as formas aplicáveis, tais como ácidos, sais, ésteres ou modificações, como isômeros, tais como estereoisômeros e isômeros ópticos. Como exemplo, pelo menos uma forma aplicável e/ou modificações podem ser mencionadas.

[170] Exemplos de herbicidas são:

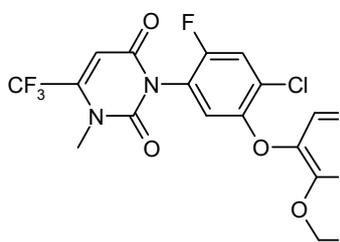
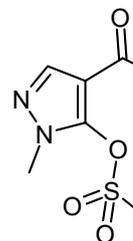
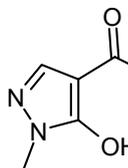
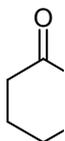
[171] Acetoclor, acifluorfen, acifluorfen-sódio, aclonifeno, alacloro, alidoclor, aloxidim, aloxidim sódio, ametrina, amicarbazona, amidoclor, amidosulfuron, ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metilfenil)-5-fluoropiridina-2-carboxílico, aminociclopiracloro, aminociclopiracloro-potássio, aminociclopiracloro-metila, aminopirialid, amitrol, sulfonato de amônio, anilofos, asulam, atrazina, azafenidin, benimsulfamon, benimsulfamon, benfluralina, benfuresato, bensulfuron, bensulfuron-metila, bensulida, bentazona, benzobiciclon, benzofenap, biciclopiron, bifenox, bilanafos, bilanafos-sódio, bispiribac, bispiribac-sódio, bromacila, bromobutato, bromofenoxila, bromofenoxila, bromofenoxila, bromofenoxila, e -octanoato, busoxinona, butacloro, butafenacila, butamifos, butenacloro, butralin, butroxidim, butilato, cafenstrol, carbetamida, carfentrazona, carfentrazona-etila, cloramben, clorbromuron, clorfenac, clorfenac-sódio, clorfenprop, clorflurenol, clorflurenol-metila, cloridazon, clorimuron, clorimuron-etila, clorophtalim, clorotoluron, clortal-dimetila, clorsulfuron, cinidon, cinidon-etila, cinmetilin, cinosulfuron, clacifos, cletodim, clodinafop, clodinafop-propargila, clomazona, clomeprop, clopiralid, cloransulam, cloransulam-metila, cumiluron, cianamida, cianazina, cicloato, ciclopirimorato, ciclosulfamuron, cicloxidim, cihalofop, cihalofop-butila, ciprazina, 2,4-D, 2,4-D-butotila, -butila, -dimetilamônio, -diolamin, -etila, -2-etilhexila, -isobutila, -isooctila, -isopropilamônio, -potássio, -triisopropanolamônio, e -trolamina, 2,4-DB, 2,4-DB-butila, -dimetilamônio, -isooctila, -potássio, e -sódio, daimuron (dimron), dalapon, dazomet, n-decanol, desmedipham, detosil-pirazolato (DTP), dicamba, diclobenila, 2-(2,4-diclorobenzil)-4,4-dimetil-1,2-oxazolidin-3-ona, 2-(2,5-diclorobenzil)-4,4-dimetil-1,2-oxazolidin-3-ona, diclorprop,

diclorprop-P, diclofop, diclofop-metila, diclofop-P-metila, diclosulam, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflufenzopir-sódio, dimefuron, dimepiperato, dimetaclor, dimetametrin, dimetenamid, dimetenamid-P, dimetrasulfuron, dinitramina, dinoterb, difenamid, diquate, dibrometo de diquate, ditiopir, diuron, DNOC, endotal, EPTC, esprocarb, etalfluralin, etametsulfuron, etametsulfuron-metila, etiozin, etofumesato, etoxifen, etoxifen-etila, etoxisulfuron, etobenzanid, F-9600, F-5231, ou seja N-{2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoropropil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-tetrazol-1-il]fenil}etanesulfonamida, F-7967, ou seja, 3-[7-cloro-5-fluoro-2-(trifluorometil)-1H-benzimidazol-4-il]-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidina-2,4(1H,3H)-diona, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etila, fenoxaprop-P-etila, fenoxasulfona, fenquinotriona, fentrazamida, flamprop, flamprop-M-isopropila, flamprop-M-metila, flazasulfuron, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butila, fluazifop-P-butila, flucarbazona, flucarbazona-sódio, flucetosulfuron, flucloralin, flufenacet, flufenpir, flufenpir-etila, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentila, flumioxazin, fluometuron, flurenol, flurenol-butila, -dimetilamônio e -metila, fluoroglicofen, fluoroglicofen-etila, flupropanato, flupirsulfuron, flupirsulfuron-metil-sódio, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, fluroxipir-meptila, flurtamona, flutiacet, flutiacet-metila, fomesafen, fomesafen-sódio, foramsulfuron, fosamina, glufosinato, glufosinato-amônio, glufosinato-P-sódio, glufosinato-P-amônio, glufosinato-P-sódio, glifosato, glifosato-amônio, -isopropilamônio, -diamônio, -dimetilamônio, -potássio, -sódio, e -trimésio, H-9201, ou seja O-(2,4-dimetil-6-nitrofenil) O-etil isopropilfosforamidotioato, halauxifen, halauxifen-metila, halosafen, halosulfuron, halosulfuron-metila, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-etoxietila,

haloxifop-P-etoxietila, haloxifop-metila, haloxifop-P-metila, hexazinona, HW-02, ou seja 1-(dimetoxifosforil) etil-(2,4-diclorofenoxi)acetato, imazametabenz, imazametabenz-metila, imazamox, imazamox-amônio, imazapic, imazapic-amônio, imazapir, imazapir-isopropilamônio, imazaquin, imazaquin-amônio, imazetapir, imazetapir-imônio, imazosulfuron, indanofan, indaziflam, iodosulfuron, iodosulfuron-metilsódio, ioxinila, ioxinil-octanoato, -potássio e -sódio, ipfencarbazona, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxaflutol, karbutilato, KUH-043, ou seja 3-([5-(difluorometil)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfonil)-5,5-dimetil-4,5-dihidro-1,2-oxazol, ketospiradox, lactofen, lenacila, linuron, MCPA, MCPA-butotila, -dimetilamônio, -2-etilhexila, -isopropilamônio, -potássio, e -sódio, MCPB, MCPB-metila, -etil- e -sódio, mecoprop, mecoprop-sódio, e -butotila, mecoprop-P, mecoprop-P-butotila, -dimetilamônio, -2-etilhexila, e -potássio, mefenacet, mefluidida, mesosulfuron, mesosulfuron-metila, mesotriona, metabenztiазuron, metam, metamifop, metamitron, metazaclor, metazosulfuron, metabenztiазuron, metiopirsulfuron, metiozolin, isotiocianato de metiula, metobromuron, metolaclor, S-metolaclor, metosulam, metoxuron, metribuzin, metsulfuron, metsulfuron-metila, molinat, monolinuron, monosulfuron, monosulfuron-éster, MT-5950, ou seja N-(3-cloro-4-isopropilfenil)-2-metilpentan amida, NGGC-011, napropamida, NC-310, ou seja [5-(benziloxi)-1-metil-1H-pirazol-4-il](2,4-diclorofenil)metanona, neburon, nicosulfuron, ácido nonanóico (ácido pelargônico), norflurazon, ácido oléico (ácidos graxos), orbencarb, ortosulfamuron, orizalin, oxadiargila, oxadiazon, oxasulfuron, oxaziclomefon, oxifluorfen, paraquate, dicloreto de paraquate, pebulato, pendimetalin, penoxsulam, pentaclorfenol, pentoxazona, petoxamid, óleos de petróleo, fenmedifam,

picloram, picolinafen, pinoxaden, piperofos, pretilaclor, primisulfuron, primisulfuron-metila, prodiamina, profoxidim, prometon, prometrin, propaclor, propanila, propaquizafof, propazina, profam, propisoclor, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sódio, propirisulfuron, propizamida, prosulfocarb, prosulfuron, piraclonila, piraflufen, piraflufen-etila, pirasulfotol, pirazolinato (pirazolato), pirazosulfuron, pirazosulfuron-etila, pirazoxifen, piribambenz, piribambenz-isopropila, piribambenz-propila, piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, piriftalid, piriminobac, piriminobac-metila, pirimisulfan, piritiobac, piritiobac-sódio, piroxasulfona, piroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinoclamina, quizalofop, quizalofop-etila, quizalofop-P, quizalofop-P-etila, quizalofop-P-tefurila, rimsulfuron, saflufenacila, setoxidim, siduron, simazina, simetrin, SL-261, sulcotrion, sulfentrazona, sulfometuron, sulfometuron-metila, sulfosulfuron, SIN-523, SIP-249, ou seja 5-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]-2-nitrobenzoato de 1-etoxi-3-metil-1-oxobut-3-en-2-ila, SIP-300, ou seja 1-[7-fluoro-3-oxo-4-(prop-2-in-1-il)-3,4-dihidro-2H-1,4-benzoxazin-6-il]-3-propil-2-tioxoimidazolidina-4,5-diona, 2,3,6-TBA, TCA (ácido tricloroacético), TCA-sódio, tebutiuron, tefuriltriona, tembotriona, tepraloxidim, terbacila, terbucarb, terbumeton, terbutilazin, terbutrin, tenilclor, tiazopir, tiencarbazona, tiencarbazona-metila, tifensulfuron, tifensulfuron-metila, tiobencarb, tiafenacila, tolpiralato, topramezona, tralcoxidim, triafamona, trialato, triasulfuron, triaziflam, tribenuron, tribenuron-metila, triclopir, trietazina, trifloxisulfuron, trifloxisulfuron-sódio, trifludimoxazin, trifluralin, triflusulfuron, triflusulfuron-metila, tritosulfuron, sulfato de uréia, vernolato, XDE-848, ZJ-0862, ou seja 3,4-dicloro-N-{2-[(4,6-

dimetoxipirimidin-2-il)oxi]benzil}anilina, e os seguintes compostos



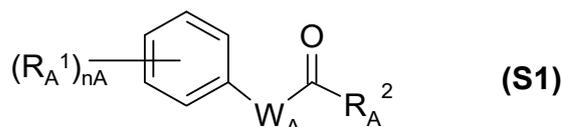
[172] Exemplos de reguladores de crescimento de plantas são:

[173] Acibenzolar, acibenzolar-S-metila, ácido 5-aminolevulínico, ancimidol, 6-benzilaminopurina, Brassinolid, catocina, cloreto de clormequate, cloprop, ciclanilida, ácido 3-(cicloprop-1-enil) propiônico, daminozida, dazomet, n-decanol, dikegulac, dikegulac-sódio, endotal, endotal-dipotássio, -disódio, e -mono(N,N-dimetilalquilamônio), etefon, flumetralin, flurenol, flurenol-butila, flurprimidol, forclorfenuron, ácido giberélico, inabenfida, ácido indol-3-acético (IAA), ácido 4-indol-3-ilbutírico, isoprotiolano, probenazol, ácido jasmônico, hidrazida maléica, cloreto de mepiquate, 1-metilciclopropeno, jasmonato de metila, 2-(1-naftil)acetamida, ácido 1-naftilacético, ácido 2-naftiloxiacético, nitrofenolato-mistura, paclobutrazol, N-(2-feniletil)-beta-alanina, ácido N-fenilftalâmico, prohexadiona, prohexadiona-cálcio, prohidrojasmona, ácido

salicílico, estrigolactona, tecnazeno, tidiazuron, triacontanol, trinexapac, trinexapac-etila, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P.

[174] Os protetores são preferivelmente selecionados a partir do grupo consistindo em:

[175] S1) compostos da fórmula (S1)

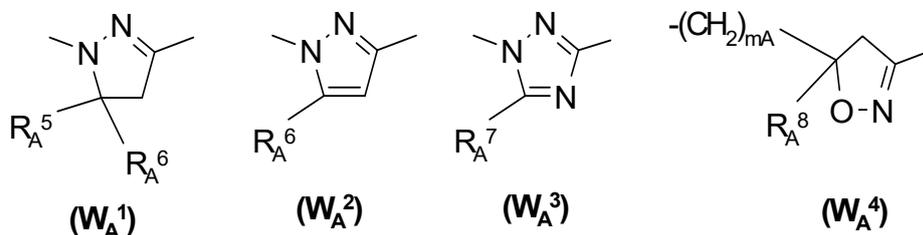


[176] em que os símbolos e índices têm os seguintes significados:

[177] n_A é um número natural de 0 a 5, preferivelmente de 0 a 3;

[178] R_A^1 é halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcoxi, nitro ou (C₁-C₄)-haloalquila;

[179] W_A é um radical heterocíclico divalente não substituído ou substituído do grupo consistindo em heterociclos de cinco membros parcialmente insaturados ou aromáticos com 1 a 3 átomos do anel hetero o grupo consistindo em N e O, em que pelo menos um átomo de nitrogênio e no máximo um átomo de oxigênio estão presentes no anel, de preferência um radical do grupo consistindo em (W_A^1) to (W_A^4),



[180] m_A é 0 ou 1;

[181] R_A^2 é OR_A^3 , SR_A^3 ou $NR_A^3R_A^4$ ou um heterociclo saturado ou insaturado de 3 a 7 membros com pelo menos um átomo de nitrogênio e até 3 heteroátomos, de preferência do grupo consistindo em O e S, que é ligado via átomo de

nitrogênio ao grupo carbonila em (S1) e que é não substituído ou substituído por radicais do grupo consistindo em (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcoxi e fenila opcionalmente substituído, de preferência um radical da fórmula OR_A³, NHR_A⁴ ou N(CH₃)₂, em particular da fórmula OR_A³;

[182]R_A³ é hidrogênio ou um radical hidrocarboneto alifático não substituído ou substituído com preferivelmente um total de 1 a 18 átomos de carbono;

[183]R_A⁴ é hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alcoxi ou um radical hidrocarboneto alifático não substituído ou substituído com preferivelmente um total de 1 a 18 átomos de carbono;

[184]R_A⁵ é H, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₄)-alcoxi-(C₁-C₈)-alquila, ciano ou COOR_A⁹ em que R_A⁹ é hidrogênio, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₄)-alcoxi-(C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₆)-hidroxialquila, (C₃-C₁₂)-cicloalquila ou tri-(C₁-C₄)-alquilsilila;

[185]R_A⁶, R_A⁷, R_A⁸ são idênticos ou diferentes e são hidrogênio, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₃-C₁₂)-cicloalquila ou fenila substituído ou não substituído;

[186]preferivelmente:

[187]a) compostos do tipo do ácido diclorofenilpirazolina 3 carboxílico (S1^a), preferivelmente compostos tais como ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-(etoxicarbonil)-5-metil-2-pirazolin-3-carboxílico, 1-(2,4-diclorofenil)-5-(etoxicarbonil)-5-metil-2-pirazolina-3-carboxilato de etila (S1-1) ("mefenpir(-dietila)"), e compostos relacionados, conforme descrito em WO-A-91/07874;

[188]b) derivados de ácido diclorofenilpirazolcarboxílico (S1^b), preferivelmente compostos tais como 1-(2,4-diclorofenil)-5-metilpirazol-3-carboxilato de etila (S1-2), 1-(2,4-diclorofenil)-5-isopropilpirazol-3-carboxilato de

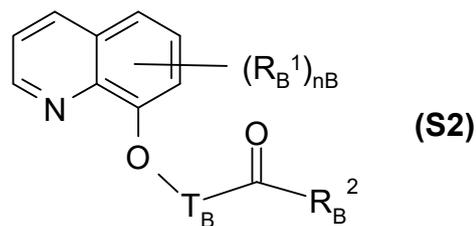
etila (S1-3),
1-(2,4-diclorofenil)-5-(1,1-dimetiletil)pirazol-3-carboxilato de etila (S1-4) e compostos relacionados, conforme descrito em EP-A-333 131 e EP-A-269 806;

[189]c) derivados de ácido 1,5-difenilpirazol-3-carboxílico (S1^c), preferivelmente, compostos tais como 1-(2,4-diclorofenil)-5-fenilpirazol-3-carboxilato de etila (S1-5), 1-(2-clorofenil)-5-fenilpirazol-3-carboxilato de metila (S1-6) e compostos relacionados, como descrito, por exemplo, em EP-A-268554;

[190]d) compostos do tipo dos ácidos triazol carboxílicos (S1^d), preferivelmente compostos tais como fenclorazol(-etil), ou seja 1-(2,4-diclorofenil)-5-triclorometil-(1H)-1,2,4-triazol-3-carboxilato de etila (S1-7), e compostos relacionados, conforme descrito em EP-A-174 562 e EP-A-346 620;

[191]e) compostos do tipo do ácido 5-benzil- ou 5-fenil-2-isoxazolina-3-carboxílico ou o ácido 5,5-difenil-2-isoxazolina-3-carboxílico (S1^e), preferivelmente compostos tais como 5-(2,4-diclorobenzil)-2-isoxazolina-3-carboxilato de etila (S1-8) ou 5-fenil-2-isoxazolina-3-carboxilato de etila (S1-9) e compostos relacionados, conforme descrito em WO-A-91/08202, ou ácido 5,5-difenil-2-isoxazolinacarboxílico (S1-10) ou 5,5-difenil-2-isoxazolinacarboxilato de etila (S1-11) ("isoxadifen-etila") ou 5,5-difenil-2-isoxazolinacarboxilato de n-propila (S1-12) ou 5-(4-fluorofenil)-5-fenil-2-isoxazolina-3-carboxilato de etila (S1-13), conforme descrito no pedido de patente WO-A-95/07897.

[192]S2) Derivados de Quinolina da fórmula (S2)



[193] em que os símbolos e índices têm os seguintes significados:

[194] R_B^1 é halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcoxi, nitro ou (C_1-C_4) -haloalquila;

[195] n_B é um número natural de 0 a 5, preferivelmente de 0 a 3;

[196] R_B^2 é OR_B^3 , SR_B^3 ou $NR_B^3R_B^4$ ou um heterociclo saturado ou insaturado de 3 a 7 membros com pelo menos um átomo de nitrogênio e até 3 heteroátomos, preferivelmente do grupo consistindo em O e S, que é ligado via átomo de nitrogênio ao grupo carbonila em (S2) e que é não substituído ou substituído por radicais do grupo consistindo em (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcoxi e fenila opcionalmente substituído, preferivelmente um radical da fórmula OR_B^3 , NHR_B^4 ou $N(CH_3)_2$, em particular da fórmula OR_B^3 ;

[197] R_B^3 é hidrogênio ou um radical hidrocarboneto alifático não substituído ou substituído, tendo preferivelmente um total de 1 a 18 átomos de carbono;

[198] R_B^4 é hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -alcoxi ou fenila substituído ou não substituído;

[199] T_B é uma cadeia $(C_1-$ ou $C_2)$ -alcodiila que é não substituído ou substituído por um ou dois radicais (C_1-C_4) -alquila ou por $[(C_1-C_3)$ -alcoxi]carbonila;

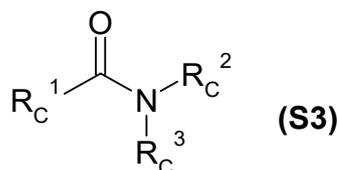
[200] preferivelmente:

[201] a) compostos do tipo do ácido 8-quinolinoxiacético (S2^a), preferivelmente (5-cloro-8-quinolinoxia)acetato de 1-metilhexila (nome comum "cloquintocet-mexila" (S2-1),

(5-cloro-8-quinolinoxi)acetato de 1,3-dimetil-but-1-ila (S2-2), (5-cloro-8-quinolinoxi)acetato de 4-alliloxibutyla (S2-3), (5-cloro-8-quinolinoxi)acetato de 1-aliloxiprop-2-ila (S2-4), (5-cloro-8-quinolinoxi)acetato de etila (S2-5), (5-cloro-8-quinolinoxi)acetato de metila (S2-6), (5-cloro-8-quinolinoxi)acetato de alila (S2-7), (5-cloro-8-quinolinoxi)acetato de 2-(2-propilideneiminoxi)-1-etila (S2-8), (5-cloro-8-quinolinoxi)acetato de 2-oxo-prop-1-ila (S2-9) e compostos relacionados, conforme descrito em EP-A-86 750, EP-A-94 349 e EP-A-191 736 ou EP-A-0 492 366, e também ácido (5-cloro-8-quinolinoxi) acético (S2 10), seus hidratos e sais, por exemplo, sais de lítio, sódio, potássio, cálcio, magnésio, alumínio, ferro, amônio, amônio quaternário, sulfônio ou fosfônio, como descrito no WO-A-2002/34048;

[202]b) compostos do tipo do ácido (5 cloro 8 quinolinoxi) malônico (S2b), preferivelmente compostos tais como malonato de dietila (5 cloro 8 quinolinoxi), malonato de dialila (5 cloro 8-quinolinoxi), malonato de metil etila (5 cloro 8 quinolinoxi) e compostos relacionados, conforme descrito em EP-A-0 582 198.

[203]S3) Compostos da fórmula (S3)



[204]em que os símbolos e índices têm os seguintes significados:

[205]R_C¹ é (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₂-C₄)-alquenila, (C₂-C₄)-haloalquenila, (C₃-C₇)-cicloalquila, preferivelmente diclorometila;

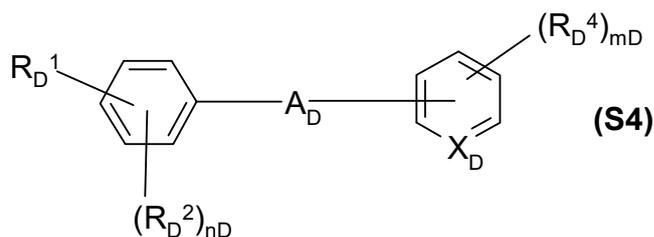
[206]R_C², R_C³ são idênticos ou diferentes e são hidrogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₂-C₄)-alquenila, (C₂-C₄)-

alquinila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₂-C₄)-haloalquenila, (C₁-C₄)-alquilcarbamoil-(C₁-C₄)-alquila, (C₂-C₄)-alquenilcarbamoil-(C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-alcoxi-(C₁-C₄)-alquila, dioxolanil-(C₁-C₄)-alquila, thiazolila, furila, furilalquila, tienila, piperidila, fenila substituído ou não substituído, ou R_C² e R_C³ juntos formam um anel heterocíclico substituído ou não substituído, preferivelmente um anel de oxazolidina, tiazolidina, piperidina, morfolina, hexahidropirimidina ou de benzoxazina;

[207]preferivelmente:

[208]compostos ativos do tipo do dicloroacetamidas que são freqüentemente usados como protetores de emergência (protetores que atuam no solo), como, por exemplo,, "diclormida" (N,N-dialil-2,2-dicloroacetamida) (S3-1), "R-29148" (3-dicloroacetil-2,2,5-trimetil-1,3-oxazolidina) de Stauffer (S3-2), "R-28725" (3-dicloroacetil-2,2-dimetil-1,3-oxazolidina) de Stauffer (S3-3), "benoxacor" (4-dicloroacetil-3,4-dihidro-3-metil-2H-1,4-benzoxazina) (S3-4), "PPG-1292" (N-alil-N-[(1,3-dioxolan-2-il)metil]dicloroacetamida) de PPG Industries (S3-5), "DKA-24" (N-alil-N-[(alilaminocarbonil)metil]dicloroacetamida) de Sagro-Chem (S3-6), "AD-67" ou "MON 4660" (3-dicloroacetil-1-oxa-3-aza-spiro[4,5]decano) de Nitrokemia ou Monsanto (S3-7), "TI-35" (1-dicloroacetilazepano) de TRI-Chemical RT (S3-8) "diclonon" (díciclonon) ou "BAS145138" ou "LAB145138" (S3-9) (3-dicloroacetil-2,5,5-trimetil-1,3-diazabicyclo[4.3.0]nonano) de BASF, "furilazol" ou "MON 13900" ((RS)-1-dicloroacetil-3,3,8a-trimetilperhidropirrol[1,2-a]pirimidin-6-ona) (S3-10) e também seus isômeros (R) (S3-11).

[209]S4) N- Acilsulfonamidas da fórmula (S4) e seus sais



[210] em que os símbolos e índices têm os seguintes significados:

[211] A_D é $SO_2-NR_D^3-CO$ ou $CO-NR_D^3-SO_2$;

[212] X_D é CH ou N;

[213] R_D^1 é $CO-NR_D^5R_D^6$ ou $NHCO-R_D^7$;

[214] R_D^2 é halogênio, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -haloalcoxi, nitro, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcoxi, (C_1-C_4) -alquilsulfonila, (C_1-C_4) -alcoxicarbonila ou (C_1-C_4) -alquilcarbonila;

[215] R_D^3 é hidrogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_2-C_4) -alquenila ou (C_2-C_4) -alquinila;

[216] R_D^4 é halogênio, nitro, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -haloalcoxi, (C_3-C_6) -cicloalquila, fenila, (C_1-C_4) -alcoxi, ciano, (C_1-C_4) -alquiltio, (C_1-C_4) -alquilsulfinila, (C_1-C_4) -alquilsulfonila, (C_1-C_4) -alcoxicarbonila ou (C_1-C_4) -alquilcarbonila;

[217] R_D^5 é hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_6) -alquinila, (C_5-C_6) -cicloalquenila, fenila ou heterociclila de 3 a 6 membros que contém heteroátomos v_D do grupo consistindo em nitrogênio, oxigênio ou enxofre, em que os sete radicais mencionados acima são substituídos por substituintes v_D do grupo consistindo em halogênio, (C_1-C_6) -alcoxi, (C_1-C_6) -haloalcoxi, (C_1-C_2) -alquilsulfinila, (C_1-C_2) -alquilsulfonila, (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_1-C_4) -alcoxicarbonila, (C_1-C_4) -alquilcarbonila e fenila, e no caso de radicais cíclicos, também (C_1-C_4) -alquila e (C_1-C_4) -haloalquila;

[218] R_D^6 é hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_2-C_6) -alquenila ou (C_2-C_6) -alquinila, em que os três radicais mencionados acima são substituídos por radicais v_D do grupo consistindo em halogênio, hidroxí, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcoxi e (C_1-C_4) -alquiltio, ou

[219] R_D^5 e R_D^6 juntamente com o átomo de nitrogênio que os transporta, formam um radical pirrolidinila ou piperidinila;

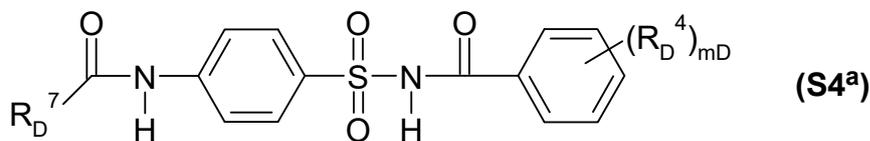
[220] R_D^7 é hidrogênio, (C_1-C_4) -alquilamino, di- (C_1-C_4) -alquilamino, (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_6) -cicloalquila, em que os 2 radicais mencionados acima são substituídos por substituintes v_D do grupo consistindo em halogênio, (C_1-C_4) -alcoxi, halo- (C_1-C_6) -alcoxi e (C_1-C_4) -alquiltio e, no caso de radicais cíclicos, também (C_1-C_4) -alquila e (C_1-C_4) -haloalquila;

[221] n_D é 0, 1 ou 2;

[222] m_D é 1 ou 2;

[223] v_D é 0, 1, 2 ou 3;

[224] dentre estes, é dada preferência a compostos do tipo N acilsulfonamidas, por exemplo, da fórmula (S4^a) abaixo, que são conhecidos, por exemplo, a partir do documento WO-A-97/45016



[225] em que

[226] R_D^7 é (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_6) -cicloalquila, em que os 2 radicais mencionados acima são substituídos por substituintes v_D do grupo consistindo em halogênio, (C_1-C_4) -alcoxi, halo- (C_1-C_6) -alcoxi e (C_1-C_4) -alquiltio e, no caso de radicais cíclicos, também (C_1-C_4) -alquila e (C_1-C_4) -haloalquila;

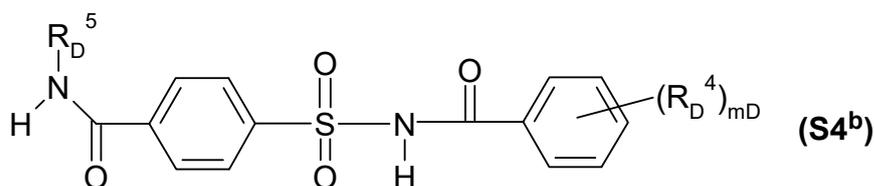
[227] R_D^4 é halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcoxi, CF_3 ;

[228] m_D é 1 ou 2;

[229] v_D é 0, 1, 2 ou 3;

[230] e também

[231] acilsulfamoylbenzamidás, por exemplo da fórmula (S4^b) abaixo, que são conhecidas, por exemplo, a partir do documento WO-A-99/16744,



[232] por exemplo aquelas nos quais

[233] R_D^5 = ciclopropila e (R_D^4) = 2-OMe ("cipro-sulfamida", S4-1),

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

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

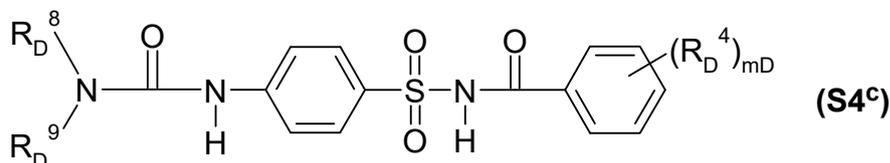
[236] R_D^5 = isopropila e (R_D^4) = 5-Cl-2-OMe (S4-4)

and

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

[238] e também

[239] compostos do tipo de N-acilsulfamoylbenzamidás da fórmula (S4^c), que são conhecidas, por exemplo, a partir do documento EP-A-365484,



[240] em que

[241] R_D^8 e R_D^9 independentemente um do outro são hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_6) -alquenila, (C_3-C_6) -alquinila,

[242] R_D^4 é halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcoxi, CF_3 ,

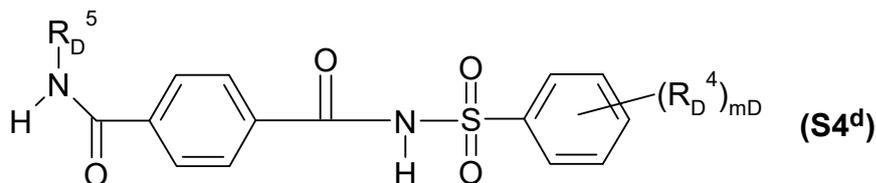
[243] m_D é 1 ou 2;

[244] por exemplo

[245] 1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3-metiluréia, 1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3,3-dimetiluréia, 1-[4-(N-4,5-dimetilbenzoilsulfamoil)fenil]-3-metiluréia,

[246] e também

[247] N-fenilsulfoniltereftalamidas da fórmula (S4^d), que são conhecidas, por exemplo, a partir do documento CN 101838227,



[248] por exemplo tais compostos em que

[249] R_D^4 é halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcoxi, CF_3 ;

[250] m_D é 1 ou 2;

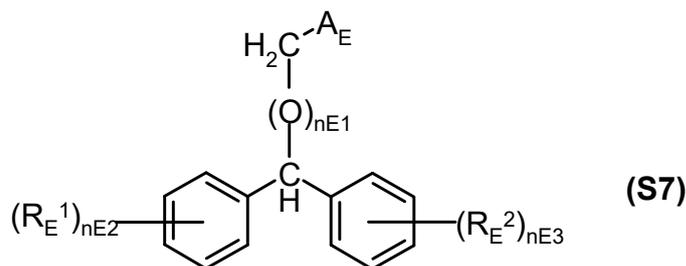
[251] R_D^5 é hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_6) -alquinila, (C_5-C_6) -cicloalquenila.

[252] S5) Compostos ativos da classe dos derivados hidroximáticos e do ácido carboxílico aromático-alifático (S5), por exemplo, 3,4,5-triacetoxibenzoato de etila, ácido 3,5-dimetoxi-4-hidroxibenzóico, ácido 3,5-dihidroxibenzóico, ácido 4-hidroxisalicílico, ácido 4-fluorossalicílico, ácido 2-hidroxicinâmico, ácido 2,4-diclorocinâmico, conforme descrito em WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001.

[253] S6) Compostos ativos da classe dos 1,2-dihidroquinoxalin-2-onas (S6), por exemplo 1-metil-3-(2-

tienil)-1,2-dihidroquinoxalin-2-ona, 1-metil-3-(2-tienil)-1,2-dihidroquinoxalina-2-tiona, cloridrato de 1-(2-aminoetil)-3-(2-tienil)-1,2-dihidroquinoxalin-2-ona, 1-(2-metilsulfonilaminoetil)-3-(2-tienil)-1,2-dihidroquinoxalin-2-ona, conforme descrito em WO-A-2005/112630.

[254] S7) Compostos da fórmula (S7), conforme descrito em WO-A-1998/38856,



[255] em que os símbolos e índices têm os seguintes significados:

[256] R_E^1 , R_E^2 independentemente um do outro são halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcoxi, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -alquilamino, di- (C_1-C_4) -alquilamino, nitro;

[257] A_E é $COOR_E^3$ ou $COSR_E^4$

[258] R_E^3 , R_E^4 independentemente um do outro são hidrogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_4) -alquinila, cianoalquila, (C_1-C_4) -haloalquila, fenila, nitrofenila, benzila, halobenzila, piridinilalquila ou alquilamônio,

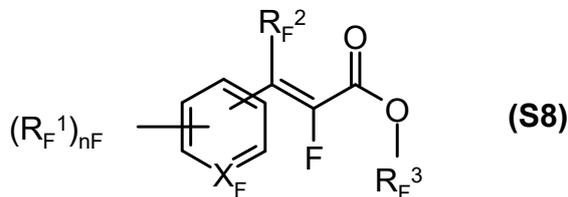
[259] n_{E^1} é 0 ou 1;

[260] n_{E^2} , n_{E^3} independentemente um do outro são 0, 1 ou 2,

[261] preferivelmente:

ácido difenilmetoxiacético, difenilmetoxiacetato de etila, difenilmetoxiacetato de metila (CAS Reg. No.: 41858-19-9) (S7-1).

[262] S8) Compostos da fórmula (S8), conforme descrito em WO-A-98/27049,



[263] em que

[264] X_F é CH ou N,

[265] n_F é, se $X_F=N$, um número inteiro de 0 a 4

[266] é, se $X_F=CH$, um número inteiro de 0 a 5,

[267] R_F^1 é halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₁-C₄)-alcoxi, (C₁-C₄)-haloalcoxi, nitro, (C₁-C₄)-alquiltio, (C₁-C₄)-alquilsulfonila, (C₁-C₄)-alcoxicarbonila, fenila opcionalmente substituído, fenoxi opcionalmente substituído,

[268] R_F^2 é hidrogênio ou (C₁-C₄)-alquila,

[269] R_F^3 é hidrogênio, (C₁-C₈)-alquila, (C₂-C₄)-alquenila, (C₂-C₄)-alquinila ou arila, onde cada um dos radicais contendo carbono mencionados acima é não substituído ou substituído por um ou mais, preferivelmente por até três radicais idênticos ou diferentes do grupo consistindo em halogênio e alcoxi; ou seus sais,

[270] preferivelmente compostos nos quais

[271] X_F é CH,

[272] n_F é um número inteiro de 0 a 2,

[273] R_F^1 é halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₁-C₄)-alcoxi, (C₁-C₄)-haloalcoxi,

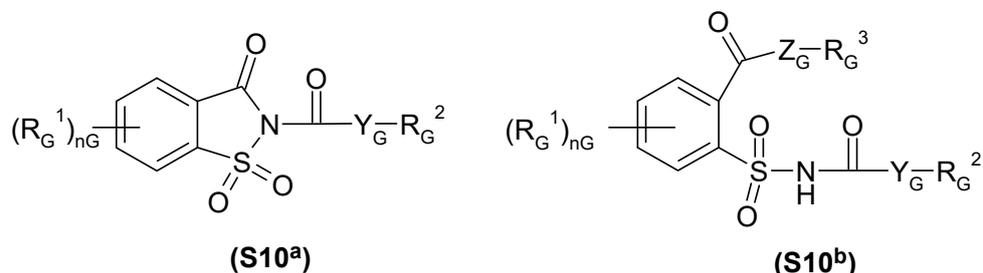
[274] R_F^2 é hidrogênio ou (C₁-C₄)-alquila,

[275] R_F^3 é hidrogênio, (C₁-C₈)-alquila, (C₂-C₄)-alquenila, (C₂-C₄)-alquinila ou arila, onde cada um dos radicais que contêm carbono mencionados acima é não substituído ou substituído por um ou mais, preferivelmente por até três radicais idênticos ou diferentes;

[276] ou sais dos mesmos,

[277] S9) Compostos ativos da classe das 3-(5-tetrazolilcarbonil)-2-quinolonas (S9), por exemplo 1,2-dihidro-4-hidroxi-1-etil-3-(5-tetrazolilcarbonil)-2-quinolona (CAS Reg. No.: 219479-18-2), 1,2-dihidro-4-hidroxi-1-metil-3-(5-tetrazolilcarbonil)-2-quinolona (CAS Reg. No.: 95855-00-8), conforme descrito em WO-A-1999/000020.

[278] S10) Compostos da fórmula (S10^a) ou (S10^b) conforme descrito em WO-A-2007/023719 e WO-A-2007/023764



[279] em que

[280] R_G¹ é halogênio, (C₁-C₄)-alquila, metoxi, nitro, ciano, CF₃, OCF₃

[281] Y_G, Z_G independentemente um do outro são O ou S,

[282] n_G é um número inteiro de 0 a 4,

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

[284] R_G³ é hidrogênio ou (C₁-C₆)-alquila.

[285] S11) Compostos ativos do tipo dos compostos oxiiimino (S11), que são conhecidos como tratamento de semente, como, por exemplo, "oxabetrinila" ((Z) -1,3-dioxolan-2-ilmetoxiimino- (fenil) acetonitrila) (S11 1), que é conhecido como protetor de tratamentos de semente para painço contra danos por metolacoloro,

[286] "fluxofenim" (1- (4-clorofenil) -2,2,2-trifluoro-1-etanona O- (1,3-dioxolan-2-ilmetil) oxima)

(S112), que é conhecido como protetor de sementes para painço contra danos por metolacloro e

[287] "ciometrinila "ou" CGA-43089 "(acetonitrila de (Z) -cianometoxi-imino (fenila)) (S11 3), que é conhecido como protetor de sementes para painço contra danos por metolacloro.

[288] S12) Compostos ativos da classe dos isotiocromanonas (S12), tais como, por exemplo, [(3-oxo-1H-2-benzotiopiran-4(3H)-ilideno)metoxil]acetato de metila (CAS Reg. No.: 205121-04-6) (S12-1) e compostos relacionados a partir do documento WO-A-1998/13361.

[289] S13) Um ou mais compostos do grupo (S13):

[290] "anidrido naftálico "(anidrido 1,8 naftalenodicarboxílico) (S13 1), conhecido como protetor de sementes para painço contra danos pelo herbicida tiocarbamato,

[291] "fenclorim" (4,6-dicloro-2-fenilpiridimidina) (S13-2), que é conhecido como protetor para pretilacloro no arroz semeado,

[292] "flurazol" (2-cloro-4-trifluorometil-1,3-tiazol-5-carboxilato de benzila (S13 3), que é conhecido como protetor de sementes para painço contra danos por alacloro e metolacloro,

[293] "CL 304415" (CAS Reg. No.: 31541-57-8) (Ácido 4-carboxi-3,4-di-hidro-2H-1-benzopirano-4-acético) (S13 4) da American Cyanamid, que é conhecido como protetor do painço ontra danos por imidazolinona,

[294] "MG 191" (CAS Reg. No.: 96420-72-3) (2-diclorometila-2-metil-1,3-dioxolano) (S13 5) da Nitrokemia, que é conhecido como protetor de painço,

[295] "MG 838" (CAS Reg. No.: 133993-74-5) (2- 1-oxa-4-azaspiro [4.5] decano-4-carboditioato de propenila (S13 6) da Nitrokemia,

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

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

[298] "mefenato" (carbamato de 4-clorofenilmetila) (S13-9).

[299] Compostos ativos que, além de um efeito herbicida contra plantas nocivas, também têm um efeito protetor em plantas de cultivo como arroz, como, por exemplo, "dimepiperato" ou "MY-93" (S-1-metil-1-feniletilpiperidina) - 1-carbotioato), conhecido como protetor de arroz contra danos causados por herbicida molinato,

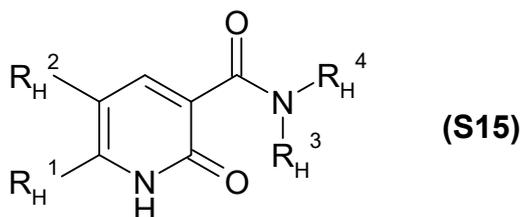
[300] "daimuron" ou "SK 23" (1- (1-metil-1-feniletil) -3-p-toliluréia), conhecido como protetor do arroz contra danos do herbicida imazosulfuron,

[301] "cumiluron" = "JC-940" (3-(2- clorofenilmetil) -1- (1-metil-1-feniletil) uréia, consulte o documento JP-A-60087254), que é conhecido como protetor do arroz contra alguns danos por herbicidas,

[302] "metoxifenona" ou "NK 049" (3,3'-dimetil-4-metoxibenzofenona), que é conhecido como protetor do arroz contra alguns danos causados por herbicida,

[303] "CSB" (1-bromo-4- (clorometilsulfonil) benzeno) de Kumiai, (número CAS 54091-06-4), conhecido como protetor contra alguns danos causados por herbicidas no arroz.

[304] S15) Compostos da fórmula (S15) ou seus



tautômeros

[305] que são conhecidos, por exemplo, a partir do documento WO-A-2008/131861 e WO-A-2008/131860,

[306] em que

[307] R_H^1 é (C₁-C₆)-haloalquila,

[308] R_H^2 é hidrogênio ou halogênio,

[309] R_H^3 , R_H^4 independentemente um do outro são hidrogênio, (C₁-C₁₆)-alquila, (C₂-C₁₆)-alquenila ou (C₂-C₁₆)-alquinila,

[310] onde cada um dos três radicais mencionados acima é não substituído ou substituído por um ou mais radicais do grupo consistindo em halogênio, hidroxil, ciano, (C₁-C₄)-alcoxi, (C₁-C₄)-haloalcoxi, (C₁-C₄)-alquiltio, (C₁-C₄)-alquilamino, di-[(C₁-C₄)-alquil]-amino, [(C₁-C₄)-alcoxi]-carbonila, [(C₁-C₄)-haloalcoxi]-carbonila, (C₃-C₆)-cicloalquila não substituído ou substituído, fenila não substituído ou substituído, e heterociclila não substituído ou substituído;

[311] or (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₄-C₆)-cicloalquenila, (C₃-C₆)-cicloalquila, que está em um sítio do anel condensado com um anel carbocíclico saturado ou insaturado de 4 a 6 membros, ou (C₄-C₆)-cicloalquenila, que está em um sítio do anel condensado com um anel carbocíclico saturado ou insaturado de 4 a 6 membros,

[312] onde cada um dos quatro radicais mencionados anteriormente é não substituído ou substituído por um ou mais radicais do grupo consistindo em halogênio, hidroxil, ciano, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₁-C₄)-alcoxi, (C₁-C₄)-haloalcoxi, (C₁-C₄)-alquiltio, (C₁-C₄)-alquilamino, di-(C₁-C₄)-alquil]-amino, [(C₁-C₄)-alcoxi]-carbonila, [(C₁-C₄)-haloalcoxi]-carbonila, (C₃-C₆)-cicloalquila não substituído ou substituído, fenila não substituído ou substituído, e heterociclila não substituído ou substituído; ou

[313] R_H^3 é (C_1-C_4) -alcoxi, (C_2-C_4) -alquênioxo, (C_2-C_6) -alquênioxo ou (C_2-C_4) -haloalcoxi, e

[314] R_H^4 é hidrogênio ou (C_1-C_4) -alquila, ou

[315] R_H^3 e R_H^4 juntamente com o átomo de nitrogênio diretamente ligado, são um anel heterocíclico de 4 a 8 membros, que pode conter outros átomos de anel hetero além do átomo N, preferivelmente até dois átomos de anel hetero adicionais do grupo constituído por N, O e S, e que é não substituído ou substituído por um ou mais radicais do grupo consistindo em halogênio, ciano, nitro, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -alcoxi, (C_1-C_4) -haloalcoxi, e (C_1-C_4) -alquiltio.

[316] S16) Compostos ativos usados principalmente como herbicidas, mas também têm efeito protetor nas plantas de cultura, por exemplo

[317] Ácido $(2,4\text{-diclorofenoxi})$ acético $(2,4\text{-D})$,
 ácido (4-clorofenoxi) acético,
 ácido $(R,S)\text{-}2\text{-}(4\text{-cloro-}o\text{-toliloxi})$ propiônico (mecoprop),
 ácido $4\text{-}(2,4\text{-diclorofenoxi})$ butírico $(2,4\text{-DB})$,
 ácido $(4\text{-cloro-}o\text{-toliloxi})$ acético (MCPA),
 ácido $4\text{-}(4\text{-cloro-}o\text{-toliloxi})$ butírico,
 ácido $4\text{-}(4\text{-clorofenoxi})$ butírico,
 ácido $3,6\text{-dicloro-}2\text{-metoxibenzóico}$ (dicamba),
 $3,6\text{-dicloro-}2\text{-metoxibenzoato}$ de $1\text{-}(etoxicarbonil)$ etila
 (lactidiclor-etila).

Exemplos

[318] De uma maneira exemplificativa, alguns exemplos de síntese de compostos da fórmula geral (G1) serão descritos abaixo. Nos exemplos, os valores (incluindo porcentagens) referem-se ao peso, a menos que seja indicado de outra forma.

[319] Os símbolos ">" e "<" significam "maior que" e "menor que", respectivamente. O símbolo "≥" significa "maior

que ou igual a", o símbolo " \leq " significa "menor que ou igual a".

[320] Se, no contexto da descrição e dos exemplos, os termos "R" e "S" forem dados para a configuração absoluta no centro de quiralidade dos estereoisômeros da fórmula (G1), esta nomenclatura RS, a menos que definido diferentemente, seguirá a regra de Cahn-Ingold-Prelog.

[321] No contexto da presente invenção e nas Tabelas 1 a 3, que indicam compostos específicos e preferidos de acordo com a presente invenção, serão usadas as seguintes abreviações:

[322] H = hidrogênio

[323] Me = metila ou CH₃

[324] Et = etila

[325] Pr = propila

[326] Bu = butila

[327] nAlquila = n-alquila, por exemplo nPr = n-propila

[328] cAlquila = cicloalquila, por exemplo cPr = ciclopropila, cHexila = ciclohexila

[329] iAlquila = isooalquila, por exemplo iPr = isopropila

[330] tAlquila = alquila terciária, por exemplo tBu = terc-butila

[331] Ac = acetila

[332] F, Cl, Br, I = flúor, cloro, bromo e iodo, respectivamente, de acordo com o símbolo químico convencional do átomo

[333] MeO ou OMe = metoxi

[334] CN = ciano

[335] NO₂ = nitro

[336] Ph = fenila

[337] diHal = diHal, por exemplo diF = difluoro

[338] triHal = triHal, por exemplo triF = trifluoro

[339] -CCH = etinila (-C≡CH)

[340] A posição de um substituinte, por exemplo, no anel fenila na posição 2, é declarada como um prefixo do símbolo ou a abreviação do radical, por exemplo 2-Cl = 2-cloro

[341] 2-Me = 2-metila

[342] Numerações das posições de substituintes para padrões de substituição di ou trissubstituídos são analogamente declarados como prefixo, por exemplo

[343] 2,3-Cl₂ = 2,3-dicloro (por exemplo como substituição no anel de fenila)

[344] 2,4-diF = 2,4-difluoro (por exemplo como substituição no anel de fenila)

[345] 2,4-F₂ = 2,4-difluoro (por exemplo como substituição no anel de fenila)

[346] 2,4,6-triF = 2,4,6-trifluoro (por exemplo como substituição no anel de fenila)

[347] 2-F-4-Cl = 2-fluoro, 4-cloro (por exemplo como substituição no anel de fenila)

[348] 5-F-2-Me = 5-fluoro, 2-metila (por exemplo como substituição no anel de fenila)

[349] Outras abreviações devem ser entendidas de forma análoga aos exemplos indicados acima.

[350] Além disso, os símbolos e fórmulas químicas habituais se aplicam, como, por exemplo, CH₂ para metileno ou CF₃ para trifluorometila ou OH para hidroxila.

[351] Correspondentemente, os significados de compósito são definidos como compostos pelas abreviações mencionadas, por exemplo 4-CF₃-cHexila = 4-trifluorometil-ciclohexila

[352] Além disso, as seguintes abreviações são usadas:

[353] DCM = diclorometano

[354] DMF = dimetilformamida

[355] DMSO = dimetilsulfóxido

[356] T3P = anidrido propilfosfônico

[357] THF = tetrahidrofurano

Listas de Pico de NMR

[358] Os dados de 1H-RMN dos exemplos selecionados são escritos na forma de listas de pico de 1H-RMN. Para cada pico de sinal são listados o valor δ em ppm e a intensidade do sinal entre colchetes. Entre o valor δ os pares de intensidade de sinal são ponto e vírgula como delimitadores.

[359] A lista de pico de um exemplo tem, portanto, a forma:

[360] δ_1 (intensidade 1); δ_2 (intensidade 2);..... ; δ_i (intensidade i);.....; δ_n (intensidade n)

[361] A intensidade dos sinais agudos se correlaciona com a altura dos sinais em um exemplo impresso de um espectro de RMN em cm e mostra as reais relações das intensidades do sinal. A partir de sinais amplos, podem ser mostrados vários picos ou o meio do sinal e sua intensidade relativa em comparação com o sinal mais intenso no espectro.

[362] Para calibrar o deslocamento químico para os espectros de 1H, tetrametilsilano e/ou o deslocamento químico do solvente foi usado, especialmente no caso de espectros medidos em DMSO (dimetilsulfóxido). Portanto, nas listas de pico de RMN, pode ocorrer pico de tetrametilsilano, mas não necessariamente.

[363] As listas de pico de 1H-RMN são semelhantes às impressões clássicas de 1H-RMN e, portanto, geralmente contêm todos os picos listados na interpretação clássica de RMN.

[364] Além disso, eles podem mostrar, como impressões clássicas de 1H-RMN, sinais de solventes,

estereoisômeros dos compostos-alvo, que também são objeto da invenção, e/ou picos de impurezas.

[365] Para mostrar sinais compostos na faixa delta de solventes e/ou água os picos habituais de solventes, por exemplo, picos de DMSO em DMSO-D₆ e o pico de água são mostrados em nossas listas de pico de 1H-RMN e geralmente têm em média uma alta intensidade.

[366] Os picos de estereoisômeros dos compostos-alvo e/ou picos de impurezas geralmente têm em média uma intensidade menor do que os picos dos compostos-alvo (por exemplo, com uma pureza > 90%).

[367] Esses estereoisômeros e/ou impurezas podem ser típicos para o processo de preparação específico. Portanto, seus picos podem ajudar a reconhecer a reprodução de nosso processo de preparação por meio de "impressões digitais de produtos secundários".

[368] Um especialista, que calcula os picos dos compostos-alvo com métodos conhecidos (MestreC, simulação ACD, mas também com valores de expectativa empiricamente avaliados) pode isolar os picos dos compostos-alvo conforme necessário, opcionalmente usando filtros adicionais de intensidade. Esse isolamento seria semelhante ao processo de seleção de pico relevante na interpretação clássica de 1H-RMN.

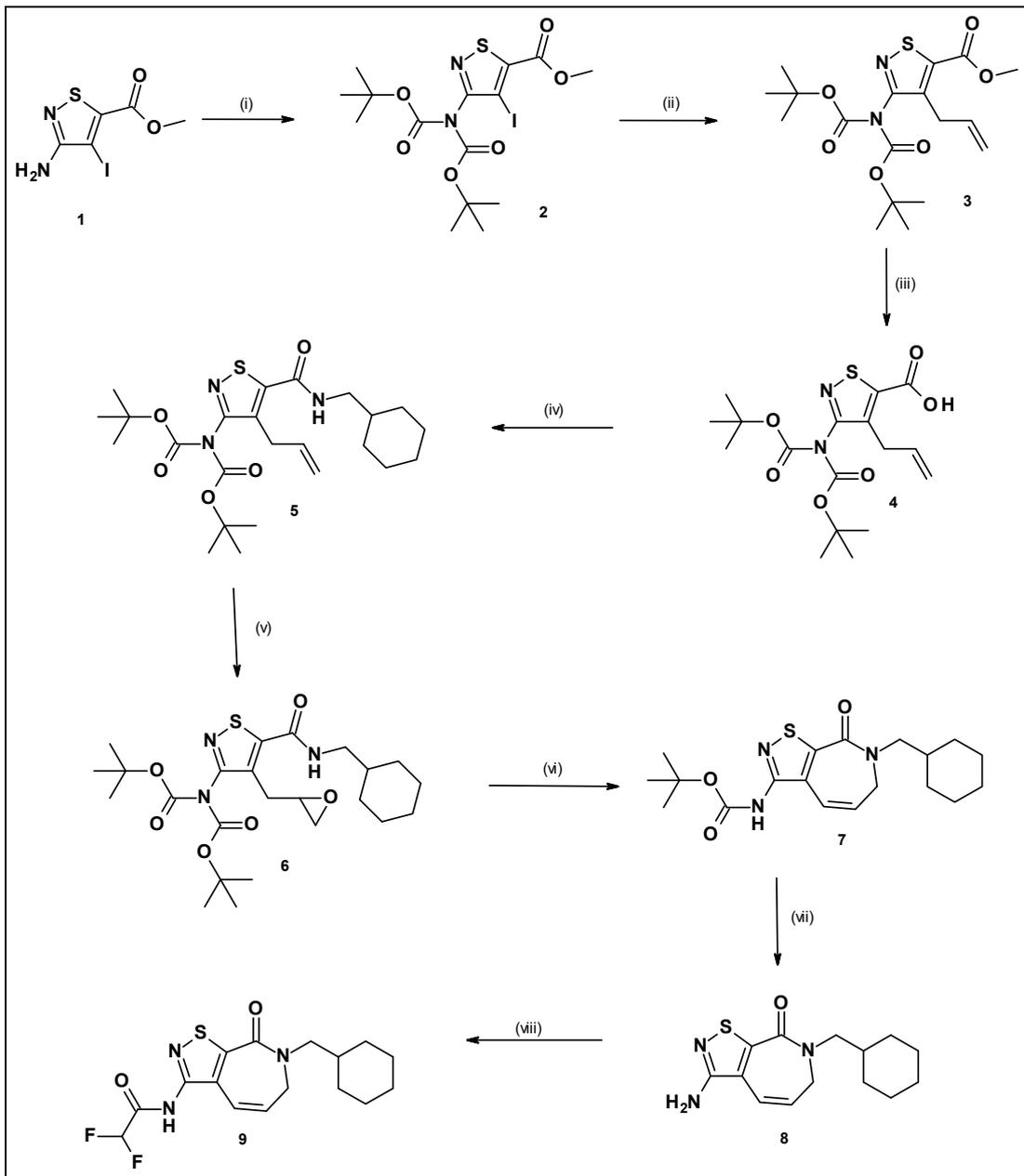
[369] Mais detalhes da descrição dos dados de RMN com listas de pico podem ser encontrados na publicação "Citação de dados de lista de pico de NMR nos pedidos de patente" do banco de dados de divulgação de pesquisa número 564025.

[370] Os compostos de acordo com a presente invenção, como descritos nas Tabelas 1 a 3, são obtidos de acordo ou analogamente aos seguintes exemplos de síntese química.

Exemplos de síntese química:

[371] Síntese de N- [7- (ciclohexilmetil) -8-oxo-6H-isotiazol [5,4-c] azepin-3-il] -2,2-difluoro-acetamida (composto No. I-23).

[372] O esquema a seguir ilustra as etapas (i) a (viii) com exemplos detalhados 1 a 9



[373]1 Etapa (i) = Síntese de 3- [bis (terc-butoxicarbonil) amino] -4-iodo-isotiazol-5-carboxilato de metila:

[374]A uma solução agitada de 10.0 g de éster **1** (35.2 mmol) em THF (50 mL) foram adicionados 18.0 g de Boc-anidrido (82.7 mmol), 14.7 mL de trietilamina (106 mmol) e 86.0 mg de DMAP (0.70 mmol). A mistura de reação foi então agitada à temperatura ambiente durante 4hs. A reação foi rapidamente resfriada pela adição de uma solução aquosa saturada de NH₄Cl e CH₂Cl₂. A fase aquosa foi extraída duas vezes com CH₂Cl₂ e as fases orgânicas combinadas foram secas sobre sulfato de sódio, filtradas, concentradas e purificadas por cromatografia em coluna. Rendimento: 15.8 g (92% teoricamente).

[375]¹H-NMR (400MHz, DMSO δ, ppm) 3.92 (s, 3H), 1.36 (s, 18H).

[376]2 Etapa (ii) = Síntese de 4-alil-3- [bis (terc-butoxicarbonil) amino] isotiazol-5-carboxilato de metila:

[377]A uma solução agitada de 13.7 g de éster **2** (28.3 mmol) em THF (80 mL) a 70 graus foram adicionados em gotas 28.3 mL de uma solução THF de *i*PrMgCl·LiCl [cloreto de isopropilmagnésio cloreto de lítio] (36.8 mmol, 1.3 M). A solução foi agitada por 5 minutos a 70 graus, em seguida 28.3 mL de uma solução THF de CuCN·2LiCl [cianeto de cobre di (cloreto de lítio)] (28.3 mmol, 1 M) foram adicionados em gotas. A solução foi agitada por 2 minutos a 70 graus antes de 4.9 mL de brometo de alila (56.6 mmol) terem sido adicionados em gotas. A reação foi agitada por 1 h enquanto aquecia de -70 graus para -40 graus. A reação foi resfriada rapidamente pela adição de solução aquosa saturada NH₄Cl. A fase aquosa foi extraída 3 vezes com EtOAc e as fases

orgânicas combinadas secas sobre sódio sulfato, filtradas, concentradas e purificadas por cromatografia em coluna. Rendimento: 10.0 g (81% teoricamente).

[378] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, DMSO δ , ppm) 5.83-5.71 (m, 1H), 5.06-4.97 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.52 (d, 2H), 1.35 (s, 18H).

[379]3 Etapa (iii) = Síntese do ácido 4-alil-3-[bis (terc-butoxicarbonil) amino] isotiazol-5-carboxílico:

[380] A uma solução agitada de 1.50 g de éster **3** (3.76 mmol) em THF (5.0 mL) e MeOH (5.0 mL) foram adicionados 2.83 mL de uma solução aquosa 2 M de NaOH (5.64 mmol). A mistura de reação foi agitada por 1 h. A reação foi concentrada e o resíduo foi repartido entre uma solução aquosa de HCl e EtOAc a 2 M. A fase aquosa foi extraída duas vezes com EtOAc e os extratos orgânicos combinados foram secos sobre sulfato de sódio, filtrados e concentrados. O ácido bruto foi utilizado na próxima etapa (iv) sem purificação adicional.

[381] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, DMSO δ , ppm) 5.84 (m, 1H), 5.03-4.96 (m, 2H), 3.52 (d, 2H), 1.35 (s, 18H).

[382]4 Etapa (iv) = Síntese de N-[4-alil-5-(ciclohexilmetilcarbamoil) isotiazol-3-il]-N-terc-butoxicarbonil-carbamato de terc-butila:

[383] O ácido bruto **4** foi dissolvido em 8 mL de THF aos quais foram adicionados sucessivamente 4,48 mL de T3P (7,52 mmol, 50% em THF), 1,57 mL de trietilamina (11,2 mmol) e 511 mg de 1-ciclohexilmetilamina (4,51 mmol). A reação foi agitada a 55 graus por 2 hs. A reação foi rapidamente resfriada pela adição de uma solução aquosa de NaOH e EtOAc a 2 M. A fase aquosa foi extraída duas vezes com EtOAc e os extratos orgânicos combinados foram secos sobre sulfato de sódio, filtrados, concentrados e purificados por

cromatografia em coluna. Rendimento: 1.40 g (78% teoricamente).

[384] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, DMSO δ , ppm) 8.60 (t, 1H), 5.81-5.68 (m, 1H), 5.02-4.94 (m, 2H), 3.40 (d, 2H), 3.18 (t, 2H), 1.73-1.44 (m, 7H), 1.37 (s, 18H), 1.25-0.81 (m, 4H).

[385] 5 Etapa (v) = Síntese de N-terc-butoxicarbonil-N- [5- (ciclohexilmetilcarbamoil) -4- (oxiran-2-ilmetil) isotiazol-3-il] carbamato de terc-butila:

[386] A uma solução de 1.0 g de amida **5** (2.08 mmol) em CH_2Cl_2 (20 mL) foram adicionados 2.06 g de m-CPBA (8.34 mmol, 70%). A reação foi agitada à temperatura ambiente por 18 h. A reação foi rapidamente resfriada pela adição de uma solução aquosa de NaOH a 2 M e CH_2Cl_2 . A fase aquosa foi extraída com CH_2Cl_2 duas vezes; os extratos orgânicos combinados foram combinados, secos sobre sulfato de sódio, filtrados, concentrados e purificados por cromatografia em coluna. Rendimento: 0.99 g (83% teoricamente).

[387] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, DMSO δ , ppm) 8.66 (t, 1H), 3.10 (t, 2H), 3.07-3.01 (m, 1H), 2.89-2.87 (m, 2H), 2.72 (t, 1H), 2.44-2.40 (m, 1H), 1.75-1.43 (m, 7H), 1.38 (s, 18H), 1.30-1.09 (m, 4H).

[388] 6 Etapa (vi) = Síntese de N- [7- (ciclohexilmetil) -8-oxo-6H-isotiazol [5,4-c] azepin-3-il] carbamato de terc-butila:

[389] A uma solução 988 mg de epóxido **6** (1.99 mmol) em THF (20 mL) a 0 grau foram adicionados 191 mg de NaH (4.78 mmol, 60% dispersão em óleo). A mistura de reação foi agitada a 0 graus por 30 minutos, depois aquecida à temperatura ambiente por 24 hs. A mistura de reação foi particionada entre uma solução aquosa de HCl 2 M e CH_2Cl_2 . A fase aquosa foi extraída duas vezes com CH_2Cl_2 e os extratos orgânicos combinados foram combinados, secos sobre sulfato de sódio,

filtrados, concentrados e purificados por cromatografia em coluna. Rendimento: 119 mg (14% teoricamente).

[390] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, DMSO δ , ppm) 9.82 (s, 1H), 6.76 (d, 1H), 6.30 (dt, 1H), 3.76 (d, 2H), 3.36 (d, 2H), 1.70-1.55 (m, 5H), 1.43 (s, 9H), 1.31-0.83 (m, 6H).

[391] 7 Etapa (vii) = Síntese de 3-amino-7-(ciclohexilmetil)-6H-isotiazol [5,4-c] azepin-8-ona (composto No. I-04)

[392] À solução de 110 mg de amida 7 (0,29 mmol) em CH_2Cl_2 (3,0 mL) foram adicionados 0,27 mL de TFA (3,5 mmol). A mistura de reação foi então agitada à temperatura ambiente durante 6 hs. A reação foi rapidamente resfriada pela adição de uma solução aquosa saturada de hidrogenocarbonato de sódio e CH_2Cl_2 . A fase aquosa foi extraída duas vezes com CH_2Cl_2 , os extratos orgânicos combinados foram combinados, secos sobre sulfato de sódio, filtrados, concentrados e purificados por cromatografia em coluna. Rendimento: 70 mg (85% teoricamente).

[393] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3 δ , ppm) 6.60 (d, 1H), 6.23 (dt, 1H), 4.52 (br. s, 2H), 3.71 (d, 2H), 3.43 (d, 2H), 1.73-1.48 (m, 6H), 1.28-1.14 (m, 3H), 1.01-0.92 (m, 2H).

[394] 8 Etapa (viii) = Síntese de N-[7-(ciclohexilmetil)-8-oxo-6H-isotiazol [5,4-c] azepin-3-il] -2,2-difluoroacetamida (composto No. I-23)

[395] A uma solução de 28 mg de amina **8** (0.10 mmol) em CH_2Cl_2 foram adicionados 28 μL de trietilamina (0.20 mmol), 1.2 mg de DMAP (0.01 mmol) de 35 mg of difluoroacetic anhydride (0.20 mmol). A mistura de reação foi deixada agitar à temperatura ambiente por 1 h. A mistura de reação foi particionada entre água e CH_2Cl_2 . A fase aquosa foi extraída duas vezes com CH_2Cl_2 , as fases orgânicas combinadas foram secas sobre sulfato de sódio, filtradas,

concentradas e purificadas por cromatografia em coluna. Rendimento: 21 mg (56% teoricamente).

[396] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, CDCl_3 δ , ppm) 8.40 (br. s, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.25 (dt, 1H), 6.07 (t, 1H), 3.77 (d, 2H), 3.44 (d, 2H), 1.75-1.49 (m, 6H), 1.29-1.14 (m, 3H), 1.02-0.96 (m, 2H).

Listas de Pico de NMR

[397]] Lista de picos de NMR para compostos de acordo com a fórmula (G1) no contexto da presente invenção. A numeração refere-se à Tabela 1 acima.

I-04: $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3):

δ = 6.60 (d, 1H), 6.23 (dt, 1H), 4.52 (br. s, 2H), 3.71 (d, 2H), 3.43 (d, 2H), 1.73-1.48 (m, 6H), 1.28-1.14 (m, 3H), 1.01-0.92 (m, 2H).

I-23: $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3):

δ = 8.40 (br. s, 1H), 6.67 (d, 1H), 6.25 (dt, 1H), 6.07 (t, 1H), 3.77 (d, 2H), 3.44 (d, 2H), 1.75-1.49 (m, 6H), 1.29-1.14 (m, 3H), 1.02-0.96 (m, 2H).

I-61: $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3):

δ = 8.86 (br. s, 1H), 6.58 (d, 1H), 6.28 (dt, 1H), 3.77 (d, 2H), 3.45 (d, 2H), 1.75-1.57 (m, 6H), 1.28-1.14 (m, 3H), 1.02-0.93 (m, 2H).

B) Exemplos de Formulação

[398]a) Um pó é obtido misturando 10 partes em peso de um composto da fórmula (G) e 90 partes em peso de talco como substância inerte e triturando a mistura em um moinho de martelo.

[399]b) Um pó molhável que é facilmente dispersável em água é obtido pela mistura de 25 partes em peso de um composto da fórmula (G), 64 partes em peso de quartzo contendo caulim como substância inerte, 10 partes em peso de lignossulfonato de potássio e 1 parte em peso de oleoilmetiltaurato de sódio como agente molhável e dispersante e triturando a mistura em um moinho de discos fixos.

[400]c) Um concentrado de dispersão prontamente dispersível em água é obtido misturando 20 partes em peso de um composto da fórmula (G) com 6 partes em peso de éter alquilfenolpoliglicol (@Triton X 207), 3 partes em peso de poliglicol éter de isotridecanol (8 EO) e 71 partes em peso de óleo mineral parafínico (intervalo de ebulição, por exemplo, entre 255 e acima de 277 ° C) e triturando a mistura em um moinho de esferas até uma finura abaixo de 5 microns.

[401]d) Um concentrado emulsificável é obtido a partir de 15 partes em peso de um composto da fórmula (G), 75 partes em peso de ciclohexanona como solvente e 10 partes em peso de nonilfenol oxietilado como emulsificante.

[402]e) Os grânulos dispersáveis em água são obtidos misturando

75 partes em peso de um composto da fórmula (G),
10 partes em peso de lignosulfonato de cálcio,
5 partes em peso de laurilsulfato de sódio,
3 partes em peso de álcool polivinílico e
7 partes em peso de caolina,

[403] triturando a mistura em um moinho de discos fixos, e granulando o pó em um leito fluidizado por aplicação de água em spray como um líquido de granulação.

[404] f) Grânulos dispersáveis em água também são obtidos por homogeneização e pré-diluição de

partes em peso de um composto da fórmula (G),
partes em peso de 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-
disulfonato de sódio,

partes em peso de sódio oleoilmetil-aurinato,
parte em peso de álcool polivinílico,

17 partes em peso de carbonato de cálcio e

50 partes em peso de água,

[405] em um moinho coloidal, moendo subsequentemente a mistura em um moinho de esferas e atomizando e secando a suspensão resultante em uma torre de pulverização por meio de um bico de única-substância.

[406] Os componentes que podem ser utilizados em combinação com os compostos ativos de acordo com a invenção em formulações mistas ou em misturas de tanques são, por exemplo, compostos ativos conhecidos, conforme descritos em, por exemplo, Weed Research 26, 441-445 (1986), ou "The Pesticide Manual", 16th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2006, e literatura aqui citada, e que por exemplo atuam como inibidores da acetolactato sintase, acetil-CoA-carboxilase, celulose-sintase, enolpiruvilshikimat-3-fosfato-sintase, glutamina-sintetase, p-hidroxifenil-piruvat-dioxigenase, fitoendesatase, fitoendesatase I, fotossistema II, e/ou protoporfirinogênio-oxidase.

(C)Exemplos biológicos

PO												
Número do exemplo	Dosagem	ALOMY	ECHCG	SETVI	ABUTH	AMARE	PHBPU	POLCO	STEME	VIOTR	VERPE	
I-04	320	100	100	90	100	100	100	100	100	100	100	90
I-61	320	90	90	80	80	100	90	100	100	100	100	90
I-25	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	90

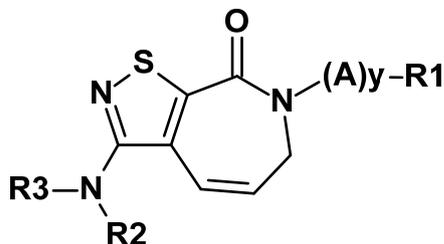
Tabela 1: Pós-emergência

PE														
Número do exemplo	Dosagem	ALOMY	ECHCG	LOLRI	SETVI	ABUTH	AMARE	MATIN	PHBPU	POLCO	STEME	VIOTR	VERPE	HORMU
I-04	320	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	90
I-61	320	90	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100	100
I-25	320	100	100		100	100	100		100	100	100	100	100	

Tabela 2: Pré-emergência

REIVINDICAÇÕES

1. Composto da fórmula (G1) e/ou sais do mesmo, **caracterizado pelo fato de ser da fórmula**



(G1)

em que

A é CR^6R^7 ,

R^1 é hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_2-C_8) -alquenila, (C_2-C_8) -alquinila, $NR^{13}R^{14}$, $R^{13}R^{14}N-(C_1-C_8)$ -alquila, (C_1-C_8) -alcoxi, (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -alcoxi- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alquiltio, (C_1-C_8) -alquilsulfinila, (C_1-C_8) -alquilsulfonila, (C_1-C_8) -alquiltio- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alquilsulfinil- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alquilsulfonil- (C_1-C_8) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_8) -cicloalquenila, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_6) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquenil- (C_1-C_8) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalcoxi, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_8) -alcoxi, arila, aril- (C_1-C_8) -alquila, heteroarila, heteroaril- (C_1-C_8) -alquila, heterociclila, heterociclil- (C_1-C_8) -alquila, ariloxi, heteroariloxi, heterocicliloxi, um resíduo bicíclico ou heterobicíclico, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, oxo, nitro, hidroxila, ciano, $NR^{13}R^{14}$, (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -haloalquila, (C_1-C_8) -alcoxi, (C_1-C_8) -haloalcoxi, (C_1-C_8) -alquiltio, (C_1-C_8) -alquilsulfinila, (C_1-C_8) -alquilsulfonila, (C_1-C_8) -haloalquiltio, (C_1-C_8) -haloalquilsulfinila, (C_1-C_8) -haloalquilsulfonila, (C_1-C_8) -alcoxicarbonila, (C_1-C_8) -haloalcoxicarbonila, (C_1-C_8) -alquilcarboxi, (C_3-C_8) -

cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonila, e em que heterociclila tem grupos oxo q, e em que cada um dos resíduos heterocíclicos acima mencionados, além dos átomos de carbono, possui, respectivamente, membros do grupo consistindo em N(R¹²)_m, O e S(O)_n,

R², R³ são respectivamente independentemente hidrogênio, (C₁-C₈)-alquila, (C₂-C₈)-alquenila, (C₂-C₈)-alquinila, (C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alquilcarbonila, (C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alquilcarbonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonila, (C₂-C₈)-alqueniloxicarbonila, (C₂-C₈)-alquiniloxicarbonila, (C₁-C₈)-alquilcarbonila, (C₂-C₈)-alquenilcarbonila, (C₂-C₈)-alquinilcarbonila, (C₁-C₈)-R¹³R¹⁴N-carbonila, (C₁-C₈)-alquiltio, (C₁-C₈)-alquiltiocarbonila, (C₁-C₈)-alquilsulfinila, (C₁-C₈)-alquilsulfonila, (C₁-C₈)-alquiltio-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alquilsulfinil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alquilsulfonil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alquiltio-(C₁-C₈)-alquilcarbonila, (C₁-C₈)-alquilsulfinil-(C₁-C₈)-alquilcarbonila, (C₁-C₈)-alquilsulfonil-(C₁-C₈)-alquilcarbonila, (C₁-C₈)-alquilcarbonila, (C₂-C₈)-alquenilcarbonila, (C₂-C₈)-alquinilcarbonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonilcarbonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquenila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquilcarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₈)-alquilcarbonila, (C₁-C₈)-alquilcarboniloxi, arila, aril-(C₁-C₈)-alquila, heteroarila, heteroaril-(C₁-C₈)-alquila, heterociclila, heterociclil-(C₁-C₈)-alquila, arilcarbonila,

aril-(C₁-C₈)-alquilcarbonila, heteroarilcarbonila,
 heteroaril-(C₁-C₈)-alquilcarbonila, heterociclilcarbonila, ou
 heterociclil-(C₁-C₈)-alquilcarbonila, em que todos esses
 resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais
 resíduos do grupo que consiste em halogênio, oxo, nitro,
 hidroxila, ciano, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-
 haloalquila, (C₁-C₈)-alcoxi, (C₁-C₈)-haloalcoxi, (C₁-C₈)-
 alquiltio, (C₁-C₈)-alquilsulfinila, (C₁-C₈)-alquilsulfonila,
 (C₁-C₈)-haloalquiltio, (C₁-C₈)-haloalquilsulfinila, (C₁-C₈)-
 haloalquilsulfonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonila, (C₁-C₈)-
 haloalcoxicarbonila, (C₁-C₈)-alquilcarboxi, (C₃-C₈)-
 cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-
 alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila,
 hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonila, e em que
 heterociclila tem grupos oxo q, e em que cada um dos resíduos
 heterocíclicos acima mencionados, além dos átomos de carbono,
 possui, respectivamente, membros do grupo consistindo em
 N(R¹²)_m, O S(O)_n,

ou

NR²R³ é -N=CR⁸R⁹ ou -N=S(O)_nR¹⁰R¹¹,

R⁶, R⁷ são respectivamente
 independentemente hidrogênio, ciano, halogênio, (C₁-C₈)-
 alquila, (C₂-C₈)-alquenila, (C₂-C₈)-alquinila, ou (C₃-C₈)-
 cicloalquila,

ou

R⁶ e R⁷, junto com o átomo de carbono ao qual estão
 ligados, formam um anel carbocíclico ou heterocíclico de 3 -
 6 membros, que compreende respectivamente, além dos átomos de
 carbono, membros do anel p a partir do grupo consistindo em
 N(R¹²)_m, O e S(O)_n e em que o referido anel é não substituído
 ou é substituído por um ou mais resíduos do grupo consistindo
 em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₈)-
 alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₈)-alcoxi, (C₁-C₈)-

haloalcoxi, (C₁-C₈)-alquiltio, (C₁-C₈)-alquilsulfinila, (C₁-C₈)-alquilsulfonila, (C₁-C₈)-haloalquiltio, (C₁-C₈)-haloalquilsulfinila, (C₁-C₈)-haloalquilsulfonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonila, (C₁-C₈)-haloalcoxicarbonila, (C₁-C₈)-alquilarboxi, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonila e tem grupos oxo q,

R⁸, R⁹ são respectivamente independentemente hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₂-C₆)-alquenila, (C₂-C₆)-alquinila, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₂-C₆)-alqueniloxi, (C₂-C₆)-alquinoxil, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₆)-alcoxi-(C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₆)-alcoxi-(C₂-C₆)-alcoxi-(C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₄)-alquiltio-(C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₄)-alquilsulfinil-(C₁-C₃)-alquila, (C₁-C₄)-alquilsulfonil-(C₁-C₃)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquenila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquenal-(C₁-C₈)-alquila, arila, aril-(C₁-C₈)-alquila, heteroarila, heteroaril-(C₁-C₈)-alquila, heterociclila, heterociclil-(C₁-C₈)-alquila, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₈)-alcoxi, (C₁-C₈)-haloalcoxi, (C₁-C₈)-alquiltio, (C₁-C₈)-alquilsulfinila, (C₁-C₄)-alquilsulfonila, (C₁-C₈)-haloalquiltio, (C₁-C₈)-haloalquilsulfinila, (C₁-C₈)-haloalquilsulfonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonila, (C₁-C₈)-haloalcoxicarbonila, (C₁-C₈)-alquilarboxi, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonila e tem grupos oxo q,

ou

R⁸ and R⁹, junto com o átomo de carbono, ao qual estão ligados, formam um anel não saturado, parcialmente saturado ou saturado de 3 a 8 membros, que compreende respectivamente, além dos átomos de carbono, membros do anel p a partir do grupo consistindo em N(R¹²)_m, O e S(O)_n e em que o referido anel é não substituído ou é substituído por um ou mais resíduos do grupo consistindo em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₈)-alcoxi, (C₁-C₈)-haloalcoxi, (C₁-C₈)-alquiltio, (C₁-C₈)-alquilsulfinila, (C₁-C₈)-alquilsulfonila, (C₁-C₈)-haloalquiltio, (C₁-C₈)-haloalquilsulfinila, (C₁-C₈)-haloalquilsulfonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonila, (C₁-C₈)-haloalcoxicarbonila, (C₁-C₈)-alquilcarboxi, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonila e tem grupos oxo q,

R¹⁰, R¹¹ são respectivamente independentemente (C₁-C₈)-alquila, (C₂-C₈)-alquenila, (C₂-C₈)-alquinila, (C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alcoxi-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alquiltio-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alquilsulfinil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alquilsulfinil-(C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquenila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₈)-alquila, arila, aril-(C₁-C₈)-alquila, heteroarila, heteroaril-(C₁-C₈)-alquila, heterociclila ou heterociclil-(C₁-C₈)-alquila, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₈)-alcoxi, (C₁-C₈)-haloalcoxi, (C₁-C₈)-alquiltio, (C₁-C₈)-alquilsulfinila, (C₁-C₈)-alquilsulfonila, (C₁-C₈)-haloalquiltio, (C₁-C₈)-haloalquilsulfinila, (C₁-C₈)-haloalquilsulfonila, (C₁-C₈)-

alcoxicarbonila, (C₁-C₈)-haloalcoxicarbonila, (C₁-C₈)-alquilcarboxi, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonila e em que heterociclila tem grupos oxo q, e em que cada um dos resíduos heterocíclicos acima mencionados, além dos átomos de carbono, possui, respectivamente, membros do grupo consistindo em N(R¹²)_m, O e S(O)_n,

ou

R¹⁰ e R¹¹, juntamente com o átomo de enxofre ao qual estão ligados, formam um anel não saturado, parcialmente saturado ou saturado de 3 a 8 membros, que compreende respectivamente, além dos átomos de carbono e além do átomo de enxofre, membros do anel p do grupo consistindo em N(R¹²)_m, O e S(O)_n e em que o referido anel é não substituído ou é substituído por um ou mais resíduos do grupo consistindo em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NR¹³R¹⁴, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₁-C₈)-alcoxi, (C₁-C₈)-haloalcoxi, (C₁-C₈)-alquiltio, (C₁-C₈)-alquilsulfinila, (C₁-C₈)-alquilsulfonila, (C₁-C₈)-haloalquiltio, (C₁-C₈)-haloalquilsulfinila, (C₁-C₄)-haloalquilsulfonila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonila, (C₁-C₈)-haloalcoxicarbonila, (C₁-C₈)-alquilcarboxi, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alcoxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil-(C₁-C₈)-alquila, R¹³R¹⁴N-carbonila e tem grupos oxo q,

R¹² é hidrogênio, (C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-haloalquila, (C₂-C₈)-alquenila, (C₂-C₈)-haloalquenila, (C₂-C₈)-alquinila, (C₂-C₈)-haloalquinila, (C₃-C₈)-cicloalquila, (C₃-C₈)-halocicloalquila, (C₃-C₈)-cicloalquenila, (C₃-C₈)-cicloalquil-(C₁-C₈)-alquila, (C₃-C₈)-cicloalquenil-(C₁-C₈)-alquila, (C₁-C₈)-alquilcarbonila ou (C₁-C₈)-haloalquilcarbonila,

R^{13} , R^{14} são respectivamente independentemente hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_2-C_8) -alquenila, (C_2-C_8) -alquinila, (C_2-C_8) -alquenilcarbonila, (C_2-C_8) -alquinilcarbonila, (C_1-C_8) -alquilcarbonila, (C_1-C_8) -alquilsulfonila, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_8) -cicloalquenila, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_8) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquenil- (C_1-C_8) -alquila, (C_3-C_8) -cicloalquilcarbonila, (C_3-C_8) -cicloalquenilcarbonila, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_8) -alquilcarbonila, (C_3-C_8) -cicloalquenil- (C_1-C_8) -alquilcarbonila, arila, arilcarbonila, arilsulfonila, hetarila, hetarilcarbonila, hetarilsulfonila, heterociclila, heterociclicarbonila, heterociclicarbonila, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NH_2 , (C_1-C_8) -alquilamina, (C_1-C_8) -dialquilamina, (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -haloalquila, (C_1-C_8) -alcoxi, (C_1-C_8) -haloalcoxi, (C_1-C_8) -alquiltio, (C_1-C_8) -alquilsulfinila, (C_1-C_8) -alquilsulfonila, (C_1-C_8) -haloalquiltio, (C_1-C_8) -haloalquilsulfinila, (C_1-C_8) -haloalquilsulfonila, (C_1-C_8) -alcoxicarbonila, (C_1-C_8) -haloalcoxicarbonila, (C_1-C_8) -alquilcarboxi, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alcoxicarbonil- (C_1-C_8) -alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil- (C_1-C_8) -alquila e em que heterociclila tem grupos oxo q, e em que cada um dos resíduos heterocíclicos acima mencionados, além dos átomos de carbono, possui, respectivamente, membros do grupo consistindo em $N(R^{12})_m$, O e $S(O)_n$,

ou

R^{13} e R^{14} , juntamente com o átomo de nitrogênio, ao qual estão ligados, formam um anel não saturado, parcialmente saturado ou saturado de 3 a 8 membros, que compreende respectivamente, além dos átomos de carbono e além do átomo

de nitrogênio, membros do anel p do grupo consistindo em $N(R^{12})_m$, O and $S(O)_n$ e em que o referido anel é não substituído ou é substituído por um ou mais resíduos a partir do grupo consistindo em halogênio, nitro, hidroxila, ciano, NH_2 , (C_1-C_8) -alquilamina, (C_1-C_8) -dialquilamina, (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -haloalquila, (C_1-C_8) -alcoxi, (C_1-C_8) -haloalcoxi, (C_1-C_8) -alquiltio, (C_1-C_8) -alquilsulfinila, (C_1-C_8) -alquilsulfonila, (C_1-C_8) -haloalquiltio, (C_1-C_8) -haloalquilsulfinila, (C_1-C_8) -haloalquilsulfonila, (C_1-C_8) -alcoxicarbonila, (C_1-C_8) -haloalcoxicarbonila, (C_1-C_8) -alquilcarboxi, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_8) -cicloalquil- (C_1-C_8) -alquila, (C_1-C_8) -alcoxicarbonil- (C_1-C_8) -alquila, hidroxicarbonila, hidroxicarbonil- (C_1-C_8) -alquila e tem grupos oxo q,

n é independentemente selecionado a partir de 0, 1 ou 2,

m é independentemente selecionado a partir de 0 ou 1,

p é independentemente selecionado a partir de 0, 1, 2 ou 3,

q é independentemente selecionado a partir de 0, 1 ou 2,

y é 0 ou 1, 2.

2. Compostos da fórmula (G1) e/ou sais dos mesmos de acordo com a reivindicação 1, **caracterizados pelo fato de** que

A é CR^6R^7 ,

R^1 é hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_2-C_8) -alquenila, (C_2-C_8) -alquinila, (C_1-C_6) -alcoxi, (C_3-C_7) -cicloalquila, (C_3-C_7) -cicloalquenila, piridinila, furanila, tienila, oxanila ou fenila, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do

grupo que consiste em halogênio, oxo, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)-haloalcoxi,

R², R³ são respectivamente independentemente hidrogênio, piridinilcarbonila, furanilcarbonila, tienilcarbonila, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₂-C₆)-alquinilcarbonila, (C₁-C₆)-alquenilcarbonil (C₁-C₆)-alcoxicarbonila, (C₃-C₈)-cicloalquilcarbonila, fenil-(C₁-C₆)-alquilcarbonila, (C₁-C₆)-alquilcarboniloxi em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, oxo, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₁-C₆)-alcoxi,

R⁶, R⁷ são respectivamente independentemente hidrogênio, ciano, halogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₂-C₆)-alquênila, (C₂-C₆)-alquina, ou (C₃-C₈)-cicloalquila,

y é 0 ou 1, 2.

3. Compostos da fórmula (G1) e/ou sais dos mesmos, de acordo com as reivindicações 1 ou 2, **caracterizados pelo fato de** que

A é CR⁶R⁷,

R¹ é H, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, ciclohexila, cicloheptila, ou fenila, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio,

R³ é hidrogênio

R² é hidrogênio ou (C₁-C₄)-alquilcarbonila, em que todos esses resíduos são não substituídos ou substituídos por um ou mais resíduos do grupo que consiste em halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila,

R⁶ é hidrogênio,

R⁷ é hidrogênio ou metila,

y é 0 ou 1.

4. Composição reguladora do crescimento de plantas e/ou herbicida, **caracterizada pelo fato de** que a referida composição compreende um ou mais compostos da fórmula (G1) e/ou sais dos mesmos, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 3,

e uma ou mais substâncias adicionais selecionadas dos grupos (i) e/ou (ii):

(i) uma ou mais substâncias agroquimicamente ativas, preferivelmente selecionadas a partir do grupo consistindo em inseticidas, acaricidas, nematicidas, outros herbicidas, fungicidas, protetores, fertilizantes e/ou outros reguladores de crescimento,

(ii) um ou mais auxiliares de formulação habituais em proteção de culturas.

5. Uso de compostos da fórmula (G1) e/ou sais dos mesmos, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 3 ou composições, como definido na reivindicação 4, **caracterizado por** ser para o controle de plantas prejudiciais ou ao regulamento do crescimento de plantas.

6. Uso de compostos da fórmula (G1) e/ou sais dos mesmos, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 3 ou composições, como definido na reivindicação 4, **caracterizado por ser** para o controle de fungos nocivos fitopatogênicos.

7. Método para controlar fungos, plantas nocivas ou para regular o crescimento de plantas, **caracterizado pelo fato de** que uma quantidade eficaz de

- um ou mais compostos da fórmula (G1) e/ou sais dos mesmos, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 3,

ou

- de uma composição, como definido na reivindicação 4,

é aplicada às plantas, sementes de plantas, solo, no qual ou sobre o qual as plantas crescem ou à área sob cultivo.

RESUMO

NOVOS BICICLOS DE ISOTIAZOL-AZEPINONA, PROCESSOS PARA SUA PREPARAÇÃO E SEU USO COMO HERBICIDAS E/OU REGULADORES DE CRESCIMENTO DE PLANTAS. A invenção refere-se ao campo técnico de herbicidas e/ou reguladores de crescimento de plantas. Especificamente, a invenção refere-se a biciclos de isotiazol-azepinona e composições compreendendo os referidos novos biciclos de isotiazol-azepinona. Além disso, a presente invenção refere-se a processos para a preparação dos referidos novos biciclos de isotiazol-azepinona e seu uso como herbicidas e/ou reguladores de crescimento de plantas.